

ÖZET

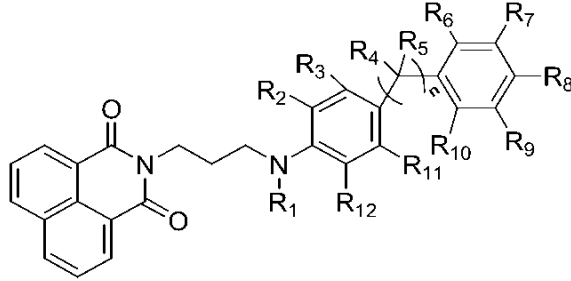
ÖZGÜN BİSNAFTALİMİDOPROPİL (BNİP) TÜREVİ AKTİF İLAÇ ETKEN MADDELERİ

- 5 Mevcut buluş bisnaftalimidopropil (BNİP) türevi özgün ilaç moleküllerine ve söz konusu özgün ilaç moleküllerinin viral, bakteriyel ve neoplastik hastalıkların tedavisinde kullanımına ve söz konusu özgün moleküllerin viral, bakteriyel ve neoplastik hastalıkların tedavisinde kullanıma uygun bir farmasötik bileşimin hazırlanmasında kullanılmasına ilişkindir.

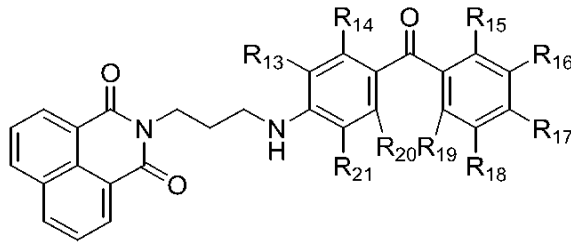
İSTEMLER

1. Bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi moleküller olup söz konusu moleküller;

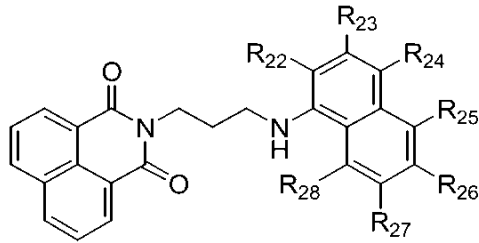
a) Formül I;



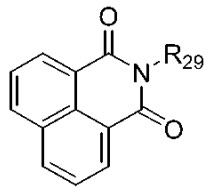
5 b) Formül II;



c) Formül III;

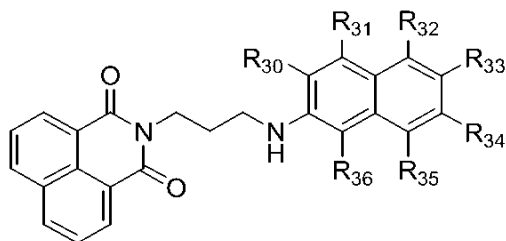


d) Formül IV;

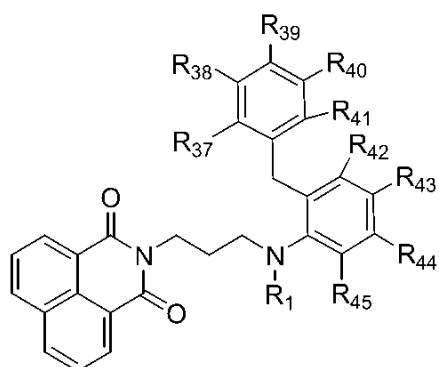


10

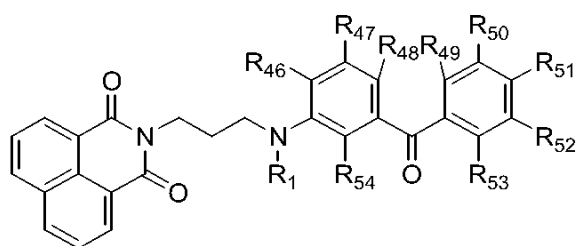
e) Formül V;



