

Tarifname

RİBONÜKLEOTİT REDUKTAZ BASKILAMAYA YÖNELİK OLUŞTURULMUŞ SENTETİK BİLEŞENLER İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, ribonükleotit reduktaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş sentetik bileşenler ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde ribonükleotid reduktaz, mevcut bütün organizmalarda ribonükleotidlerin indirgenerek, DNA'nin yapıtaşı olan deoksiribonükleotidlere dönüşmesini katalizleyen enzimdir. Bu reaksiyon aynı zamanda DNA biyosentezindeki hız belirleyici basamaktır. Oldukça önemli fonksiyona sahip olan bu enzim R1 ve R2 diye adlandırılan iki alt birimden oluşur. R2 birimi, aktif merkezinde yer alan binükleer Fe (II) merkezi aracılığıyla moleküler oksijeni indirgeyerek aktive eder ve sonuçta R1 alt biriminde uzun ömürlü bir tirozil radikali oluşur. İşte tam bu noktada elektronumuzun 35 Angstrom* sürece (proton eşzamanlı - proton coupled electron transfer) yolculuğu başlar. Bu uzun seyahatinde elektronumuza bir triptofan ve üç tirozin aminoasidi oluşturdukları radikalik ara ürünlerle yol boyunca eşlik ederler. Son durakta ise ribonükleotid indirgemelerini gerçekleştirecek olan ve R1 alt biriminde bulunan sisteinil radikali oluşturulur.

Mevcut teknikte EP1748767B1 no'lu, "Kuvvetli bir tirozinaz inhibitörü olarak 1-(3-metil-2,4-dimetoksifenil)-3-(2',4'-dihidroksifenil)-propan" başlıklı ve "A61K 31/015" tasnif sınıflı buluş, 1-(3-metil-2,4-dimetoksifenil)-3-(2',4'- dihidroksifenil)-propan bileşiğini içermektedir. Söz konusu bileşik, burada iki çekirdekli bir enzim olarak geçen iki çekirdekli bir aktif bölgesi olan bir enzim aktivitesini inhibe etmektedir, ve buna ihtiyaç duyan bir konakçıya söz konusu bileşik etkili bir miktarda uygulanabilmektedir, burada söz konusu bileşik sentezlenebilir ve/veya bir veya daha fazla bitkiden izole edilebilir, İki çekirdekli enzimlerin örnekleri arasında, sınırlayıcı olmadan tirozinaz,

arjinaz, ifreaz, sitokrom c oksidazı, proton pompalayan hem-bakır oksidazı, iki fonksiyonlu karbonmonoksit dehidrojenaz/asetil-koenzim A sentezi, ribonükleotit redüktaz, metalo-beta-laktamaz, H(+)-ATPaz ve alternatif oksidazı, ve bakteriyel fosfotriesteraz yer alır.

5 Yine, EP1701621B1 no'lu, "Aroma verme ajanları olarak ribonükleotit içeren terkiplerin üretimine yönelik proses" başlıklı buluş, 5'-ribonükleotit içeren bir terkinin üretimine yönelik bir proses tarif etmektedir ki bu proseste, bir mikroorganizma, RNA'nın büyük bir kısmının 5'-ribonükleotitlere parçalanabilen bir şekilde kaldığı ve yine RNA'nın büyük bir kısmının hücre duvarı fraksiyonu ile ilişkili kaldığı koşullar
10 altında otolize tabi tutulmaktadır. Sözü edilen hücre duvarı fraksiyonu, bir katı/sıvı ayırma yöntemi ile geri kazanılır ve sözü edilen hücre duvarı fraksiyonu ile ilişkili olan RNA, 5'-ribonükleotitlere çevrilir. Mevcut buluş, aynı zamanda, 5'-ribonükleotitler içeren terkipleri ve bunların gıda ya da yemlerde kullanımını da tarif etmektedir.

