

Tarifname

ERK BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN ANTI-KARSİNOJENİK GİPENOLİN TÜREVLERİNİ İÇEREN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, ERK baskılamaya yönelik oluşturulmuş, anti-karsinojenik gipenolin türevlerini içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde anser oluşumunu engelleyen veya tümörün büyümesini önlemek üzere anti-karsinojenik bileşenler mevcuttur.

Mevcut teknikte yer alan, EP1881826B1 no'lu, " A61K 31/404" tasnif sınıflı ve " Prostaglandin E2 (PGE2) üretimi ile ilişkili bir rahatsızlığın tedavisi için 3-aminokarbazolün bir benzoil türevinin kullanımı" başlıklı buluş, 3-Aminokarbazolün bir benzoil türevinin enflamatuar süreçler, ağrı, ateş, tümörler, Alzheimer hastalığı ve aterosklerozdan oluşan gruptan seçilen bir rahatsızlığın önlenmesi veya terapötik tedavisi için bir ilacın üretiminde kullanımı. Enflamatuar süreçler, ağrı, ateş, tümörler, Alzheimer hastalığı ve aterosklerozdan oluşan gruptan seçilen bir rahatsızlığın önlenmesi veya terapötik tedavisi için buluşa göre olan 3-aminokarbazolün bir benzoil türevinin terapötik olarak etkili bir miktarının bir bireye uygulandığı bir usul ile ilgilidir.

Yine, EP2282994B1 no'lu, ve " 3-aminokarbazol bileşiği, bunu içeren farmasötik bileşim ve bunun hazırlanma usulü" başlıklı buluş, yeni 3-aminokarbazol bileşiklere, bunları içeren farmasötik bir bileşime, bunların hazırlanmasına yönelik bir usule, ve prostaglandin E2 (PGE2) üretimiyle ilgili rahatsızlıkların, örneğin enflamatuar süreçler, ağrı, ateş, tümörler, Alzheimer hastalığı ve aterosklerozun tedavisinde yararlı olan bir ilacın üretimi için bu tür bileşiklerin kullanımına ilişkindir. Daha özel haliyle, bu buluş prostaglandin E2 (PGE2) üretimiyle ilgili rahatsızlıkları, örneğin enflamatuar süreçler, ağrı, ateş, tümörler, Alzheimer hastalığı ve aterosklerozu tedavi

etmek veya önlemek için yararlı olan 3-aminokarbazolün yeni benzoil türevlerine ilişkindir.

Yine, EP1443942B1 no'lu, ve " Bir bisfosfonat, bir cox-2 inhibitörü ve bir taksolden oluşan bir kombinasyon içeren, habis hastalıkların tedavisinde kullanım için 5 farmasötik kompozisyon" başlıklı buluş, prostat kanserinin, multipl myelomun (MM), tümörün neden olduğu hipertansiyonun (TIH), meme kanseri, akciğer kanseri, kolon kanseri ya da prostat kanseri ile ilişkilendirilen kemik metastazının (BM) tedavisi için içerisinde bir bisfosfonat, bir COX-2 inhibitörü ve bir taksol ya da bunların türevini içeren farmasötik bir kompozisyon ile ilgilidir.

10 Yine, EP1443967B1 no'lu, ve " Siklooksijenaz-2 inhibitörü/histon deasetilaz inhibitörü kombinasyonu" başlıklı buluş, (a) bir siklooksijenaz-2 inhibitörünü ("COX-2 inhibitörü") ve (b) bir histon deasetilaz inhibitörünü ("HDAI") içeren bir kombinasyon ile ilgi olup, söz konusu kombinasyon, bu bağlamda, eşanlı, birlikte, ayrı veya sıralı şekilde ve özellikle de bir memelide ve hatta insandaki pre-malign kolon lezyonları 15 veya kolon kanseri ya da diğer habis durumlara karşı kullanılmasıyla ilgilidir

Sonuç olarak, ERK baskılamaya yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

20

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, ERK baskılama sağlamasıdır.

25 Buluşun bir diğer amacı, fosfoinozid-3 kinaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, PGE-2 baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, COx-2 baskılama sağlamasıdır.

30

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş,

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.

5

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, ERK baskılamaya yönelik oluşturulmuş, anti-karsinojenik gipenolin türevlerini içeren bir kompozisyonudur. Söz konusu buluş, ERK baskılama, fosfoinozid-3 kinaz baskılama, PGE-2 baskılama ve COx-2 baskılama sağlamaktadır.

10

Buluş konusu kompozisyon; (4Z)-N-(2-florofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-metil-1-piranozil)karbonil]-2H-dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-2H-gipenolin, (3Z)-N-(2-aminofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-metil-1-piranozil)karbonil]-2H-dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-2H-gipenolin ihtiva etmektedir.

15

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

% 99-1 oranında (4Z)-N-(2-florofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-metil-1-piranozil)karbonil]-2H-dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-2H-gipenolin,

20

% 1-99 oranında (3Z)-N-(2-aminofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-metil-1-piranozil)karbonil]-2H-dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-2H-gipenolin.

25

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

Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; ERK baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, ERK baskılamaya yönelik; (4Z)-N-(2-florofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-
5 metil-1-piranozil)karbonil]-2H-dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-
2H-gipenolin, (3Z)-N-(2-aminofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-metil-1-
piranozil)karbonil]-2H-dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-2H-
gipenolin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar
halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
- 10 2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında
(4Z)-N-(2-florofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-metil-1-piranozil)karbonil]-2H-
dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-2H-gipenolin içermesidir.
- 15 3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında
(3Z)-N-(2-aminofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-metil-1-piranozil)karbonil]-2H-
dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-2H-gipenolin içermesidir.
- 20 4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; (4Z)-N-(2-florofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-
metil-1-piranozil)karbonil]-2H-dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-
2H-gipenolin, (3Z)-N-(2-aminofenil)-3-[[3,5-dimetil-4-[(4-metil-1-
piranozil)karbonil]-2H-dikumaroil]metilen]-2,3-dihidro-N-metil-4-okso-2H-
gipenolin içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde
edilen bileşimlerin; ERK baskılamaya yönelik kompozisyonun üretiminde
kullanımıdır.

ÖZET**ERK BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN ANTI-KARSİNOJENİK GİPENOLİN
TÜREVLERİNİ İÇEREN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, ERK baskılamaya yönelik oluşturulmuş, anti-karsinojenik gipenolin türevlerini içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15