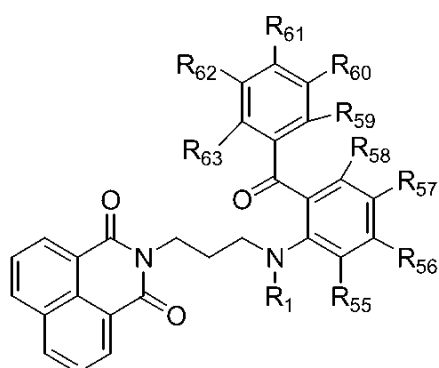
f) Formül VI;



g) Formül VII;



5 h) Formül VIII;



ile gösterilmekte olup burada;

-n 0 ile 12 arasında bir doğal sayıdır,

- R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₃₇, R₃₈, R₃₉, R₄₀, R₄₁, R₄₂, R₄₃, R₄₄,

10 R₄₅, R₄₆, R₄₇, R₄₈, R₄₉, R₅₀, R₅₁, R₅₂, R₅₃, R₅₄, R₅₅, R₅₆, R₅₇, R₅₈, R₅₉, R₆₀, R₆₁, R₆₂, R₆₃, birbirinden bağımsız olarak;

-H, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -NHNHR_X, -N(R_X)(NHR_Y), -N(R_X)(NR_YR_Z), R_X, R_Y, R_Z, Cl, F, Br, I, -OH, -NO, -NO₂, -COOH, -OR_X, -SO₂R_X, -SO₂NHR_X, -SO₂NR_XR_Y, -CN, -COOR_X, -CONHR_X, -CONR_XR_Y, -NHCOCH₂R_X, -NHCOCHR_XR_Y, -NHCNHR_X, -

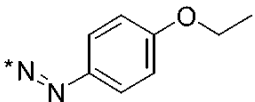
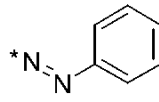
15 NHCOR_X, -NHCONHR_X, -NHSO₂R_X'den oluşan bir grubun içerisinde;

- R₁₃, R₁₄, R₁₅, R₁₆, R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀, R₂₁ birbirinden bağımsız olarak;

-H, -Cl, -F, -Br, -I, R_X, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -OH, -NO, -NO₂, -COOH, -OR_X, -COOR_X, -CN içerisinden;

