

Tarifname

YENİ ANTI-BAKTERİYEL NİTELİK GÖSTEREN İZOTERİSİN TÜREVLERİ İÇEREN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, anti-bakteriyel etki göstermeye anti-bakteriyel etki göstermeye yönelik oluşturulmuş izoterisin türevleri ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde, penisilin keşfedilmeden önce bakteri enfeksiyonlarıyla savaşmak için elimizde çok az ilaç vardı. Bununla birlikte, günümüzde, bakteri enfeksiyonlarını tedavi etmek için birçok antibiyotik bulunmakta ve sürekli yenileri keşfedilmektedir.

15 Antibakteriyel ilaçların, hepsini olmasa da, çoğunu antibiyotikler (mikroorganizmalardan elde edilirler) oluşturmaktadır. Bazıları sentetik kimyasal maddelerdir. Bütün antibakteriyel ilaçların istenmeyen ve bazen ciddi yan etkileri vardır.

Mevcut teknikte, TR2003/01596 no'lu, "Uzun etki süreli antibakteriyel-antibiyotik kompozisyonları" başlıklı ve "A61P" tasnif sınıflı buluş, bir tabakasında amoksisillin trihidrat veya bunun tuzu ile klavulanat ikinci tabakasında amoksisillin trihidrat veya bunun tuzunu içeren çift tabakalı tablet formülasyonlar ile ilgilidir. Bu buluşla geliştirilen uzun etki süreli antibakteriyel-antibiyotik kompozisyonlar, aktif madde olarak B-laktam antibiotik ve B-laktamaz inhibitör içeren, B-laktam antibiyotik olarak amoksisillin veya ampisillin ve B-laktamaz inhibitörler olarak klavulanik asit veya 25 sulbaktam, tercihan amoksisillin ve klavulanik asit içeren ayrıca ilaç taşıyıcı sistemine daha ileri ve isteğe bağlı çeşitli farmasötik ajanlar olarak riboflavin, folik asit, askorbik asit, tiamin veya tokoferol veya bunların karışımı gibi vitaminler katılmış olması ile karakterize edilmektedir.

30 Yine, PCT/IN2010/000468 no'lu, " Topikal aplikasyonlarda kullanılan yeni, sinerjik farmasötik bir bileşik " başlıklı buluş, profilaksi, yara ya da yanık yarası tedavisi, deri döküntüsü, basınç ülser, diyabetizm ile alakalı ayak ülseri ve burada açıklanmakta

olan diğer deri hastalıklarının tedavisinde topikal olarak uygulanan geniş spektrumlu farmasötik bir bileşik Burada anlatılmakta olan formüle sahip olan bileşik, krem, jel veya sıvı formunda olabilir Buluşta bahsedilmekte olan yeni sinerjik bileşikte, en az üç adet sinerjik olarak aktif içerik maddesi ve en az bir adet de inaktif içerik maddesi bulunmaktadır Sinerjik olarak aktif içerik maddeleri arasında bir veya daha fazla geniş spektrumlu baktensidal madde, yine bir veya daha fazla geniş spektrumlu bakteriyostatik madde ve mitojenik büyüme faktörü bulunmaktadır. İnaktif içerik maddeleri, bir baz, permeabilite değeri ya da formulasyon stabilitesi ortaya koymak durumundadır ve taşıyıcı, koruyucu, emülgatör, cilt merhemi, yumuşatıcı veya diğer katkı maddelerini içermektedir.

Sonuç olarak, anti-bakteriyel etki göstermeye yönelik bir kompozisyona 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, deoksiadenozin metilaz baskılama sağlamasıdır.

20 Buluşun bir diğer amacı, DNaB Helikaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, DNaC helikaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, aminoglukosit-3"-Adeniltransferaz baskılama sağlamasıdır.

25

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, anti-bakteriyel etki göstermeye yönelik;

(4S,10R)-2-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-asetamid-2-ketoetilpropanoil)pirrolidin-4-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-ketoetil-1,4,7,10,14,16,20,22,26,28,31-oksofenil-izoterisin, (3S,10R)-1-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-dikloro-2-dietilpropanoil)pirolidin-2-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-dekametil-1,4,7,10,13,16,20,22,25,28,31-florofenil-izoterisin

içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

- 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.

Buluşun Detaylı Açıklaması

- 10 Buluş, anti-bakteriyel etki göstermeye yönelik oluşturulmuş izoterisin türevleri ihtiva eden bir kompozisyonudur. Söz konusu kompozisyon; Deoksiadenozin metilaz baskılama, DNaB Helikaz baskılama, DNaC helikaz baskılama ve aminoglukosit-3'-Adeniltransferaz baskılama sağlamaktadır.
- 15 Buluş konusu kompozisyon; (4S,10R)-2-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-asetamid-2-ketoetilpropanoil)pirrolidin-4-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-ketoetil-1,4,7,10,14,16,20,22,26,28,31-oksofenil-izoterisin, (3S,10R)-1-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-dikloro-2-dietilpropanoil)pirolidin-2-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-dekametil-1,4,7,10,13,16,20,22,25,28,31-florofenil-izoterisin
- 20 ihtiva etmektedir.

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

- 25 % 1-99 oranında (4S,10R)-2-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-asetamid-2-ketoetilpropanoil)pirrolidin-4-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-ketoetil-1,4,7,10,14,16,20,22,26,28,31-oksofenil-izoterisin,
- 30 % 99-1 oranında (3S,10R)-1-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-dikloro-2-dietilpropanoil)pirolidin-2-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-dekametil-1,4,7,10,13,16,20,22,25,28,31-florofenil-izoterisin.

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

- 5 Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; anti-bakteriyel etki göstermeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, anti-bakteriyel etki göstermeye yönelik; (4S,10R)-2-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-asetamid-2-ketoetilpropanoil)pirrolidin-4-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-ketoetil-1,4,7,10,14,16,20,22,26,28,31-oksofenil-izoterisin, (3S,10R)-1-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-dikloro-2-dietilpropanoil)pirolidin-2-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-dekametil-1,4,7,10,13,16,20,22,25,28,31-florofenil-izoterisin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında (4S,10R)-2-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-asetamid-2-ketoetilpropanoil)pirrolidin-4-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-ketoetil-1,4,7,10,14,16,20,22,26,28,31-oksofenil-izoterisin içermesidir.
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça (3S,10R)-1-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-dikloro-2-dietilpropanoil)pirolidin-2-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-dekametil-1,4,7,10,13,16,20,22,25,28,31-florofenil-izoterisin içermesidir.
4. Buluş, istem 1 ila 4'te bahsedilen; (4S,10R)-2-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-asetamid-2-ketoetilpropanoil)pirrolidin-4-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-ketoetil-1,4,7,10,14,16,20,22,26,28,31-oksofenil-izoterisin, (3S,10R)-1-((S)-1-((6S,12S,14S,21S,30S)-1-((R)-1-(2-dikloro-2-dietilpropanoil)pirolidin-2-il)-15-(3-kloro-3-okso(fenil)-30-florobütil-21-isometil-3,3,6,9,10,16,16,24,24,33,33-dekametil-1,4,7,10,13,16,20,22,25,28,31-florofenil-izoterisin içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; anti-bakteriyel etki göstermeye yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındadır.

ÖZET**YENİ ANTI-BAKTERİYEL NİTELİK GÖSTEREN İZOTERİSİN TÜREVLERİ İÇEREN
BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, anti-bakteriyel etki göstermeye anti-bakteriyel etki göstermeye yönelik oluşturulmuş izoterisin türevleri ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15