

Tarifname

ANTI-VİRÜTİK ETKİ GÖSTEREN SENTETİK BİLEŞENLER İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, anti-virütik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

10 Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde EP1441735B1 no'lu, "HIV integraz'ın N-süstitüe edilmiş hidroksipirimidinon karboksamid inhibitörleri" başlıklı buluş, Formül (I) e sahip N-süstitüe edilmiş 5-hidroksi-6-okzo-1,6-dihidropirimidin-4-karboksamidler, HIV integrazın inhibitörleri ve HIV replikasyonunun inhibitörleri olarak tarif edilmişlerdir; burada R1, R2, R3 ve R4, tarifnamede tanımlandığı gibidir. Bu bileşikler, HIV enfeksiyonunun önlenmesi ve tedavisinde ve AIDS'in önlenmesi, başlamasının geciktirilmesi ve tedavi edilmesinde yararlıdır. Bu bileşikler, HIV enfeksiyonuna ve AIDS'e karşı oldukları şekilde bileşikler olarak veya farmasötik açıdan kabul edilebilir tuzları halinde kullanılırlar. Bu bileşikler ve bunların tuzları, isteğe bağlı olarak başka antivirütik maddeler, immünomodülatörler, antibiyotikler veya aşılarla kombinasyon halinde, farmasötik terkipler içinde bileşenler olarak kullanılabilirler. Ayrıca AIDS'i önleme, tedavi etme veya başlamasını geciktirme usulleri ve HIV enfeksiyonunu önleme veya tedavi etme usulleri de tarif edilmiştir.

Yine, EP1265873B1 no'lu, " Antivirütik maddeler olarak 4-okso-1,4-dihidro-3-sinnolinkarboksamidler" başlıklı buluş, antivirütik maddeler olarak (örneğin herpes ailesi virüslerine karşı etkili maddeler olarak) yeni sinnolinler sağlar.

Yine, EP1274713B1 no'lu ve " Antivirütik pirimidin nükleosid analogları " başlıklı buluş, Formül (I) e sahip bir bileşik olup; burada Ar, süstitüe edilmiş olabilen bir altı üyeli aromatik halkadan veya iki kaynaşık altı üyeli aromatik halkadan oluşan bir aromatik halka sistemidir; R8 ve R9 dan herbiri, hidrojen, alkil, sikloalkil, halojenler, amino, alkilamino, nitro, siyano, alkiloksi, ariloksi, tiol, alkiltiol, ariltiol ve arilden seçilir; Q, O, S ve CY2'den seçilir; X, O, NH, S, N-alkil, (CH₂)_m ve CY2 den seçilir; Z, O,

NH, S, N-alkilden seçilir; U", H dir ve U', H ve CH₂T den seçilir, veya U' ve U", Q yu içeren, (a) ve (b) den seçilmiş bir halka oluşturmak üzere birleştirilmiştir; diğer değişkenler tarifnamede tarif edildiği gibidir; ancak şu şartla ki T,OAc olduğu ve T' ile T" nün mevcut ve H olduğu durumda, Ar, 4-(2-benzoksazolil)fenil değildir. Bu bileşikler, örneğin varicelle zoster virüsüne karşı antivirütik aktivite gösterirler.

Sonuç olarak, anti-virütik etki göstermeye yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

10

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, RNA replikaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, nöraminidaz baskılama sağlamasıdır.

15 Buluşun bir diğer amacı, integraz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, RNA polimeraz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, proteaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, DNA giraz baskılama sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, anti-virütik etki göstermeye yönelik; 5-
20 [(3S)-3-trihidroksi-4-difenil-1-büten-1-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit, 3-
[(3S)-3-trimetoksi-4-difenil-1-büten-2-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyondur.

25 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, anti-virütik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir kompozisyonudur. Söz konusu buluş; RNA replikaz baskılama, nöraminidaz baskılama, integras baskılama, RNA polimeraz baskılama, proteaz baskılama, DNA giraz baskılama sağlamaktadır.

10

Buluş konusu kompozisyon; 5-[(3S)-3-trihidroksi-4-difenil-1-büten-1-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit, 3-[(3S)-3-trimetoksi-4-difenil-1-büten-2-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 5-[(3S)-3-trihidroksi-4-difenil-1-büten-1-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit,

15

% 99-1 oranında 3-[(3S)-3-trimetoksi-4-difenil-1-büten-2-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit.

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; anti-virütik etki göstermeye yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, anti-virütik etki göstermeye yönelik; 5-[(3S)-3-trihidroksi-4-difenil-1-büten-1-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit, 3-[(3S)-3-trimetoksi-4-difenil-1-büten-2-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit 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 5-[(3S)-3-trihidroksi-4-difenil-1-büten-1-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 3-[(3S)-3-trimetoksi-4-difenil-1-büten-2-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit içermesidir.
15
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 5-[(3S)-3-trihidroksi-4-difenil-1-büten-1-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit, 3-[(3S)-3-trimetoksi-4-difenil-1-büten-2-il]1-[6-(2H-tetrazol-5R-il)heksil]-protobiosit içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; anti-virütik etki göstermeye yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
20

ÖZET**ANTI-VİRÜTİK ETKİ GÖSTEREN SENTETİK BİLEŞENLER İHTİVA EDEN BİR
KOMPOZİSYON**

5

Buluş, anti-virütik etki göstermeye yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10