

Tarifname

RNA HELİKAZ BASKILAMA NİTELİĞİ İLE ANTI-VİRÜTİK ETKİ GÖSTEREN SİMPLORASEMOSİT ANALOGLARI İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, RNA helikaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş, anti-virütik etki gösteren simplorasemosit analogları ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

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) ayırır. Bunun için ATP hidrolizinden açığa çıkan enerjiyi kullanır. Hemaglutinin ise, grip (influenza) virüsünün zarfında bulunan bir glikoproteindir. virüsün hücreye tutunmasını sağlar. grip aşısı bu moleküllerine karşı geliştirilmiştir. hemaglutinin antijeninin yalnızca h1, h2, h3 tiplerini taşıyan virüslerin insanda grip hastalığına ve salgılarına yol açtığı bilinir.

15 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.

25

Yine, EP1349457B1 no'lu, " Sıvı antimikrobik bileşimler " başlıklı buluş, sıvı antimikrobik bir bileşim, iyodür anyonunun ve tiyosiyanat anyonunun bir karışımını; periyodik asit veya periyodik asidin alkali metal tuzunu; ve opsiyonel olarak peroksidaz ihtiva eder. Bileşim mikrobisid, dezenfektan olarak veya virüsleri ya da sporları baskılamak veya yok etmek için kullanılabilir.

30

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 her biri, 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 5 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, RNA helikaz baskılamaya yönelik bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı 10 zorunlu kılmıştır.

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir 15 amacı, rna helikaz baskılamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, dna giraz baskılamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, hemaglütininin esteraz sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, RNA helikaz baskılamaya yönelik; 2- 20 deoksi-2-[(7-nitro-2,2,4-benzokzadiazol-5-il)amin]-D-simplorasemosit, 2,2- deoksi-3- [(7-nitro-2,1,3-metoksipropionil-2-il)amin]-8-simplorasemosit, 4-[4-[(4'-amino[1,1'- bifenil]-2-il)metil]-1-piperazinil]-N-[[4-[[[(1R)-3-(dimetilamin)-1-[(feniltio)etil]laroil]amin]- 3-nitrofenil]sülfonil-simplorasemosit-etil ester 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, RNA helikaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş, anti-virütik etki gösteren simplorasemosit analogları ihtiva eden bir kompozisyondur. Söz konusu kompozisyon, rna helikaz baskılama, dna giraz baskılama, hemaglütinin esteraz 5 sağlamaktadır.

Buluş konusu kompozisyon; 2-deoksi-2-[(7-nitro-2,2,4-benzokzadiazol-5-il)amin]-D-simplorasemosit, 2,2- deoksi-3-[(7-nitro-2,1,3-metoksipropionil-2-il)amin]-8-simplorasemosit, 4-[4-[(4'-amino[1,1'-bifenil]-2-il)metil]-1-piperazinil]-N-[[4-[[[(1R)-3-(dimetilamin)-1-[(feniltio)etil]laroil]amin]-3-nitrofenil]sülfonil-simplorasemosit-etil ester 10 ihtiva etmektedir.

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

% 12-26 oranında 2-deoksi-2-[(7-nitro-2,2,4-benzokzadiazol-5-il)amin]-D-simplorasemosit, 15

% 57-13 oranında 2,2- deoksi-3-[(7-nitro-2,1,3-metoksipropionil-2-il)amin]-8-simplorasemosit,

% 31-61 oranında 4-[4-[(4'-amino[1,1'-bifenil]-2-il)metil]-1-piperazinil]-N-[[4-[[[(1R)-3-(dimetilamin)-1-[(feniltio)etil]laroil]amin]-3-nitrofenil]sülfonil-simplorasemosit-etil ester.

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

25 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-deoksi-2-[(7-nitro-2,2,4-benzokzadiazol-5-il)amin]-D-simplorasemosit, 2,2- deoksi-3-[(7-nitro-2,1,3-
5 metoksipropionil-2-il)amin]-8-simplorasemosit, 4-[4-[(4'-amino[1,1'-bifenil]-2-
il)metil]-1-piperazinil]-N-[[4-[[(1R)-3-(dimetilamin)-1-[(feniltio)etil]laroil]amin]-3-
nitrofenil]sülfonil-simplorasemosit-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 % 12-26 oranında 2-
deoksi-2-[(7-nitro-2,2,4-benzokzadiazol-5-il)amin]-D-simplorasemosit
içermesidir.
- 15
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 57-13 oranında
2,2- deoksi-3-[(7-nitro-2,1,3-metoksipropionil-2-il)amin]-8-simplorasemosit
içermesidir.
- 20
4. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 31-61 oranında 4-
[4-[(4'-amino[1,1'-bifenil]-2-il)metil]-1-piperazinil]-N-[[4-[[(1R)-3-(dimetilamin)-1-
[(feniltio)etil]laroil]amin]-3-nitrofenil]sülfonil-simplorasemosit-etil ester
içermesidir.
- 25
5. Buluş, istem 1 ila 4'te bahsedilen; 2-deoksi-2-[(7-nitro-2,2,4-benzokzadiazol-5-
il)amin]-D-simplorasemosit, 2,2- deoksi-3-[(7-nitro-2,1,3-metoksipropionil-2-
il)amin]-8-simplorasemosit, 4-[4-[(4'-amino[1,1'-bifenil]-2-il)metil]-1-piperazinil]-
N-[[4-[[(1R)-3-(dimetilamin)-1-[(feniltio)etil]laroil]amin]-3-nitrofenil]sülfonil-
simplorasemosit-etil ester içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar
halinde elde edilen bileşimlerin; RNA helikaz baskılamaya yönelik
kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
- 30

ÖZET**RNA HELİKAZ BASKILAMA NİTELİĞİ İLE ANTI-VİRÜTİK ETKİ GÖSTEREN
SİMPLORASEMOSİT ANALOGLARI İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, RNA helikaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş, anti-virütik etki gösteren simplorasemosit analogları ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15