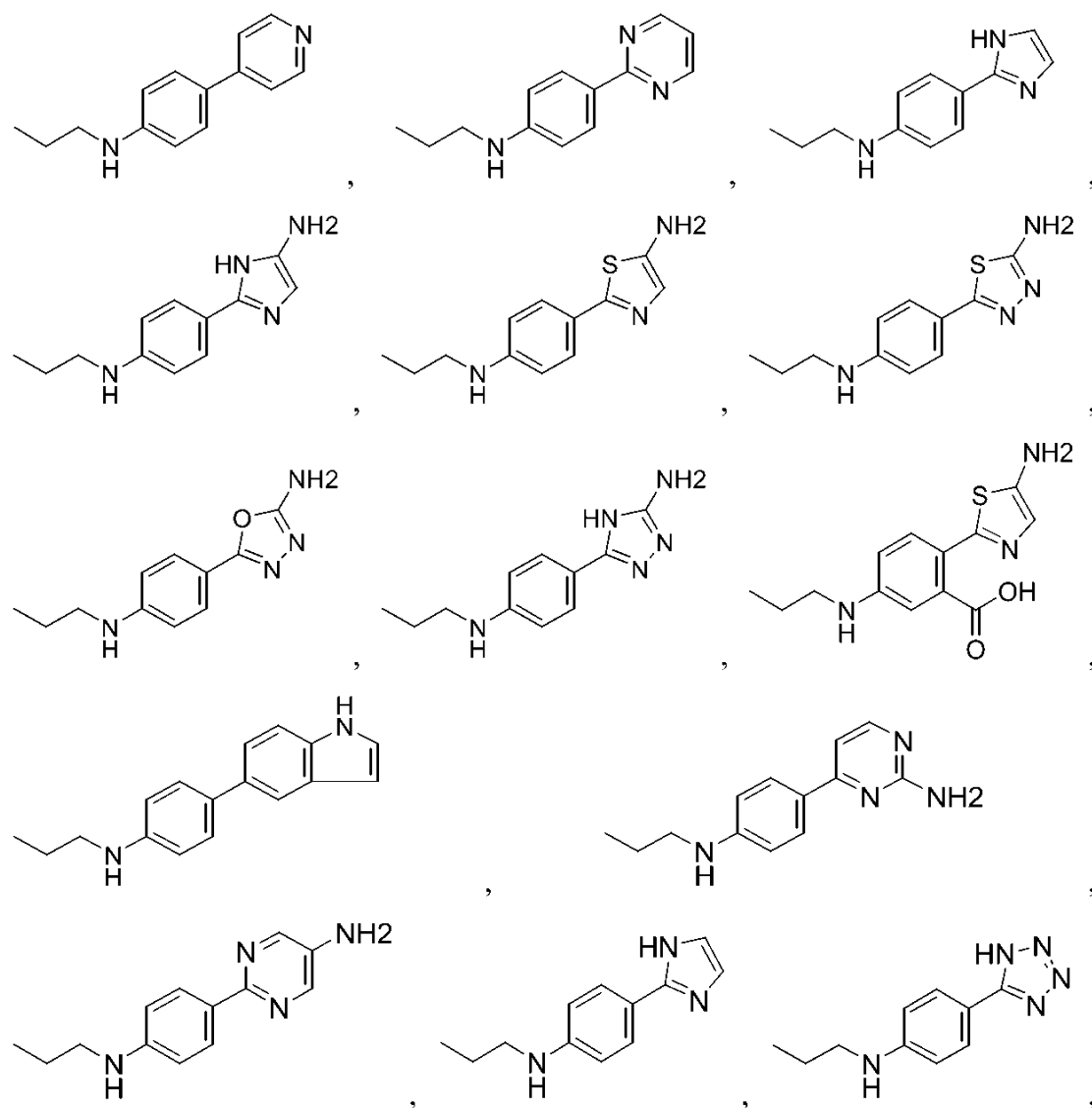
- R₂₂, R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆, R₂₇, R₂₈ birbirinden bağımsız olarak

