

Tarifname

DNA POLİMERAZ BASKILAMAYA YÖNELİK OLUŞTURULMUŞ, ANTI-VİRAL BİLEŞENLER İÇEREN BİR KOMPOZİSYON

5

Teknik Alan

Buluş, dna polimeraz baskılamaya yönelik oluşturulmuş, anti-viral bileşenler içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

10

Tekniğin Bilinen Durumu

Günümüzde DNA polimeraz, DNA ikileşmesini sağlayan bir enzimdir. Bu enzimler bir DNA ipliğini kalıp olarak kullanır, onu okuyup, onun boyunca deoksiribonükleotitlerin polimerizasyonunu katalizler. Yeni polimerleşmiş molekül kalıp ipliği tamamlayıcıdır, ve kalıp ipliğin eski eşi ile aynı yapıya sahiptir. DNA polimeraz bir holoenzim olarak sayılır, çünkü doğru işlev verebilmek için bir magnezyum iyonuna gerek duyar. Magnezyum iyonunun yokluğunda ona apoenzim olarak değinilir.

DNA polimeraz tek iplikli bir DNA'ya bağlanarak DNA ikileşmesini başlatır. RNA polimerazdan farklı olarak, DNA polimeraz sentezlediği yeni ipliği sadece nükleotitlerden başlayarak uzatamaz, ancak mevcut bir DNA zincirini uzatabilir. Bu yüzden zincir sentezinin başı için yardımcı enzimlere gerek duyar. DNA polimerazların bazı türleri hatalı ekledikleri nükleotitleri farkedip onları tamir etmelerini sağlayan bir eksonükleaz yeteneğine sahiptir.

25 Mevcut teknite yer alan WO 1999/009031 no'lu, "Hepatit B virüsü (HBV) retroviral ters transkriptaz ve DNA polimeraz inhibe edicilerini içeren antiviraller gibi nükleozidlerin analogları" başlıklı ve "C07D 473/00 " tasnif sınıflı buluş, Bir formül I birleşimidir ki burada, nuc, siklik veya asiklik sakarit yarı üzerindeki kendi tekil hidroksi grubu içinden bağlanmış olan nükleozid analog kalıntısıdır, R1, hidroksi, amino veya 30 karboksi arasından seçilmiştir; İsteğe bağlı olarak üzerine bağlanan esterleşmiş/amid, C4-C22 doymuş veya doymamış isteğe bağlı olarak süstitüe olabilen yağlı asit veya alkol veya alifatik L-amino aside sahiptir; R2 alifatik L-amino

asit kalıntısıdır; L1 üç-işlevli bağlayıcı gruptur; L2 namevcuttur veya iki-işlevli bağlayıcı gruptur;, ve bunların farmasötik olarak kabul edilebilir tuzlarıdır.

Yine, EP1234024B1 no'lu, "Rekombinant bir RNA-virüs oluşumunu yönlendirebilen nükleik asit sekansları içerikli suni kromozom yapıları" başlıklı buluş, bir DNA hazırlanmasına yönelik olup aşağıdaki aşamaları içeren metotlarla ilgilidir; (a) genomik RNA'nın (gRNA) veya bir RNA virüsünün tam uzunlukta bir transkripsiyonu içeren bir DNA'nın; veya (b) bir gRNA'nın veya bir RNA virüsünün, RNA'ya bağlı bir RNA polimerazını ve en az bir yapısal veya yapısal olmayan proteini kodlayan bir veya birkaç parçacığını içeren bir DNA'nın veya (c) (a) veya (b)'deki sekanslara en az % 60 benzerlik gösteren bir DNA'nın, bakteriyel suni bir kromozom (BAC) içerisine klonlanması ile ilgilidir.

Yine TR2001/01093 no'lu, "Mutan DNA polimerazlar kullanılarak, yüksek sıcaklıkta ters transkripsiyon yapılması" başlıklı buluş, tadil edilmiş termostabil DNA polimerazlar kullanılarak, özellikle bir magnezyum iyonu tamponu içinde, iyileştirilmiş ters transkripsiyon yöntemleri ile ilgilidir. Bu yöntemler, birleşik ters transkripsiyon / amplifikasyon reaksiyonları için özellikle yararlıdır.

Sonuç olarak dna polimeraz baskılamaya yönelik oluşturulmuş anti-viral bileşenler içeren bir kompozisyona olan gereksinimin varlığı ve mevcut çözümlerin yetersizliği ilgili teknik alanda bir geliştirme yapmayı zorunlu kılmıştır.

