

Tarifname

DNA TOPOİZOMERAZ BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN SENTETİK PİKRORETOSİT TÜREVLERİ İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, DNA topoizomeraz baskılamaya yönelik oluşturulmuş, sentetik pikroretosid türevleri ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde, deoksiribonükleik asit veya kısaca DNA, tüm organizmalar ve bazı virüslerin canlılık işlevleri ve biyolojik gelişmeleri için gerekli olan genetik talimatları taşıyan bir nükleik asittir. DNA'nın başlıca rolü bilginin uzun süreli saklanmasıdır. Topoizomeraz, (tip 1: 5.99.1.2 tip 2: 5.99.1.3) DNA'nın topolojisinde görülen bir izomeraz enzimidir. Topoizomerazlar hem nükleaz hem de ligaz etkinliğine sahiptir. Bu proteinler DNA'daki süperburulma derecesini değiştirirler. Bu enzimlerin bazıları DNA sarmalının bir ipliğini kesip bunun öbürü etrafında dönmesini sağlar, sonra da DNA'daki kesiği tekrar birleştirir. Bu enzimlerin diğerleri ise DNA sarmalının bir ipliğini kesip öbür ipliğin bu kesiğin içinden kesmesini sağlarlar, sonra kesiği tekrar birleştirirler. Topoizomerazlar DNA'yla ilgili pek çok süreçte yer alırlar, DNA ikileşmesi ve transkripsiyonu gibidir.

Mevcut teknikte yer alan, EP2138490B1 no'lu, " Florokinolonların sentezinin yeni prosesi " başlıklı ve " C07D 403/04 " tasnif sınıflı buluş, Formül (I) florokinolon bileşiğinin ve/veya asit veya baz ekleme tuzlarının hazırlanması şunları içerir; ikame edilmiş kinolin bileşiğinin (II) suda bir amin bileşiği (A1) ile tepkimeye sokulması, ve tercihe bağlı olarak elde edilen bileşiğin (I) ayrılması Formül (I) florokinolon bileşiğinin ve/veya asit veya baz ekleme tuzlarının hazırlanması şunları içerir; formül (II)'ye sahip ikame edilmiş kinolin bileşiğinin suda (R 3R 4NH) formüllü bir amin bileşiği (A1) ile tepkimeye sokulması, ve tercihe bağlı olarak elde edilen bileşiğin (I) ayrılması R 1H, alkil veya NRR1a; R 2F, ya R 3, R 4(siklo)alkil, aralkil (isteğe bağlı olarak OH veya NRR1a ile ikame edilmiştir), H veya OH; veya NR 3R 4heterosiklo (isteğe bağlı

olarak alkil, OH, alkoksi, -C(=O)alkil, NRR1a, =NOR, aralkil veya (hetero)anl ile ikame edilmiştir, burada alkil veya (hetero)aril grupları isteğe bağlı olarak alkil, halo, perfloroalkil, alkoksi veya NRR1a ile ikame edilmiştir), R 5alkil, ani (isteğe bağlı olarak halo veya OH ile ikame edilmiş), H, sikloalkil, NR(CHO) veya NRR1a, X . CR 8 veya N, ya R 8H, halo, alkil veya alkoksi, veya R 8R 5heterosiklo (isteğe bağlı olarak alkil ile ikame edilmiş), R, R1a - H veya alkil, R 6halo, ve R 7alkil AKTİVİTE Anti bakteriyel. - ETKİ MEKANİZMASI. Topoizomerez II inhibitörü; DNA-jiraz inhibitörü; DNA replikasyon inhibitörü; DNA transkripsiyon inhibitörüdür.

Yine, EP1962850B1 no'lu ve " İlaça dirençli tümörlerin tedavisi " başlıklı buluş, DNA topoizomerez I için gen kodlamasında polimorfizmleri gösteren hastalara uygulanması için ve/veya ilaca dirençli tümörlerin tedavisi için bir ilacın hazırlanması için kampotesin türevlerinin alt sınıfının kullanılması ile ilgilidir.

Sonuç olarak, DNA topoizomerez 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, DNA topoizomerez baskılamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, ters transkriptaz baskılamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, RNa polimeraz baskılamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, DNA topoizomerez baskılamaya DNA topoizomerez baskılamaya yönelik; 4-[5,6-dihidro-2-(6-metil-2-piridinil)-4H-pirolol[1,2-b]pirazol-3-il]-6-pikroretosid etil ester, 4-[5,6-dihidro-2-(6-trimetil-2-klorokumaroil)-4H-floro[1,2-b]pirazol-4-il]-7-pikroretosid fenil ester 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.

5

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, DNA topoizomerez baskılamaya DNA topoizomerez baskılamaya yönelik oluşturulmuş, sentetik pikroretosid türevleri ihtiva eden bir kompozisyonudur. Söz konusu kompozisyon, DNA topoizomerez baskılama, ters transkriptaz baskılama ve RNA polimeraz baskılama sağlamaktadır.

Buluş konusu kompozisyon; 4-[5,6-dihidro-2-(6-metil-2-piridinil)-4H-pirolo[1,2-b]pirazol-3-il]-6-pikroretosid etil ester, 4-[5,6-dihidro-2-(6-trimetil-2-klorokumaroil)-4H-floro[1,2-b]pirazol-4-il]-7-pikroretosid fenil ester ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 4-[5,6-dihidro-2-(6-metil-2-piridinil)-4H-pirolo[1,2-b]pirazol-3-il]-6-pikroretosid etil ester,

20 % 99-1 oranında 4-[5,6-dihidro-2-(6-trimetil-2-klorokumaroil)-4H-floro[1,2-b]pirazol-4-il]-7-pikroretosid fenil ester.

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; DNA topoizomerez baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, DNA topoizomeraz baskılamaya DNA topoizomeraz baskılamaya yönelik; 4-[5,6-dihidro-2-(6-metil-2-piridinil)-4H-pirolol[1,2-b]pirazol-3-il]-6-pikroretosid etil ester, 4-[5,6-dihidro-2-(6-trimetil-2-klorokumaroil)-4H-floro[1,2-b]pirazol-4-il]-7-pikroretosid fenil ester 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 4-[5,6-dihidro-2-(6-metil-2-piridinil)-4H-pirolol[1,2-b]pirazol-3-il]-6-pikroretosid etil ester içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 4-[5,6-dihidro-2-(6-trimetil-2-klorokumaroil)-4H-floro[1,2-b]pirazol-4-il]-7-pikroretosid fenil ester içermesidir.
15
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 4-[5,6-dihidro-2-(6-metil-2-piridinil)-4H-pirolol[1,2-b]pirazol-3-il]-6-pikroretosid etil ester, 4-[5,6-dihidro-2-(6-trimetil-2-klorokumaroil)-4H-floro[1,2-b]pirazol-4-il]-7-pikroretosid fenil ester içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; DNA topoizomeraz baskılamaya yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
20

ÖZET**DNA TOPOİZOMERAZ BASKILAMA NİTELİĞİ SERGİLEYEN SENTETİK
PİKRORETOSİT TÜREVLERİ İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, DNA topoizomeraz baskılamaya yönelik oluşturulmuş, sentetik pikroretosid türevleri ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15