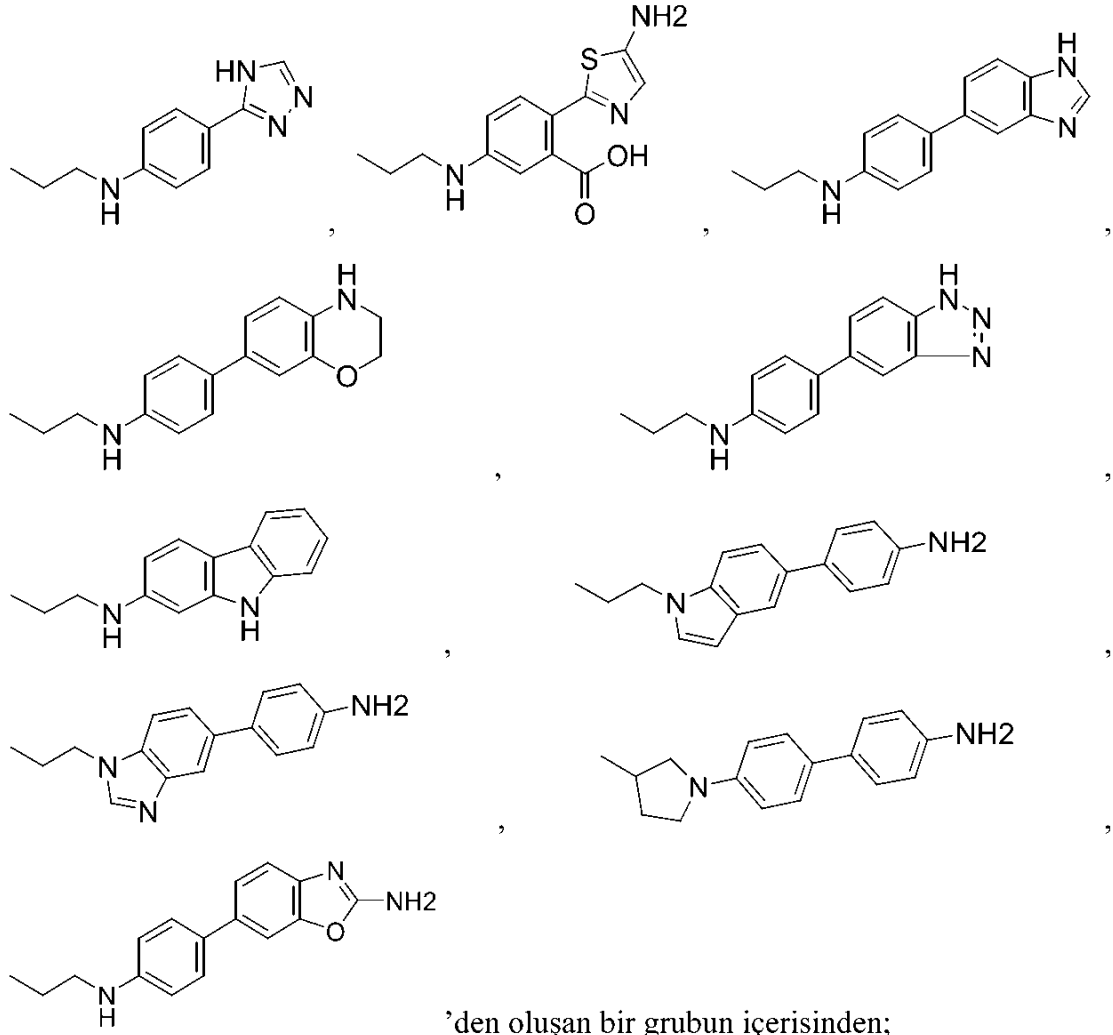
5 -H, -Cl, -F, -Br, -I, R_X, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -OH, -COOH, -OR_X, -COOR_X, -CN, -

SO₃H, -SO₃⁻Na⁺, , , -NO içerisinden;

- R₂₉;

10





- R_{30} , R_{31} , R_{32} , R_{33} , R_{34} , R_{35} , R_{36} birbirinden bağımsız olarak;

-H, -Cl, -F, -Br, -I, R_X , -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -OH, -NO, -COOH, -OR_X, -COOR_X, -CN'den oluşan bir grubun içerisinde;

R_X , R_Y ve R_Z ise birbirinden bağımsız olarak; ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkan, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alken, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 primer amin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 sekonder amin, ikameli veya ikamesiz alkol, ikameli veya ikamesiz alkil siyanid, ikameli veya ikamesiz sülfonamid, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkyl sülfonil, ikameli veya ikamesiz C3-C8 sikloalkil, ikameli veya ikamesiz aril, ikameli veya ikamesiz heteroaril, isteğe bağlı olarak birbirinden bağımsız olarak O, S ve N içerisinde seçilen bir veya daha fazla heteroatom içeren ikameli veya ikamesiz heterosiklik veya heteroaromatik halkalardan oluşan grubun içerisinde seçilir.

n 0 veya 1 veya 2 veya 3 veya 4 veya 5 veya 6 veya 7 veya 8 veya 9 veya 10 veya 11 veya 12 değerini alır;

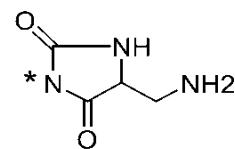
-H, -NH₂, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₃,

