

Tarifname

AURORA A KİNAZ FOSFORİLASYONUNUN BASKILANMASI İLE ANTI-KARSİNOJENİK ETKİ GÖSTERMEYE YÖNELİK BİR FORMÜLASYON

5

Teknik Alan

Buluş, aurora a kinaz fosforilasyonunun baskılanması ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde Fosforilasyon, bir fosfat grubunun organik moleküle bağlanmasıdır.

Fosforilasyon 5 farklı şekilde gerçekleşir: Oksidatif fosforilasyon, gıdaların oksidasyonu sonucu ATP'nin olduğu metabolik yoldur. Fotofosforilasyon, hücrelerde ışık enerjisi ile ATP üretimidir. Substrat düzeyinde fosforilasyon, reaktif bir ara üründen ADP'ye fosfat grubu aktarımı ile ATP'nin üretildiği bir kimyasal reaksiyondur. Protein fosforilasyonu, proteinlerde serin, treonin veya tirozin kalıntılarına, bir kinaz enzimi aracılığıyla bir fosfat grubunun eklenmesidir. Kimyada, fosforik asidin esterlerine organofosfat denir.

20

Mevcut teknikte, " EP1746097B1" no'lu, " 1,4-dihidropiridin birleştirilmiş heterosikller, bunların hazırlanışına yönelik süreçler, bunların kullanımı ve bileşimleri" başlıklı ve " C07D 471/14" tasnif sınıflı buluş, 1,4-Dihidropiridin birleştirilmiş heterosikller, bunların hazırlanışına yönelik süreç, bunların kullanımı ve bunları içeren bileşimler. Bu buluş kanser hastalığının tedavisinde, özellikle de kanserli hücrelerin bölünmesinin önlenmesinde yararlı yer değiştirme grubu yerleştirilmiş dihidropiridin birleştirilmiş heterosikller hakkındadır. Bu bileşikler a Aurora A ve/veya B kinaz inhibitörleri olarak etki ederler.

25

Yine, " EP2432766B1" no'lu, " Anti-kanser bileşik ve onu ihtiva eden farmasötik kompozisyon" başlıklı ve " C07D 235/26" tasnif sınıflı buluş, (1) formülüne sahip bileşik ile ilgilidir : daha özellikle legovir fomidir (Ia), özellikle metanol içerisinde 0,698 mg/ml konsantrasyonda rotatif kabiliyeti]= -38,6+/-07?dir. Bileşik baz veya bir

30

asit, özellikle farmasötik olarak kabul edilebilir bir asit eklenti tuzu halindedir. Bu bileşik Aurora A ve B kinazların selektif bir inhibitörüdür. Antikanser olarak kullanılabilir.