Yine, EP1480634B1 no'lu, "İyi huylu prostat hiperplazi tedavisine yönelik selektif
15 androjen reseptör modülatörleri (sarm) " başlıklı buluş, özneye, burada belirtildiği üzere selektif bir androjen reseptör modülatörü (sarm) ve/veya analogu, derivesi, izomeri, metaboliti, farmasötik olarak kabul edilebilir tuzu, farmasötik ürünü, hidratı, n-oksit veya bunların herhangi bir kombinasyonunun uygulanması ile erkek bir özneye iyi huylu prostat hiperplazi vakasının tedavi edilmesi, önlenmesi,
20 baskılanması, inhibe edilmesi veya azaltılmasına yönelik bir yöntem sağlar . Bu buluş aynı zamanda saç dökülmesinden muzdarip olan bir öznenin tedavi edilmesine yönelik bir yöntem sağlar ve bu yöntem, özneye, 5-a redüktaz enzim tip 1 ve/veya tip 2 inhibitörün terapötik olarak etkili bir miktarının uygulanması adımını içerir ve söz konusu inhibitör burada belirtildiği üzere bir selektif bir androjen reseptör modülatörü
25 (sarm) ve/veya analogu, derivesi, izomeri, metaboliti, farmasötik olarak kabul edilebilir tuzu, farmasötik ürünü, hidratı, n-oksit veya bunların herhangi bir kombinasyonudur . Bu buluş aynı zamanda 5-a redüktaz tip 1 ve/veya tip 2 enziminin inhibe edilmesi yöntemini sağlar ve bu yöntem enzimin, burada belirtildiği üzere selektif bir androjen reseptör modülatörü (sarm) ve/veya analogu, derivesi, izomeri,
30 metaboliti, farmasötik olarak kabul edilebilir tuzu, farmasötik ürünü, hidratı, n-oksit veya bunların herhangi bir kombinasyonunun etkili bir 5-a redüktaz inhibitör miktarı ile temas ettirilmesini içerir.

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

5

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, DNA giraz baskılama sağlamasıdır.

10

Buluşun bir diğer amacı, DNA ligaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, ribonükleotit reduktaz baskılama sağlamasıdır.

15

Buluşun bir diğer amacı, ters transkriptaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, DNA polimeraz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, Hemaglütinin esteraz baskılama sağlamasıdır.

20

Buluşun bir diğer amacı, integraz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, DNA metiltransferaz baskılama sağlamasıdır.

25 Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, ribonükleotit reduktaz baskılamaya yönelik; 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 3,5-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-dihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-etil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on içeren gruptan seçilen
30 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, ribonükleotit reduktaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş sentetik bileşenler ihtiva eden bir kompozisyonudur. Buluş konusu kompozisyon, DNA giraz baskılama, dna ligaz baskılama, ribonükleotit reduktaz baskılama, ters transkriptaz baskılama, DNA polimeraz baskılama, hemagglütinin esteraz baskılama, integras baskılama, dna metiltransferaz baskılama sağlamaktadır.

Buluş konusu kompozisyon; 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 3,5-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-dihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-etil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on ihtiva etmektedir.

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

% 1-90 oranında 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on,

% 49-5 oranında 3,5-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on,

% 50-5 oranında 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-dihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-etil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on.

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; ribonükleotit reduktaz baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, ribonükleotit reduktaz baskılamaya yönelik; 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 5
3,5-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-dihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-etil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on 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 % 1-90 oranında 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on içermesidir.
- 15 3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 49-5 oranında 3,5-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on içermesidir.
- 20 4. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 50-5 oranında 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-dihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-etil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on içermesidir.
- 25 5. Buluş, istem 1 ila 4'te bahsedilen; 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 3,5-bis(2-hidroksietil)3,5,7-trihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-metil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on, 3,7-bis(2-hidroksietil)3,5,7-dihidroksi-2-(4-metoksifenil)-8-(3-etil-2-büten-1-il)-4H-1-benzopiren-4-on içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; ribonükleotit reduktaz baskılamaya yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımınıdır.
30

ÖZET**RİBONÜKLEOTİT REDUKTAZ BASKILAMAYA YÖNELİK OLUŞTURULMUŞ
SENTETİK BİLEŞENLER İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, ribonükleotit reduktaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15