

Tarifname

FMO3 BASKILAYICI NİTELİĞİ İLE İNSÜLİN HASSASİYETİNİ YÜKSELTEN BİR FORMÜLASYON

5 Teknik Alan

Buluş, FMO3 baskılayıcı niteliği ile insülin hassasiyetini yükseltmeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde İnsülin, moleküler ağırlığı 5,8 kilodalton (kDa) olan, polipeptit yapılı ve vücuttaki karbonhidrat özütürmesinin düzenlenmesinde glukagon ile birlikte rol alan bir hormondur. Kan şekerini düşürücü etki yapar.

15 İnsülinin, karbonhidrat özütürmesinin birincil dengeleyicisi olmanın yanında, karbonhidrat metabolizması ile ilişki içinde bulunan yağ ve protein metabolizmaları üzerinde de önemi vardır ve kandaki insülin derişimi deęişikliklerinin tüm bedende yaygın etkileri bulunur. Bu hormonun tam yokluğu, şeker hastalığının 1. tipine (yüksek şeker); görece azlığı ya da insüline karşı direnç ya da her ikisinin
20 birlikte olması ise 2. tip şeker hastalığına (düşük şeker) yol açar. Bu doğrultuda, endüstriyel olarak üretilmiş olan insülin, tip-1 şeker hastalığında ve başka ilaçların yetersiz kaldığı tip-2 şeker hastalığı vakalarında ilaç olarak kullanılır.

Mevcut teknikte, "EP1741445B1" no'lu, "Dipeptidilpeptidaz-IV inhibitörlerini ve anti-diyabetik maddeleri içeren kombinasyonlar" başlıklı ve "A61K 45/06" tasnif sınıflı
25 buluş, dipeptidilpeptidaz-IV (DPP-IV) aracılı durumların, özellikle de diyabet, tip 2 diabetes mellitus, bozulmuş glikoz toleransı (IGT) durumları, bozulmuş açlık plazma glikozu durumları, metabolik asidoz, ketoz, artrit, obezite ve osteoporoz arasından seçilen bir durumun önlenmesine, ilerlemesinin geciktirilmesine veya tedavi edilmesine yönelik olarak aynı zamanda, ayrı veya ardışık kullanım için, bir DPP-IV
30 inhibitörü ve tercihen insülin sinyal yolak modülatörleri, örneğin protein tirozin fosfatazlar (PT-Pazlar), küçük olmayan moleküllu mimetik bileşikler ve glutamin-fruktoz-6-fosfataz aminotransferaz (GFAT) inhibitörleri, disregüle hepatik glükoz

5 üretimini etkileyen bileşikler, örneğin glükoz-6-fosfataz (G6Paz) inhibitörleri, fruktoz-1,6-bifosfataz (F-1,6-Bpaz) inhibitörleri, glükोजen fosforilaz (GP) inhibitörleri, glukagon reseptör antagonistleri ve fosfoenolpiruvat karboksikinaz (PEPCK) inhibitörleri, piruvat dehidrojenaz kinaz (PDHK) inhibitörleri, insülin hassasiyeti artırıcılar, insülin salgılama artırıcılar, α -glukosidaz inhibitörleri, gastrik boşaltma, insülin inhibitörleri, ve α -adrenerjik antagonistleri arasından seçilen en az bir diğer antidiyabetik bileşiği içeren bir kombinasyonla, ve bu tür bir kombinasyonun, vücut ağırlığının kozmetik açıdan yararlı bir kaybını gerçekleştirmek üzere bir memelinin kozmetik tedavisi için kullanımıyla ilgilidir.

10 Yine, "PCT/US99/10040" no'lu, "Glikoza karşı β -hücre tepkisini arttıran glukagon benzeri peptid-1" başlıklı ve "A61K 38/26" tasnif sınıflı buluş, Zayıflamış glikoz toleransının (IGT) tedavisi için farmasötik bir taşıyıcıdan ve glukagon benzeri peptid-1 için olan bir reseptöre bağlanan bir bileşikten oluşan bir kompozisyon. Mevcut bileşiğin miktarı, IGT'li bir insanda kan glikoz seviyelerine karşı pankreasın β -hücre
15 hassasiyetini arttırmak için gereken etkili miktardır. Keza, IGT'li bir insanda insülin salgılanma tepkilerini düzeltmek için; söz konusu insana farmasötik bir taşıyıcıdan ve glukagon benzeri peptid-1 için olan bir reseptöre bağlanan bir bileşikten oluşan bir kompozisyonun uygulanmasından oluşan bir yöntemde sağlanmaktadır.

20 Sonuç olarak, FMO3 baskılayıcı niteliği ile insülin hassasiyetini yükseltmeye yönelik bir formülasyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

25

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, flavin içeren monooksijenaz (FMO3) tip 3 baskılanmasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, beta-endorfin salınımının yükseltimini sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, cox-2 baskılanmasını sağlamasıdır.

30 Buluşun bir diğer amacı, pge-2 mRNA ekspresyonunun baskılanması sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, FMO3 baskılayıcı niteliği ile insülin hassasiyetini yükseltmeye yönelik; 2-ketometil-simplokomosit, trietilsimplokomosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.

5

Buluşun yapısal ve karakteristik özellikleri ve tüm avantajları aşağıda verilen detaylı açıklama sayesinde daha net olarak anlaşılacaktır ve bu nedenle değerlendirmenin de bu detaylı açıklama göz önüne alınarak yapılması gerekmektedir.

10

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, FMO3 baskılayıcı niteliği ile insülin hassasiyetini yükseltmeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyondur. Söz konusu formülasyon, flavin içeren monooksijenaz tip 3 baskılanmasını, beta-endorfin salınımının yükseltimini, cox-2 baskılanmasını ve pge-2 mRNA ekspresyonunun baskılanmasını sağlamaktadır.

15

Buluş konusu formülasyon; 2-ketometil-simplokomosit, trietilsimplokomosit ihtiva etmektedir.

20

Söz konusu formülasyon, yukarıdaki bileşenlerin aşağıdaki ağırlıkça oranlarda karışımından elde edilmektedir;

% 1-99 oranında 2-ketometil-simplokomosit,

% 99-1 oranında trietilsimplokomosit.

25

Yukarıda verilen bileşenler verilen ağırlıkça oran aralıklarında ve yukarıdaki gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşimlerinden elde edilmektedir.

30

Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu formülasyonun; FMO3 baskılayıcı niteliği ile insülin hassasiyetini yükseltmeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, FMO3 baskılayıcı niteliği ile insülin hassasiyetini yükseltmeye yönelik; 2-ketometil-simplokomosit, trietilsimplokomosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.
5
2. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında 2-ketometil-simplokomosit içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında trietilsimplokomosit içermesidir.
4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 2-ketometil-simplokomosit, trietilsimplokomosit içeren gruptan seçilen, birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; FMO3 baskılayıcı niteliği ile insülin hassasiyetini yükseltmeye yönelik bir formülasyonun üretiminde kullanımındır.
15
20

ÖZET**FMO3 BASKILAYICI NİTELİĞİ İLE İNSÜLİN HASSASİYETİNİ YÜKSELTEN
BİR FORMÜLASYON**

Buluş, FMO3 baskılayıcı niteliği ile insülin hassasiyetini yükseltmeye yönelik
5 oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.