

Tarifname

MMP-9 SALINIM VE SALGILANMASINI BASKILAMAYA YÖNELİK BİR FORMÜLASYON

5

Teknik Alan

Buluş, mmp-9 salınım ve salgılanmasını baskılamaya yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde matriks metalloproteinaz(MMP); Ekstraselüler matriksi(proteinlerini) parçalama ve yeniden işleme özelliğine sahip, bazı ortak özellikleri paylaşan en az 28 üyeli sekrete edilebilen veya transmembran özelliği olan bir grup enzimdir. Bunların en az 22 üyesi insan dokularında ekspresse edilir. Bu enzimlerin ortak özellikleri; sinyal peptit (predomain), prodomain, katalitik domainlere sahip olmalarıdır. Bu enzimlerin en az 8 adedi (MMP,3,7,8,10,12,13,20) kromozom 11 de kümelenmiştir.

Mevcut teknikte, " WO 2000/009485" no'lu, " MMP İnhibitörleri olarak hidroksi piperolat hidroksamik asit türevleri" başlıklı ve " C07D 211/96" tasnif sınıflı buluş, Matris metaloproteinaz ya da memelide reprotisin aktivitesi ile karakterize edilen arterit, kanser ve diğer hastalıkların oluşturduğu gruptan seçilmiş bir durumun tedavisinde faydalı ve R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R9 ve Ar' nin yukarıda tanımlandığı gibi olduğu formül (I)' e ait bileşik. Ayrıca mevcut buluşa ait bileşikler, standart steroidal olmayan anti-iltihabik ilaçlarla (NSAID' ler), COX-2 önleyicileriyle ve analjeziklerle kombinasyon terapi halinde, ve adriamisin, danomisincis-platinyum, etoposif, taksol, taksoter ve vinkristin gibi diğer alkaloidlerle kombinasyon halinde kanser tedavisinde kullanılabilir.

Yine, " WO 1998/050351" no'lu, " Yeni sistein türevleri, bunların üretimi için işlemler ve bunları ihtiva eden farmasötik maddeler" başlıklı ve " C07C 323/60" tasnif sınıflı buluş, Matris metaloproteinazlarını (MMPIler) bağlayan ve engelleyen, (I) genel

formülü tarafından temsil edilen bir bileşik, bu bileşiğin farmasötik açıdan kabul edilebilir tuzları ya da optik olarak aktif biçimleri, bu bileşikte, sistein parçası bir korunmamış tiol grubunu ihtiva etmektedir; bu bileşiklerin hazırlanması için işlemler, bu bileşikleri ihtiva eden farmasötik bileşimler ve bu bileşimlerin tıpta kullanımı.

5 Yine, " EP1542977B1" no'lu, " Metaloproteinaz MMP12 inhibitörü olarak 2,5-dioksoimidazolin-4-il asetamid'ler ve analogları" başlıklı ve "" tasnif sınıflı buluş, L, X, Y, Z1, Z2, R1, R2, R3 ve G2 'nin açıklamalarda verilen anlamlara sahip olduğu (I) formülüne sahip bileşikler; bunlar için hazırlanış yöntemi; bunları ihtiva eden farmasotik kompozisyonlar; farmasotik kompozisyonlar için bir hazırlanış yöntemi; ve
10 bunların tedavide kullanılmasını kapsar. Buluşa uygun bileşikler MMP12 metaloproteinaz inhibitorüdürler ve diğer faydalarının yanında obstrüktif solumun yolu hastalıklarının, örneğin astım ve kronik obstrüktif pulmoner hastalığının (COPD) tedavisinde faydalıdır.

Yine, " EP2254908B1" no'lu, " Metalloproteinaz inhibitörlerini içeren kozmetik veya
15 farmasötik bileşimler" başlıklı ve " C07K 14/81" tasnif sınıflı buluş, R1AA1-AA2-AA3-AA4-R2 genel formülüne (I) sahip peptitler, stereoizomerleri, karışımları veya kozmetik veya farmasötik olarak kabul edilebilir tuzları, bunları elde etme adımlarını içeren bir yöntem, bunları içeren kozmetik veya farmasötik bir bileşim ve matriks metalloproteinaz (MMP) aşırı ekspresyonundan veya MMP aktivitesindeki artıştan
20 kaynaklanan cilt, mukoza ve/veya kafatası derisi hastalıkları, düzensizlikleri ve/veya patolojilerine yönelik bir tedavideki kullanımı açıklanır.

Sonuç olarak, mmp-9 salınım ve salgılanmasını baskılamaya yönelik bir formülasyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

25

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir
30 amacı, mmp-9 salınımını baskılamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, mmp-9 salgılanmasını baskılamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, nf-kappab ekspresyonunu baskılamasıdır.

5 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, mmp-9 salınım ve salgılanmasını baskılamaya yönelik; 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol, (3 β ,5 β)-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- β -D-heksapiranosil- β -D-dietilpiranosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.

10 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.

15 **Buluşun Detaylı Açıklaması**

Buluş, mmp-9 salınım ve salgılanmasını baskılamaya yönelik oluşturulmuş bir formülasyondur. Söz konusu formülasyon, mmp-9 salınımını baskılar, mmp-9 salgılanmasını baskılar, nf-kappab ekspresyonunu baskılar.

20

Buluş konusu formülasyon; 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol, (3 β ,5 β)-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- β -D-heksapiranosil- β -D-dietilpiranosit ihtiva etmektedir.

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

% 99-1 oranında 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol,

% 1-99 oranında (3 β ,5 β)-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- β -D-
30 heksapiranosil- β -D-dietilpiranosit.

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 formülasyonun; mmp-9 salınım ve salgılanmasını baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, mmp-9 salınım ve salgılanmasını baskılamaya yönelik; 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol, (3 β ,5 β)-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- β -D-heksapiranosil- β -D-dietilpiranosit 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 % 99-1 oranında 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında (3 β ,5 β)-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- β -D-heksapiranosil- β -D-dietilpiranosit içermesidir.
15
4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol, (3 β ,5 β)-19,20-trimetoksidamar-24-en-3-kumaroil 2-O- β -D-heksapiranosil- β -D-dietilpiranosit içeren gruptan seçilen, birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; mmp-9 salınım ve salgılanmasını baskılamaya yönelik formülasyonun üretiminde kullanımıdır.
20

ÖZET**MMP-9 SALINIM VE SALGILANMASINI BASKILAMAYA YÖNELİK BİR
FORMÜLASYON**

5

Buluş, mmp-9 salınım ve salgılanmasını baskılamaya yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir. Söz konusu formülasyon, mmp-9 salınımını baskılar, mmp-9 salgılanmasını baskılar, nf-kappab ekspresyonunu baskılar.

10 Şekil yoktur.

15