

Tarifname

HEMAGLÜTİNİN ESTERAZ BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN PİKRORETOSİT TÜREVLERİNİ İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON VE BU 5 KOMPOZİSYONUN VİRAL ENFEKSİYONLARIN TEDAVİSİNDE KULLANIMI

Teknik Alan

Buluş, hemaglütininin esteraz baskılamaya yönelik, pikroretosit türevlerini ihtiva eden bir kompozisyon ve bu kompozisyonun viral enfeksiyonların tedavisinde kullanımı ile
10 ilgilidir.

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde hemaglütinin, grip (influenza) virüsünün zarfında bulunan bir
15 glikoproteindir. virüsün hücreye tutunmasını sağlar. grip aşıları bu moleküllerine karşı geliştirilmiştir. hemaglütinin antijeninin yalnızca h1, h2, h3 tiplerini taşıyan virüslerin insanda grip hastalığına ve salgılarına yol açtığı bilinir.

Esteraz, esterleri bir su molekülü ile kimyasal tepkimeye sokarak onlardan bir asit ve bir alkol molekülü üreten, hidrolaz tipi bir enzimdir.
20 Çeşitli substrat spesifisiteleri, protein yapıları ve biyolojik işlevleri olan farklı esteraz tipleri vardır.

Mevcut teknikte, EP2175881B1 no'lu, " İntradermal yoldan yapılan grip aşısı " başlıklı buluş, insanlara intradermal yoldan verilen ilaçların yapımı için virozom bazlı grip
25 aşılanna ilişkindir. Buluş semm dönüşüm oranlarına, GMT'nin kaç misli arttığına ve koruma oranlarına göre bağışıklık cevabını yerine getiren bir virozomal preparatta düşük dozlarda hemaglütinin antijeni (HA) içeren (üç değerlikli) bileşimleri sağlar.

Yine, WO 1998/051304 no'lu, " Viral enfeksiyonlar ve kanser tedavisinde benzimidazol-2-karbamatların kullanımı " başlıklı buluş, Memelilerde tümör ve kanserlerin büyümesini engelleyen viral enfeksiyonların tedavisinde kullanılacak
30 fungusit ihtiva eden bir farmasötik bileşim ifşa edilmiştir. Kullanılan özel fungusit aşağıdaki formüle haiz bir benzimidazol türevidir. Bu formülde R, H, karboksil (-CO₂H), hidroksil, amino veya R'nün, alkoksi, haloalkil, alkenil arasından seçildiği

esterler (-CO₂R') veya alkil gurupları 1-8 karbon içeren sikloalkil veya n'nin 1 ila 3 arasında olduğu CH₃CH₂(OCH₂CH₂)_n- veya CH₃CH₂CH₂(OCH₂CH₂)_n- veya (CH₃)₂CH-(OCH(CH₃)CH₂)_n- veya bunların farmasötik olarak etkin organik veya inorganik tuzları veya bunların karışımlarının oluşturduğu guruptan seçilir.

5 Yine, WO 1997/005873 no'lu, " Viral enfeksiyonların tedavisinde flukonazol kullanımı " başlıklı buluş, Memelilerde kanserlerin ya da tümörlerin iyileştirilmesi için bir farmasötik bileşim anlatılmıştır, bu bileşim, 2-(2,4-diflüorofenil) -1,3-bis(1H-1,2,4-triazol-1-il) propan-2-ol ve türevlerini içermektedir. Bir kemoterapik madde, kuvvetlendirici maddeler olarak 2-(2,4-diflüorofenil)-1,3-bis (1H-1,2,4-triazol-1-
10 il)propan-2-ol ve türevleri ile birlikte kullanılabilir. 2-(2,4-diflüorofenil) -1,3-bis(1H-1,2,4-triazol-1-il) propan-2-ol ve türevleri, aynı zamanda, diğer anti-viral maddeler ile birlikte, tek başına ya da bir kuvvetlendirici madde ile viral enfeksiyonların iyileştirilmesi için de kullanılabilir.