15 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_3)$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)$, -
 $\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)$, $\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHNH}_2$, $-\text{NHNHCH}_3$, $-\text{NHNHCH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{NHNHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{NHN}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHN}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHN}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, -
 $\text{N}(\text{CH}_3)(\text{NHCH}_3)$, $-\text{N}(\text{CH}_3)(\text{N}(\text{CH}_3)_2)$, $-\text{COOH}$, $-\text{SO}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, -
 $\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -

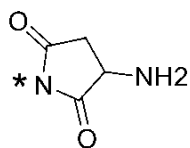
25 COCH₂CH₂CH₂CH₃, -COCH₂CH₂CH₂CH₂CH₃, -COCH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₃, -
 COOCH₃, -COOCH₂CH₃, -COOCH₂CH₂CH₃, -COOCH₂CH₂CH₂CH₃, -
 COOCH₂CH₂CH₂CH₂CH₃, -COOCH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₃, -COCH(CH₃)₂, -
 COC(CH₃)₃, -COCH(CH₂CH₃)₂, -COCH(CH₃)(CH₂CH₃), -COCH₂CH₂CH₃, -
 COCH₂CH₂CH₂CH₃, -COCH₂CH₂CH₂CH₂CH₃, -COCH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₃, -

30 SO₂NH₂, SO₂NHCH₃, SO₂NHCH₂CH₃, -SO₂NHCH₂CH₂CH₃, SO₂N(CH₃)₂, -
SO₂N(CH₃)(CH₂CH₃), -SO₂N(CH₂CH₃)₂, -SO₂N(CH₃)(CH₂CH₂CH₃), -
SO₂N(CH₂CH₂CH₃)₂, -NHCONHCH₃, -NHCON(CH₃)₂, -NHCONHCH₂CH₃, -
NHCON(CH₃)(CH₂CH₃), -NHCON(CH₂CH₃)₂, -NHCOCH(CH₃)(NH₂), -

$\text{NHCOCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_3)(\text{NHCH}_3)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_3)(\text{N}(\text{CH}_3)_2)$, -
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{OH})(\text{NH}_2)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH})(\text{NH}_2)$, -
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH})(\text{NHCH}_3)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{OH})(\text{NHCH}_3)$,
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{OH})(\text{N}(\text{CH}_3)_2)$, $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{OH})(\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2)$, -
 5 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{SH})(\text{NH}_2)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SH})(\text{NH}_2)$, -
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SH})(\text{NH}_2)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{SH})(\text{NHCH}_3)$, -



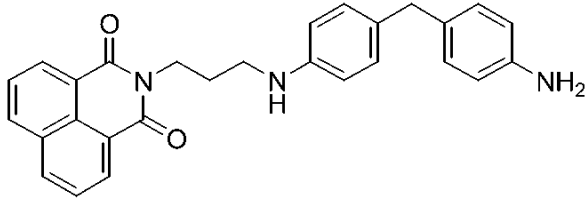
$\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{SH})(\text{NHCH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{SH})(\text{N}(\text{CH}_3)_2)$, ,



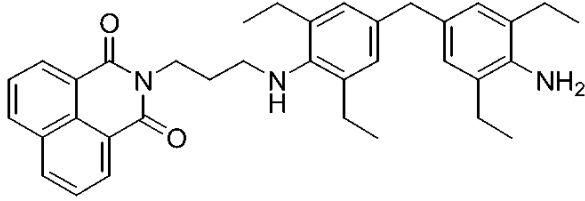
- , $-\text{NH}(\text{CNH})\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CN}(\text{CH}_3))\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CN}(\text{CH}_2\text{CH}_3))\text{NH}_2$, -
 $\text{NH}(\text{CN}(\text{CH}_3))\text{NH}(\text{CH}_3)$, -- $\text{NH}(\text{CN}(\text{CH}_3))\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NH}(\text{CNH})\text{NHCH}_3$,
 10 $\text{NH}(\text{CNH})\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{NHCH}_2\text{NH}_2$, -
 $\text{NH}(\text{CO})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2)$, -
 $\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, -
 $\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$,
 $-\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, -
 15 $\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3$, -
 $\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, -
 $\text{NH}\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NHCH}_2\text{NH}_2$, -
 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3$, -
 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{NH}_2)_2$, -
 20 $\text{N}(\text{CH}_2\text{NHCH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3)_2$, -
 $\text{NHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{NHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2$, -
 $\text{NHCON}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2)$, $-\text{NHCON}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2)$, -
 $\text{NHCON}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2)$, $-\text{NHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHCH}_3$, -
 $\text{NHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_3$, - $\text{NHCONHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, -
 25 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2$, - $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}_2$, -
 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHCH}_3$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ ’den oluşan bir grubun içerisinde
 seçilir.

