

Tarifname

H3K27 METİLASYONUNU BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN SORİNİN TÜREVLERİNİ İÇEREN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, H3K27 metilasyonunu baskılamaya yönelik oluşturulmuş, sorinin türevlerini içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde histonlar, okaryotik hücrelerin çekirdeğinde yer alan ve DNA'nin nuklezomlar halinde paketlenmesini sağlayan, lizin ve arjinince zengin olan bazik proteinlerdir. H3K9 ve H3K27 histonları genellikle inaktivasyonla ilişkilidir. (22)

15

Histonların metilasyonu ise hem aktif hem de inaktif kromatin bölgelerinde yer almaktadır. Histon H3'un amino terminalindeki 9. lizinin metilasyonu (H3-9K) DNA'nin sessizleştirmesine yol açmakta ve heterokromatik bölgelere yayılmaktadır. Diğer yandan, histon H3 proteininin 4. lizinin (H3-4K) metilasyonu aktivasyonla ilişkili olup ağırlıklı olarak aktif genlerin promotor bölgelerinde yer almaktadır. Spermatogenez

20

strasında histonların kuyruklarının metilasyonu H3-K4 ve H3-K9 metiltransferaz tarafından gerçekleştirilmektedir.

25

Mevcut teknikte yer alan, EP1869185B1 no'lu, "C12N 15/62 " tasnif sınıflı ve "Kanser tedavisi için P21 proteinini içeren konjugat" başlıklı buluş, P21 proteini kanser tedavisinde bir ilaç olarak kullanılır. Bir konjugat, P21 proteinini veya bunun bir homoloğunu veya işlevsel fragmanını içeren bir ilk bölgeyi; ve bir translokasyon faktörünü içeren ikinci bir bölgeyi içerir.

30

Yine, EP1539796B1 no'lu, ve "Anti-inflamatuar veya anti-alerjik androstan kompleksleri" başlıklı buluş, Kristal kafesin, misafir bir molekül varlığıyla stabilize edildiği bir formül (I) bileşiği içeren kristalli kimyasal bir kompleks sağlanır; bu, kristalli kompleksin, 120K'de belirlendiğinde yaklaşık $7.6 \pm 0.6 \text{ \AA}$, $12.7 \pm 0.7 \text{ \AA}$ ve $33 \pm 3 \text{ \AA}$ 'lık birim hücre ebatlarına sahip P212121 boşluk grubundan oluşmasıyla karakterize edilir.

Yine, TR 1998/02649 no'lu, ve "Sikline bağılı kinazların inhibitörleri için bağlama eşleri" başlıklı buluş, selüler protein p27'yi önleyen ve bu şekilde p27 ile etkilenen hücre proliferasyon önlenmesini kaldıran bir protein, bunun kısmen egemen etkileyici karakterlere sahip mutantları, bunlar için uygun şekilde nükleik asitler ve protein ve nükleik asitlerin hastalıkların önlenmesi ve tedavi için kullanımı ile ilgilidir. Buluş ayrıca hastalıkların gen tedavisi için nükleik asitler ihtiva eden nükleik asit yapıları açıklanmaktadır.

Sonuç olarak, H3K27 metilasyonunu baskılamaya yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, H3K27 metilasyonunu baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, p21 ekspresyonunu artırma sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, p27 ekspresyonunu artırma sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, FBX032 ekspresyonunu artırma sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, H3K27 metilasyonunu baskılamaya yönelik; 3,4-dimetil- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin, 3,7-hidroksimetil-- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyondur.

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, H3K27 metilasyonunu baskılamaya yönelik oluşturulmuş, sorinin türevlerini içeren bir kompozisyonudur. Söz konusu buluş, H3K27 metilasyonunu baskılama, p21 ekspresyonunu artırma, p27 ekspresyonunu artırma ve FBX032 ekspresyonunu artırma sağlamaktadır.

Buluş konusu kompozisyon; 3,4-dimetil- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin, 3,7-hidroksimetil-- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 3,4-dimetil- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin,

% 99-1 oranında 3,7-hidroksimetil-- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin.

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

20 Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; H3K27 metilasyonunu baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, H3K27 metilasyonunu baskılamaya yönelik; 3,4-dimetil- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin, 3,7-hidroksimetil-- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin içeren
5 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 3,4-dimetil- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin içermesidir.
10
 3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 3,7-hidroksimetil-- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin içermesidir.
 4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 3,4-dimetil- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin, 3,7-hidroksimetil-- α -[2-(metilfloro)etil]-sorinin içeren gruptan seçilen birey ya da
15 kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; H3K27 metilasyonunu baskılamaya yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
- 20

ÖZET**H3K27 METİLASYONUNU BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN SORİNİN
TÜREVLERİNİ İÇEREN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, H3K27 metilasyonunu baskılamaya yönelik oluşturulmuş, sorinin türevlerini içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15