

Tarifname

NÖRAMİNİDAZ BASKILAYICI NİTELİK GÖSTEREN ANTI-VİRÜTİK BİLEŞENLER İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, nöraminidaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş, anti-virütik bileşenler ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde nöraminidaz; influenza gibi virüslerin ana hücreden diğer dokulara yayılmasını sağlayan antijenik yapıdır. literatürde 9 çeşit nöraminidaz mevcuttur. kısaca n1,n2...n9 diye gösterilir.

15

Mevcut teknikte, WO 1999/054299 no'lu, " Nöraminidazların inhibitörleri olarak pirolidinler " başlıklı ve " C07D 409/04 " tasnif sınıflı buluş, Hastalığa neden olan mikroorganizmalardan gelen nöraminidazların, özellikle grip nöraminidazının engellenmesi için yararlı olan (I) formülü bileşikleri anlatılmıştır. Aynı zamanda, bir nöraminidaza sahip olan mikroorganizmaların neden olduğu hastalıkların engellenmesi ve tedavi edilmesi için bileşimler ve yöntemler, bileşiklerin hazırlanması için işlemler ve bu işlemlerde kullanılan sentetik ara-maddeler de anlatılmıştır.

20

Yine, EP1317559B1 no'lu, " Enfeksiyöz negatif iplikçikli rna virüsü üretmeye yönelik dna transfeksiyon sistemi " başlıklı buluş, viral RNA'nın verimli intraselüler sentezi açısından ikili bir promoter sistemi (tercihen bir RNA pol I-pol II sistemi) geliştirilmesine dayanmaktadır. Sonuçta ortaya çıkan minimum plazmid bazlı sistem, her tür RNA virüsünü, tercihen bir negatif tek iplikçikli RNA genomuna sahip virüsleri sentezlemede kullanılabilir. Sisteme ait viral genom, sistemin plazmidleri uygun bir konakçı hücre içersine dahil edildiğinde üretilir. Sistemin bir

25

30

uygulaması, aşılarda antijenler şeklinde kullanım açısından atenüe, reasortan influenza virüslerin üretimidir. Plazmidlerin birlikte transfeksiyonu vasıtasıyla üretilen reasortan virüsler, halihazırda popülasyonu enfekte eden bir influenza virüsünden yüzey glikoproteinleri hemagglutinin ve nöraminidaz şifreleyen genlerden ve bir atenüe influenza virüsünden dahili genlerden ibaret olabilir. Mevcut buluşun avantaj getiren bir özelliği, çok yönlülüğüdür; sistem, her tür RNA virüsünün bir atenüe versiyonunu sentezlemek üzere hızlı ve kolay şekilde adapte edilebilir. Mevcut buluş vasıtasıyla üretilen atenüe veya inaktive RNA virüsleri, intranasal yahut intramüsküler dahil olmak üzere, aşılamaya ihtiyaç duyan bir hastaya birkaç yoldan herhangi bir tanesi vasıtasıyla uygulanabilir.

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, nöraminidaz 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, nörominidaz baskılamasıdır.

5 Buluşun bir diğer amacı, RNA helikaz baskılamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, nöraminidaz baskılamaya yönelik; 2, 2'-[[dihidro-2-(4-kafeoil)-1,3(2H,4H)-oktadienil]bis(metilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin ve 2,2'-[[dihidro-2-(4-kumaroil)-1,3(2H,4H)-monolaroil]bis(dietilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin 10 içeren gruptan seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

Buluşun yapısal ve karakteristik özellikleri ve tüm avantajları aşağıda verilen detaylı açıklama sayesinde daha net olarak anlaşılacaktır ve bu nedenle değerlendirmenin 15 de bu detaylı açıklama göz önüne alınarak yapılması gerekmektedir.

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, nöraminidaz baskılamaya nöraminidaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş, 20 anti-virütik bileşenler ihtiva eden bir kompozisyonudur. Söz konusu kompozisyon; nörominidaz baskılama ve rna helikaz baskılama sağlamaktadır.

Buluş konusu kompozisyon; 2,2'-[[dihidro-2-(4-kafeoil)-1,3(2H,4H)-oktadienil]bis(metilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin ve 2,2'-[[dihidro-2-(4-kumaroil)-1,3(2H, 25 4H)-monolaroil]bis(dietilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında 2,2'-[[dihidro-2-(4-kafeoil)-1,3(2H,4H)-oktadienil]bis(metilen)]bis(N, 30 N-dimetil-sorinin,

% 99-1 oranında 2,2'-[[dihidro-2-(4-kumaroil)-1,3(2H,4H)-monolaroil]bis(dietilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin).

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

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

İSTEMLER

1. Buluş, nöraminidaz baskılamaya yönelik; 2,2'-[[dihidro-2-(4-kafeoil)-1,3(2H, 4H)-oktadienil]bis(metilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin ve 2,2'-[[dihidro-2-(4-kumaroil)-1,3(2H,4H)-monolaroil]bis(dietilen)]bis(N,N-dimetil-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 2,2'- 10 [[dihidro-2-(4-kafeoil)-1,3(2H,4H)-oktadienil]bis(metilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin içermesidir.
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 2,2'- 15 [[dihidro-2-(4-kumaroil)-1,3(2H,4H)-monolaroil]bis(dietilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin içermesidir.
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 2,2'-[[dihidro-2-(4-kafeoil)-1,3(2H,4H)- 20 oktadienil]bis(metilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin ve 2,2'-[[dihidro-2-(4-kumaroil)-1, 3(2H,4H)-monolaroil]bis(dietilen)]bis(N,N-dimetil-sorinin içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; nöraminidaz baskılamaya yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.

ÖZET**NÖRAMİNİDAZ BASKILAYICI NİTELİK GÖSTEREN ANTI-VİRÜTİK BİLEŞENLER
İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, nöraminidaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş, anti-virütik bileşenler ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15