3. İstem 1 ve 2’ye göre bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi moleküller olup Formül
 I’de $n=0$ olduğunda R_4 ve R_5 boştur.

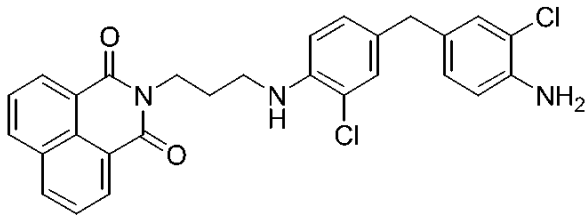
4. İstem 1'e göre bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi moleküller olup, formül II ile gösterilen moleküllerde R_{13} , R_{14} , R_{15} , R_{16} , R_{17} , R_{18} , R_{19} , R_{20} , R_{21} birbirinden bağımsız olarak; -H, -Cl, -F, -Br, -I, -NH₂, -CH₃, C(CH₃)₂'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir.
5. İstem 1'e göre bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi moleküller olup formül V ile gösterilen moleküllerde R_{30} , R_{31} , R_{32} , R_{33} , R_{34} , R_{35} , R_{36} birbirinden bağımsız olarak -H, -NH₂, -OCH₃, -NO, -Cl, F, I, Br'dan oluşan bir grubun içerisinde seçilir.
6. İstem 1'e göre bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi moleküller olup formül VI ile gösterilen moleküllerde R_1 , R_{37} , R_{38} , R_{39} , R_{40} , R_{41} , R_{42} , R_{43} , R_{44} , R_{45} birbirinden bağımsız olarak; -H, -NH₂, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -C(CH₃)₃, Cl, F, Br, I, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -NHCH₃, -NHCH₂CH₃, -N(CH₃)₂, -NO₂, -COOH, -COOCH₃, -COONH₂, -COONHCH₃, -COON(CH₃)₂'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir.
7. İstem 1'e göre bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi moleküller olup formül VII ile gösterilen moleküllerde R_1 , R_{46} , R_{47} , R_{48} , R_{49} , R_{50} , R_{51} , R_{52} , R_{53} , R_{54} birbirinden bağımsız olarak; -H, -NH₂, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -C(CH₃)₃, Cl, F, Br, I, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -NHCH₃, -NHCH₂CH₃, -N(CH₃)₂, -NO₂, -COOH, -COOCH₃, -COONH₂, -COONHCH₃, -COON(CH₃)₂'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir.
8. İstem 1'e göre bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi moleküller olup formül VIII ile gösterilen moleküllerde R_1 , R_{55} , R_{56} , R_{57} , R_{58} , R_{59} , R_{60} , R_{61} , R_{62} , R_{63} birbirinden bağımsız olarak; -H, -NH₂, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -C(CH₃)₃, Cl, F, Br, I, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -NHCH₃, -NHCH₂CH₃, -N(CH₃)₂, -NO₂, -COOH, -COOCH₃, -COONH₂, -COONHCH₃, -COON(CH₃)₂'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir.
9. İstem 6-8'e göre bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi moleküller olup Formül VI, VII ve VIII ile gösterilen moleküllerde R_1 -H'dir.
10. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 1 ile gösterilen yapıya sahiptir.