20

Buluşun Amacı

Tekniğin bilinen durumuna ait dezavantajları ortadan kaldırmak üzere buluşun bir amacı, dna polimeraz baskılama sağlamasıdır.

25

Buluşun bir diğer amacı, ters transkriptaz baskılama sağlamasıdır.

Yukarıdaki avantajları elde etmek üzere buluş, dna polimeraz baskılamaya yönelik; 2, 3,9,10,11,12-hegzahidro-8R-metoksi-2,4-dimetil-1-okso-9S,12R-epoksi-2H-diindol[1, 2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]benzodiazokin-4-karboksilik asit, metil ester, 2,3,9, 10,11,12-hegzahidro-10R-metoksi-3,3-trimetil-7-okso-9S,12R-epoksi-4H-tetrafloro[1, 2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]oktadien-8-karboksilik asit ,fenil ester içeren gruptan

30

seçilen bileşenlerin; birey ya da kombinasyonlar halinde birleşiminden elde edilen bir kompozisyonudur.

5 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

10

Buluş, dna polimeraz baskılamaya yönelik oluşturulmuş anti-viral bileşenler içeren bir kompozisyonudur. Buluş konusu kompozisyon dna polimeraz baskılama ve ters transkriptaz baskılama sağlamaktadır.

15

Buluş konusu kompozisyon 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-8R-metoksi-2,4-dimetil-1-okso-9S,12R-epoksi-2H-diindol[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]benzodiazokin-4-karboksilik asit, metil ester, 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-10R-metoksi-3,3-trimetil-7-okso-9S,12R-epoksi-4H-tetrafloro[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]oktadien-8-karboksilik asit ,fenil ester ihtiva etmektedir.

20

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

25

% 1-99 oranında 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-8R-metoksi-2,4-dimetil-1-okso-9S,12R-epoksi-2H-diindol[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]benzodiazokin-4-karboksilik asit, metil ester,

ve

30

% 99-1 oranında 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-10R-metoksi-3,3-trimetil-7-okso-9S,12R-epoksi-4H-tetrafloro[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]oktadien-8-karboksilik asit, fenil ester.

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; dna polimeraz baskılamaya yönelik kullanımı ve bu amaçla üretimini de kapsamaktadır.

İSTEMLER

1. Buluş, dna polimeraz baskılamaya yönelik; 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-8R-metoksi-2,4-dimetil-1-okso-9S,12R-epoksi-2H-diindol[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]benzodiazokin-4-karboksilik asit, metil ester, 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-10R-metoksi-3,3-trimetil-7-okso-9S,12R-epoksi-4H-tetrafloro[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]oktadien-8-karboksilik asit ,fenil ester içeren 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 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-8R-metoksi-2,4-dimetil-1-okso-9S,12R-epoksi-2H-diindol[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]benzodiazokin-4-karboksilik asit, metil ester içermesidir.
3. İstem 1'e uygun bir kompozisyon olup, özelliği, ağırlıkça % 99-1 oranında 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-10R-metoksi-3,3-trimetil-7-okso-9S,12R-epoksi-4H-tetrafloro[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]oktadien-8-karboksilik asit, fenil ester içermesidir.
4. Buluş, istem 1 ila 3'te bahsedilen; 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-8R-metoksi-2,4-dimetil-1-okso-9S,12R-epoksi-2H-diindol[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]benzodiazokin-4-karboksilik asit, metil ester, 2,3,9,10,11,12-hegzahidro-10R-metoksi-3,3-trimetil-7-okso-9S,12R-epoksi-4H-tetrafloro[1,2,3-fg:3',2',1'-kl]pirrolo[3,4-i][1,6]oktadien-8-karboksilik asit ,fenil ester içeren gruptan seçilen birey ya da kombinasyonlar halinde elde edilen bileşimlerin; dna polimeraz baskılamaya yönelik kompozisyonun üretiminde kullanımındır.

ÖZET**DNA POLİMERAZ BASKILAMAYA YÖNELİK OLUŞTURULMUŞ, ANTI-VİRAL
BİLEŞENLER İÇEREN BİR KOMPOZİSYON**

5

Buluş, dna polimeraz baskılamaya yönelik oluşturulmuş anti-viral bileşenler içeren bir kompozisyon ile ilgilidir.

Şekil yoktur.

10

15