

## Tarifname

### CDC25 FOSFATAZ VE CDC/2 SİKLİN B KİNAZ AKTİVİTELERİNİ BASKILAMAYA YÖNELİK BİR FORMÜLASYON

5

#### Teknik Alan

Buluş, cdc25 fosfataz ve cdc/2 siklin b kinaz aktivitelerini baskılamaya yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

10

#### Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde fosfataz, bir substrattan hidrolizle fosfat grubunu ayıran enzim grubudur. Mevcut teknikte, " EP1633754B1" no'lu, " Protein tirozin fosfataz inhibitörleri olarak diaminopirrolokinazolin bileşikleri" başlıklı ve " C07D 487/04" tasnif sınıflı buluş, diaminopirrolokinazolin bileşiklerine ilişkin olup, bu bileşikler protein tirozin fosfatazları, özellikle PTP1B bileşiğini inhibe etmede ve memelilerin kanındaki glikoz yoğunluğunu düşürmede faydalıdır. Bu bileşikler ve bunların farmasötik açıdan kabul edilebilir tuzları formül I bileşiğine uygundurlar.

Yine, " EP2125744B1" no'lu, " Sikloamin yerleştirilmiş izokuinolon ve izokuinolinon türevleri" başlıklı ve " A61K 31/472" tasnif sınıflı buluş, Rho-kinaz ve/veya Rho-kinaz vasıtasıyla oluşan miyosin hafif zincir fosfatazın fosforilasyonu ile ilişkili hastalıkların tedavisinde ve/veya önlenmesinde yararlı, 6-yerleştirmeli izokuinolin ve izokuinolinon türevleriyle, ve bu bileşikleri içeren bileşimlerle ilgilidir.

Yine, " EP1741445B1" no'lu, " Dipeptidilpeptidaz-IV inhibitörlerini ve anti-diyabetik maddeleri içeren kombinasyonlar" başlıklı ve " A61K 45/06" tasnif sınıflı 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 inhibitörü ve tercihen insülin sinyal yolak modülatörleri, örneğin protein tirozin fosfatazlar (PT-Pazlar),

küçük olmayan molekülü mimetik bileşikler ve glutamin-fruktoz-6-fosfataz aminotransferaz (GFAT) inhibitörleri, disregüle hepatik glükoz üretimini etkileyen bileşikler, örneğin glükoz-6-fosfataz (G6Paz) inhibitörleri, fruktoz-1,6-bifosfataz (F-1,6-Bpaz) inhibitörleri, glükojen fosforilaz (GP) inhibitörleri, glukagon reseptör antagonistleri ve fosfoenolpiruvat karboksik kinaz (PEPCK) inhibitörleri, piruvat dehidrojenaz kinaz (PDHK) inhibitörleri, insülin hassasiyeti artırıcılar, insülin salgılama artırıcılar,  $\alpha$ -glukosidaz inhibitörleri, gastrik boşaltma, insülin inhibitörleri, ve  $\beta$ -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.

Sonuç olarak, cdc25 fosfataz ve cdc/2 siklin b kinaz aktivitelerini baskılamaya yönelik bir formülasyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

15

### **Buluşun Amacı**

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, rad3 ilişkili (ATR) kinaz aktivasyonu kabiliyeti vesilesi ile cdc25 fosfataz baskılayıcı nitelik sergilemesidir.

Buluşun bir diğer amacı, cdc/2 siklin B kinaz baskılayıcı nitelik sergilemesidir.

25 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, cdc25 fosfataz ve cdc/2 siklin b kinaz aktivitelerini baskılamaya yönelik; 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol, 3,,5-metoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-tetrakumaroil](E)-3-(3,4-metoksifenil)prop-4-enoat içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.

30

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, cdc25 fosfataz ve cdc/2 siklin b kinaz aktivitelerini baskılamaya yönelik oluşturulmuş bir formülasyondur. Söz konusu formülasyon, rad3 ilişkili (ATR) kinaz 10 aktivasyonu kabiliyeti vesilesi ile: cdc25 fosfataz baskılayıcı nitelik sergiler, cdc/2 siklin B kinaz baskılayıcı nitelik sergiler.

Buluş konusu formülasyon; 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3- 15 heksafenilprop-2-en-1-triol, 3,5,7-metoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-tetrakumaroil](E)-3-(3,4-metoksifenil)prop-4-enoat ihtiva etmektedir.

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- 20 heksafenilprop-2-en-1-triol,  
% 1-99 oranında 3,5,7-metoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-tetrakumaroil](E)-3-(3,4-metoksifenil)prop-4-enoat.

Yukarıda verilen bileşenler verilen ağırlıkça oran aralıklarında ve yukarıdaki gruptan 25 seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşimlerinden elde edilmektedir.

Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu formülasyonun; cdc25 fosfataz ve 30 cdc/2 siklin b kinaz aktivitelerini baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

**İSTEMLER**

1. Buluş, cdc25 fosfataz ve cdc/2 siklin b kinaz aktivitelerini baskılamaya yönelik;  
5 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol, 3,5,7-metoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-tetrakumaroil](E)-3-(3,4-metoksifenil)prop-4-enoat içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir formülasyondur.
2. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 1-[2-  
10 trihidroksi-4-metoksi-3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol içermesidir.
3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında  
15 3,5,7-metoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-tetrakumaroil](E)-3-(3,4-metoksifenil)prop-4-enoat içermesidir.
4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 1-[2-trihidroksi-4-metoksi-  
20 3-(3-etilbüt-2-en-1-il)difenil]-3-heksafenilprop-2-en-1-triol, 3,5,7-metoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-tetrakumaroil](E)-3-(3,4-metoksifenil)prop-4-enoat içeren gruptan seçilen, birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; cdc25 fosfataz ve cdc/2 siklin b kinaz aktivitelerini baskılamaya yönelik formülasyonun üretiminde kullanımındır.

**ÖZET****CDC25 FOSFATAZ VE CDC/2 SİKLİN B KİNAZ AKTİVİTELERİNİ BASKILAMAYA  
YÖNELİK BİR FORMÜLASYON**

5

Buluş, cdc25 fosfataz ve cdc/2 siklin b kinaz aktivitelerini baskılamaya yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir. Söz konusu formülasyon, rad3 ilişkili (ATR) kinaz aktivasyonu kabiliyeti vesilesi ile: cdc25 fosfataz baskılayıcı nitelik sergiler, cdc/2 siklin B kinaz baskılayıcı nitelik sergiler.

10

Şekil yoktur.

15