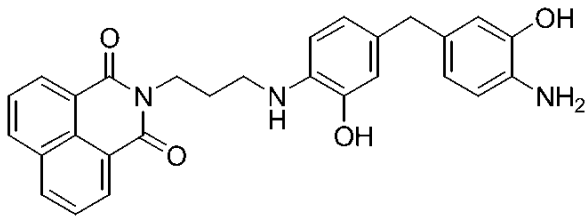
11. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 2 ile gösterilen yapıya sahiptir.



5 12. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 3 ile gösterilen yapıya sahiptir

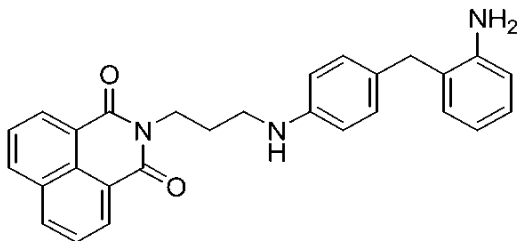


13. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 4 ile gösterilen yapıya sahiptir

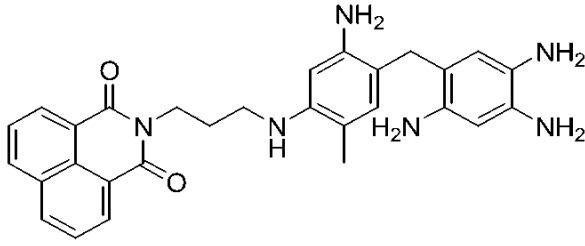


10

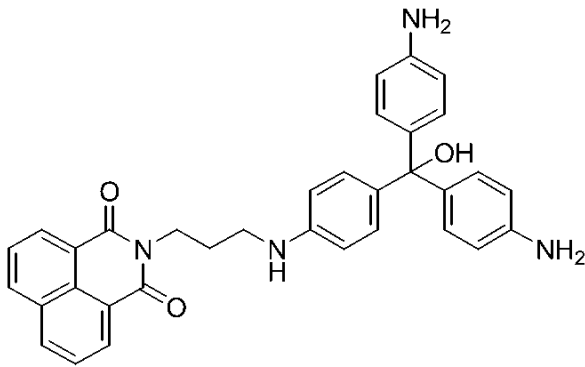
14. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 5 ile gösterilen yapıya sahiptir



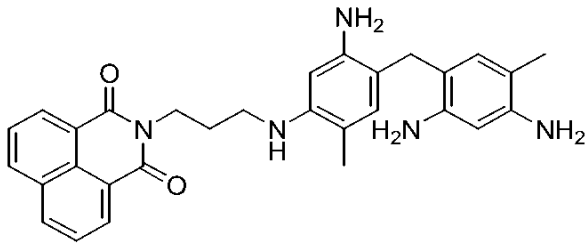
15. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 6 ile gösterilen yapıya sahiptir



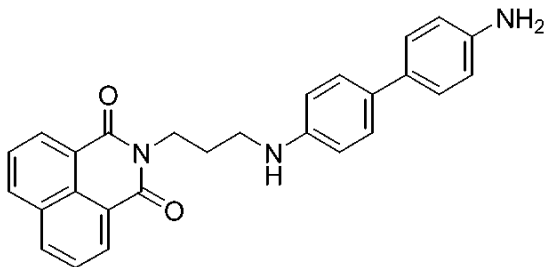
16. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 7 ile gösterilen yapıya sahiptir



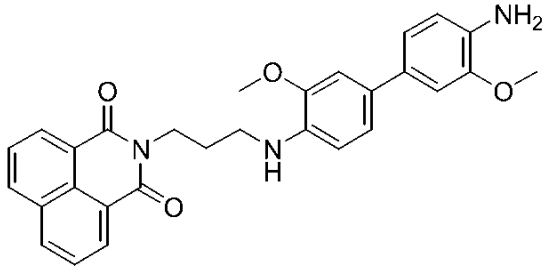
17. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 8 ile gösterilen yapıya sahiptir