Yine, EP1835937B1 no'lu, " Viral enfeksiyon tedavisine yönelik bileşimler ve
15 yöntemler " başlıklı buluş, İnhibitör nk hücre reseptörlerini bloke eden bileşikler kullanılarak viral hastalığın tedavi edilmesi ve böylelikle de enfekte hedef hücrelerin öldürülmesinde nk hücre sitotoksitesinin inhibisyonunun düşürülmesi yöntemleri açıklanmaktadır. Bir düzenlemede bileşik, örneğin insan kir2dl1, kir2dl2 ve kir2dl3 reseptörlerinden biri veya birkaçı gibi bir antikor bağlayıcıdır. Başka bir düzenlemede
20 bu yöntem ayrıca, virüs ile enfekte olan hücreler üzerinde ifade edilen bir antijeni bağlayan bir füzyon proteini veya terapötik bir antikor uygulanmasını içerir.

Sonuç olarak, hemaglutininin esteraz baskılamaya yönelik bir kompozisyona 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 amacı, hemaglutininin esteraz baskılama sağlamasıdır.

30 Buluşun bir diğer amacı, tirozin kinaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, RNA polimeraz baskılama sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, hemaglütinin esteraz baskılamaya yönelik; N-(6-hegzaetoksifenil)-4-(2-dimetilfloro[1,2-a]piridin-3-il)-pikroretosit, N-(4-etoksifenil)-4-(2-fenilkloro[1,2-a]piridin-4-il)-pikroretosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

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

Buluş, hemaglütinin esteraz baskılama niteliği sergileyen pikroretosit türevlerini ihtiva eden bir kompozisyon ve bu kompozisyonun viral enfeksiyonların tedavisinde kullanımınıdır. Söz konusu buluş, hemaglütinin esteraz baskılama, tirozin kinaz baskılama ve RNA polimeraz baskılama sağlamaktadır.

Buluş konusu kompozisyon; N-(6-hegzaetoksifenil)-4-(2-dimetilfloro[1,2-a]piridin-3-il)-pikroretosit, N-(4-etoksifenil)-4-(2-fenilkloro[1,2-a]piridin-4-il)-pikroretosit ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında N-(6-hegzaetoksifenil)-4-(2-dimetilfloro[1,2-a]piridin-3-il)-pikroretosit,

% 99-1 oranında N-(4-etoksifenil)-4-(2-fenilkloro[1,2-a]piridin-4-il)-pikroretosit.

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; hemaglütinin esteraz baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, hemaglütinin esteraz baskılamaya yönelik; N-(6-hegzaetoksifenil)-4-(2-dimetilfloro[1,2-a]piridin-3-il)-pikroretosit, N-(4-etoksifenil)-4-(2-fenilkloro[1,2-a]piridin-4-il)-pikroretosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
5
2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında N-(6-hegzaetoksifenil)-4-(2-dimetilfloro[1,2-a]piridin-3-il)-pikroretosit içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında N-(4-etoksifenil)-4-(2-fenilkloro[1,2-a]piridin-4-il)-pikroretosit içermesidir.
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; N-(6-hegzaetoksifenil)-4-(2-dimetilfloro[1,2-a]piridin-3-il)-pikroretosit, N-(4-etoksifenil)-4-(2-fenilkloro[1,2-a]piridin-4-il)-pikroretosit içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; hemaglütinin esteraz baskılamaya yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
15
20

ÖZET**HEMAGLÜTİNİN ESTERAZ BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN
PİKRORETOSİT TÜREVLERİNİ İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON VE BU
5 KOMPOZİSYONUN VİRAL ENFEKSİYONLARIN TEDAVİSİNDE KULLANIMI**

Buluş, hemaglütininin esteraz baskılamaya yönelik, pikroretosit türevlerini ihtiva eden bir kompozisyon ve bu kompozisyonun viral enfeksiyonların tedavisinde kullanımı ile ilgilidir.

10

Şekil yoktur.

15