

Tarifname

RNA HELİKAZ BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN SİMPLORASEMOSİN TÜREVLERİNİ İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON VE BU KOMPOZİSYONUN ANTI-VİRAL TEDAVİ OLARAK KULLANIMI

Teknik Alan

Buluş, RNA helikaz baskılamaya RNA helikaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş simplorasemosin türevlerini ihtiva eden bir kompozisyon ve bu kompozisyonun anti-viral tedavi olarak kullanımını bir kompozisyon ile ilgilidir.

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde helikazlar, tüm canlılar için hayati önem taşıyan bir enzim sınıfıdır. Nükleik asitlerin fosfodiester omurgası üzerinde hareket ederek birbirlerine hidrojen bağlarıyla bağlanmış nükleik asit ipliklerini (DNA'nın, RNA'nın veya RNA-DNA hibritlerinin) ayrıştırır. Bunun için ATP hidrolizinden açığa çıkan enerjiyi kullanır. Hemaglutinin ise, grip (influenza) virüsünün zarfında bulunan bir glikoproteindir. virüsün hücreye tutunmasını sağlar. grip aşılı bu moleküllerine karşı geliştirilmiştir. hemaglutinin 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. Çeşitli substrat spesifisiteleri, protein yapıları ve biyolojik işlevleri olan farklı esteraz tipleri vardır.

Mevcut teknikte EP2364166B1 no'lu "Kanserin baskılanması" başlıklı ve "A61K 38/48" tasnif sınıflı buluş, kanserin ve kanserle ilgili sağlık sorunlarının baskılanmasında kullanım için elverişli polipeptidlerle ilgilidir. Tedavide, kanser hücrelerine hedeflendirilen sitotoksik olmayan bir proteazdan yararlanır, bu proteaz bu şekilde ulaştırıldıktan sonra enternalize edilir ve kanser hücrelerinden salgılanmayı inhibe eder.

Sonuç olarak RNA helikaz baskılamaya yönelik bir kompozisyona 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, RNA helikaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, Proteaz baskılama sağlamasıdır.

10 Buluşun bir diğer amacı, RNA replikaz baskılama sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, 2-(1H-glukopiranozil-4-il)-6-[[4-(metilsülfonil)-1-hekzakumaroil]metil]-4-(4-diklorofenil)-tieno[3,2-d]-simplorasemosin-fenil-ester, 2-(1H-ramnozül-2-il)-6-[[4-(dimetilsülfonil)-1-monokumaroil]metil]-4-(4-morfolinil)-tieno[3,2-d]-propionil-simplorasemosin-etil-ester içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

15

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.

20

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, RNA helikaz baskılamaya RNA helikaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş simplorasemosin türevlerini ihtiva eden bir kompozisyon ve bu kompozisyonun anti-viral tedavi olarak kullanımı bir kompozisyonudur. Söz konusu kompozisyon, RNA helikaz baskılama, proteaz baskılama ve RNA replikaz baskılama sağlamaktadır.

25

Buluş konusu kompozisyon, 2-(1H-glukopiranozil-4-il)-6-[[4-(metilsülfonil)-1-hekzakumaroil]metil]-4-(4-diklorofenil)-tieno[3,2-d]-simplorasemosin-fenil-ester, 2-

(1H-ramnozil-2-il)-6-[[4-(dimetilsülfonil)-1-monokumaroil]metil]-4-(4-morfolinil)-tieno[3,2-d]-propionil-simplorasemosin-etil-ester ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 2-(1H-glukopiranozil-4-il)-6-[[4-(metilsülfonil)-1-hekzakumaroil]metil]-4-(4-diklorofenil)-tieno[3,2-d]-simplorasemosin-fenil-ester,

% 99-1 oranında 2-(1H-ramnozil-2-il)-6-[[4-(dimetilsülfonil)-1-monokumaroil]metil]-4-(4-morfolinil)-tieno[3,2-d]-propionil-simplorasemosin-etil-ester.

10

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

15 Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; RNA helikaz baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, RNA helikaz baskılamaya yönelik; 2-(1H-glukopiranozil-4-il)-6-[[4-(metilsülfonil)-1-hekzakumaroil]metil]-4-(4-diklorofenil)-tieno[3,2-d]-
5 simplorasemosin-fenil-ester, 2-(1H-ramnozil-2-il)-6-[[4-(dimetilsülfonil)-1-monokumaroil]metil]-4-(4-morfolinil)-tieno[3,2-d]-propionil-simplorasemosin-etil-ester içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.
- 10 2. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 1-99 oranında 2-(1H-glukopiranozil-4-il)-6-[[4-(metilsülfonil)-1-hekzakumaroil]metil]-4-(4-diklorofenil)-tieno[3,2-d]-simplorasemosin-fenil-ester içermesidir.
- 15 3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 2-(1H-ramnozil-2-il)-6-[[4-(dimetilsülfonil)-1-monokumaroil]metil]-4-(4-morfolinil)-tieno[3,2-d]-propionil-simplorasemosin-etil-ester içermesidir.
- 20 4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 2-(1H-glukopiranozil-4-il)-6-[[4-(metilsülfonil)-1-hekzakumaroil]metil]-4-(4-diklorofenil)-tieno[3,2-d]-simplorasemosin-fenil-ester, 2-(1H-ramnozil-2-il)-6-[[4-(dimetilsülfonil)-1-monokumaroil]metil]-4-(4-morfolinil)-tieno[3,2-d]-propionil-simplorasemosin-etil-ester içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; RNA helikaz baskılamaya yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.

ÖZET**RNA HELİKAZ BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN SİMPLORASEMOSİN
TÜREVLERİNİ İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON VE BU KOMPOZİSYONUN
ANTI-VİRAL TEDAVİ OLARAK KULLANIMI**

5

Buluş, RNA helikaz baskılamaya RNA helikaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş simplorasemosin türevlerini ihtiva eden bir kompozisyon ve bu kompozisyonun anti-viral tedavi olarak kullanımı bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Şekil yoktur.

15