

Tarifname

H3K27 METİLTRANSFERAZ BASKILAMAYA YÖNELİK OLUŞTURULMUŞ ANTI-KARSİNOJENİK ETKİ GÖSTEREN BİLEŞENLER İHTİVA EDEN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, H3K27 metiltransferaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş anti-karsinojenik etki gösteren bileşenler ihtiva eden bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde histon metiltransferazlar (HMT), histon proteinlerinin yapısındaki lizin veya arjinin aminoasitlerine kofaktör S-adenozil metiyonin'den aldığı metil grubunu ekleyen enzimler. Histon metilasyonu olarak adlandırılan bu işlem epigenetik bir modifikasyondur. 1-3 arası metil grubu eklenebilen aminoasite taşıdığı metil sayısına göre metil-, dimetil- veya trimetil- ekleri verilir, örn. dimetil lizin. Yine, Katekol-O-metiltransferaz (COMT; 2.1.1.6), katekolaminlerin metabolizmasında rol oynayan bir enzimdir. Katekolaminler dopamin, adrenalin, noradrenalin örnek verilebilir. Katekol-O-metiltransferaz katekolamin nörotransmitterlerinin inaktivasyonunda rol alır. COMT enzimi postsinaptik nöronlarda yer alan intrasellüler bir enzimdir.

COMT enzimi insanda 22q11.2'de yerleşmiş olan bir gen tarafından kodlanır[1]. COMT genindeki fonksiyonel polimorfizm COMT enzim aktivitesinin değişmesine neden olmaktadır. COMT gen polimorfizminin şizofreni, bipolar bozukluk, obsesif kompulsif bozukluk, migren gibi hastalıkların; agresif ve antisosyal davranışların patogeneğinde etkili olduğu bilinmektedir.

Yine, Kanser oluşumunu engelleyen veya tümörün büyümesini önleyen maddedir. Mevcut teknikte yer alan, EP2307002B1 no'lu, "Desitabin ve prokain gibi dna metiltransferaz inhibitörleri ile sapasitabin ya da cndac kombinasyonları" başlıklı ve "A61K 31/245" tasnif sınıflı buluş, kanser ve başka proliferatif bozuklukların tedavisi için uygun olan bir farmasötik kombinasyonla ilgilidir.

Sonuç olarak H3K27 metiltransferaz 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, histon H3 lizin 27 metiltransferaz baskılama sağlamasıdır.

Buluşun bir diğer amacı, p21 ekspresyonu artımı sağlamasıdır.

10 Buluşun bir diğer amacı, p27 ekspresyonu artımı sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, H3K27 metiltransferaz baskılamaya yönelik; N-[(2,2-dihidro-6-trimetil-7-okzo-4-propionil-3-piridinil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(2-feniletil)-1-laroil]-3-1H-ramnozil-4-karboksamid, N-[(1,2-dihidro-4-dimetil-2-okzo-4-kafeoil-3-kumaroil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(1-metiletil)-1-propionil]-3-1H-
15 floro-4-karboksamid 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
20 de bu detaylı açıklama göz önüne alınarak yapılması gerekmektedir.

Buluşun Detaylı Açıklaması

Buluş, H3K27 metiltransferaz baskılamaya H3K27 metiltransferaz baskılamaya
25 yönelik oluşturulmuş anti-karsinojenik etki gösteren bileşenler ihtiva eden bir kompozisyonudur. Buluş konusu kompozisyon histon H3 lizin 27 metiltransferaz baskılama, p21 ekspresyonunun artımı ve p27 ekspresyonunun artımı sağlamaktadır.

30 Buluş konusu kompozisyon; N-[(2,2-dihidro-6-trimetil-7-okzo-4-propionil-3-piridinil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(2-feniletil)-1-laroil]-3-1H-ramnozil-4-karboksamid,

N-[(1,2-dihidro-4-dimetil-2-okzo-4-kafeoil-3-kumaroil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(1-metiletil)-1-propionil]-3-1H-floro-4-karboksamid ihtiva etmektedir.

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

% 1-99 oranında N-[(2,2-dihidro-6-trimetil-7-okzo-4-propionil-3-piridinil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(2-feniletil)-1-laroil]-3-1H-ramnozil-4-karboksamid,

% 99-1 oranında N-[(1,2-dihidro-4-dimetil-2-okzo-4-kafeoil-3-kumaroil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(1-metiletil)-1-propionil]-3-1H-floro-4-karboksamid.

10

Yukarıda verilen bileşenler verilen ağırlıkça oran aralıklarında ve yukarıdaki gruptan seçilen anti-karsinojenik etki gösteren bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşimlerinden elde edilmektedir.

15 Söz konusu buluş aynı zamanda da söz konusu kompozisyonun; H3K27 metiltransferaz baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, H3K27 metiltransferaz baskılamaya yönelik; N-[(2,2-dihidro-6-trimetil-7-okzo-4-propionil-3-piridinil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(2-feniletil)-1-laroil]-3-1H-ramnozil-4-karboksamid, N-[(1,2-dihidro-4-dimetil-2-okzo-4-kafeoil-3-kumaroil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(1-metiletil)-1-propionil]-3-1H-floro-4-karboksamid içeren gruptan seçilen anti-karsinojenik etki gösteren 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 N-[(2,2-dihidro-6-trimetil-7-okzo-4-propionil-3-piridinil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(2-feniletil)-1-laroil]-3-1H-ramnozil-4-karboksamid içermesidir.
10
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında N-[(1,2-dihidro-4-dimetil-2-okzo-4-kafeoil-3-kumaroil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(1-metiletil)-1-propionil]-3-1H-floro-4-karboksamid içermesidir.
15
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; N-[(2,2-dihidro-6-trimetil-7-okzo-4-propionil-3-piridinil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(2-feniletil)-1-laroil]-3-1H-ramnozil-4-karboksamid, N-[(1,2-dihidro-4-dimetil-2-okzo-4-kafeoil-3-kumaroil)metil]-1-(1-metiletil)-6-[6-[4-(1-metiletil)-1-propionil]-3-1H-floro-4-karboksamid içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen anti-karsinojenik etki gösteren bileşimlerin; H3K27 metiltransferaz baskılamaya yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.
20
25

ÖZET**H3K27 METİLTRANSFERAZ BASKILAMAYA YÖNELİK OLUŞTURULMUŞ ANTI-KARSİNOJENİK ETKİ GÖSTEREN BİLEŞENLER İHTİVA EDEN BİR
KOMPOZİSYON**

5

Buluş, H3K27 metiltransferaz baskılamaya yönelik oluşturulmuş bir kompozisyon ile ilgilidir.

10 Şekil yoktur.

15