Yine, " EP1648426B1" no'lu, " Benzimidazol türevleri ve bunların protein kinazların inhibitörleri olarak kullanımı" başlıklı ve " A61K 31/4184" tasnif sınıflı buluş, kinazlar aracılı kanser gibi hastalık durumlarının ve vakalarının tedavisinde kullanılmaya yönelik olarak siklin bağımlı kinazların, glikojen sentaz kinaz-3'ün ve Aurora kinazların inhibitörleri şeklinde aktiviteye sahip bileşikler sağlar. Bu bileşikler, genel formüle (I) sahiptir; burada X, CR<5> veya N'dir; A, bir bağ veya -(CH₂)_m-(B)_n'dir; B, R'nin hidrojen veya isteğe bağlı olarak hidroksi veya C1-4 alkoksi ile süstitüe edilen C1-4 hidrokarbil olduğu C=O, NR(C=O) veya O(C=O)'dur; m, 0, 1 veya 2'dir; n, 0 veya 1'dir; R<0>, hidrojendir veya var olduğunda NR ile birlikte p'nin 2 ila 4 olduğu -(CH₂)_p- grubunu oluşturur; R<1>, hidrojen, 3 ila 12 halka üyesine sahip bir karbosiklik veya heterosiklik grup veya isteğe bağlı olarak süstitüe edilmiş C1-8 hidrokarbil grubudur; R <2>, hidrojen, halojen, metoksi veya isteğe bağlı olarak halojen, hidroksil veya metoksi ile süstitüe edilmiş bir C1-4 hidrokarbil grubudur; R<3> ve R<4>, eklendikleri karbon atomları ile birlikte N, O ve S'den seçilen 3 heteroatom olabilen 5 ila 7 halka üyesine sahip isteğe bağlı olarak süstitüe edilmiş kaynaşık karbosiklik veya heterosiklik bir halka oluşturur ve R<5>, hidrojen, bir R<2> grubu veya R<10>'un, halojen, hidroksi, triflorometil, siyano, nitro, karboksi, amino, mono- veya di-C1-4 hidrokarbilamino, 3 ila 12 halka üyesine sahip karbosiklik ve heterosiklik grup, R'nin bir bağ, O, CO, X<1>C(X<2>), C(X<2>)X<1>, X<1>C(X<2>)X<1>, S, SO, SO₂, NR, SO₂NR veya NRSO₂ olduğu ve R'nin, hidrojen, 3 ila 12 halka üyesine sahip karbosiklik ve heterosiklik grup ve hidroksi, okso, halojen, siyano, nitro, karboksi, amino, mono- veya di-C1-4 hidrokarbilamino, 3 ila 12 halka üyesine sahip karbosiklik ve heterosiklik gruplardan seçilen isteğe bağlı olarak bir veya daha fazla süstitüent ile süstitüe edilmiş bir C1-8 hidrokarbil grubundan seçildiği bir R-R grubundan seçilen bir R<10> grubudur ve burada C1-8 hidrokarbil grubunun bir veya daha fazla karbon atomu isteğe bağlı olarak, O, S, SO, SO₂, NR, X<1>C(X<2>), C(X<2>)X veya X<1>C(X<2>)X<1> ile değiştirilebilir; R, hidrojen ve C1-4 hidrokarbilden seçilir ve X<1>, O, S veya NR'dir ve X<2>, =O, =S veya =NR'dir. Aynı zamanda formüle (I), bileşiklerin tuzları, solvatları ve N-oksitleri de dahil edilir.

Sonuç olarak, aurora a kinaz fosforilasyonunun baskılanması ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik bir formülasyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

5

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, aurora A kinaz fosforilasyonunu baskılamasıdır.

10

Buluşun bir diğer amacı, pge-1 üretimini teşvik etmesidir.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, aurora a kinaz fosforilasyonunun baskılanması ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik; 3,5,7-pentametoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-il](E)-3-(3,4-hidroksifenil)prop-2-enoat, 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.

20 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.

25 Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, aurora a kinaz fosforilasyonunun baskılanması ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik bir formülasyondur. Söz konusu formülasyon, aurora A kinaz fosforilasyonunu baskılar, pge-1 üretimini teşvik eder.

30

Buluş konusu formülasyon; 3,5,7-pentametoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-il](E)-3-(3,4-hidroksifenil)prop-2-enoat, 3,5,7-metoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-tetrakumaroil](E)-3-(3,4-metoksifenil)prop-4-enoat ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 3,5,7-pentametoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-il](E)-3-(3,4-hidroksifenil)prop-2-enoat,

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

10 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; aurora a kinaz fosforilasyonunun baskılanması ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

15

İSTEMLER

1. Buluş, aurora a kinaz fosforilasyonunun baskılanması ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik; 3,5,7-pentametoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-il](E)-3-(3,4-hidroksifenil)prop-2-enoat, 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.
5
2. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında 3,5,7-pentametoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-il](E)-3-(3,4-hidroksifenil)prop-2-enoat içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir formülasyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 3,5,7-metoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-tetrakumaroil](E)-3-(3,4-metoksifenil)prop-4-enoat içermesidir.
15
4. Buluş, 2-3 no'lu istemlerden herhangi birindeki gibi; 3,5,7-pentametoksi-6-hidroksiloksan-2-il]dioksioksan-3-il](E)-3-(3,4-hidroksifenil)prop-2-enoat, 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; aurora a kinaz fosforilasyonunun baskılanması ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik formülasyonun üretiminde kullanımındır.
20
25

ÖZET**AURORA A KİNAZ FOSFORİLASYONUNUN BASKILANMASI İLE ANTI-KARSİNOJENİK ETKİ GÖSTERMEYE YÖNELİK BİR FORMÜLASYON**

5

Buluş, aurora a kinaz fosforilasyonunun baskılanması ile anti-karsinojenik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir formülasyon ile ilgilidir. Söz konusu formülasyon, aurora A kinaz fosforilasyonunu baskılar, pge-1 üretimini teşvik eder.

10 Şekil yoktur.

15