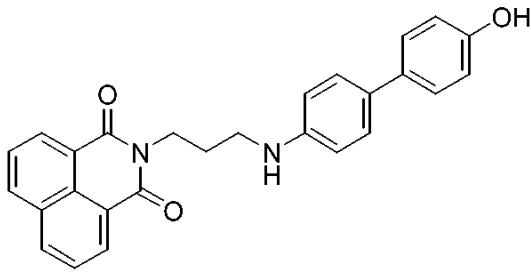
18. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 9 ile gösterilen yapıya sahiptir



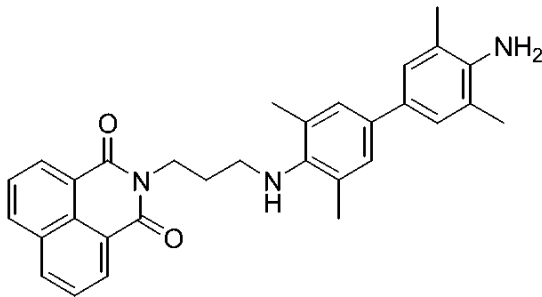
19. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 10 ile gösterilen yapıya sahiptir



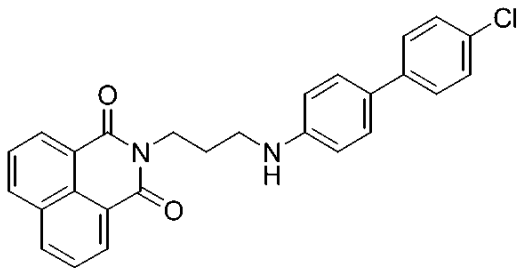
20. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 11 ile gösterilen yapıya sahiptir



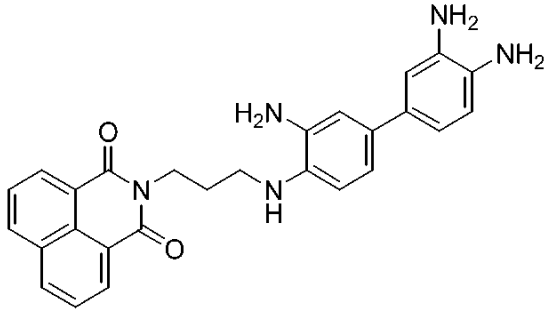
21. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 12 ile gösterilen yapıya sahiptir



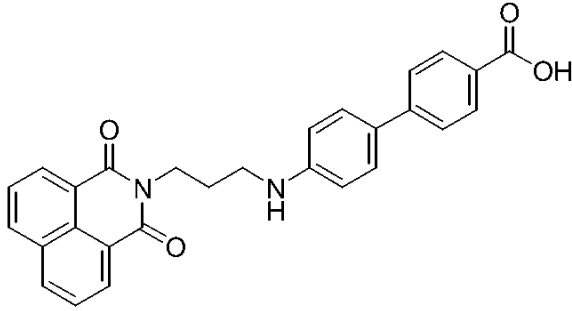
22. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 13 ile gösterilen yapıya sahiptir



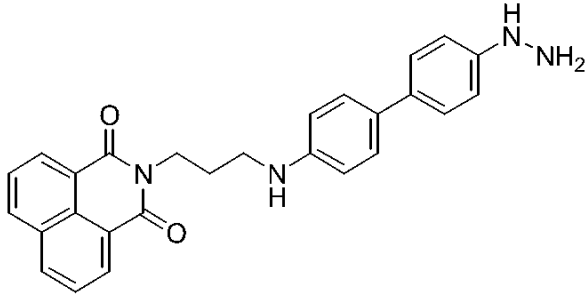
23. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 14 ile gösterilen yapıya sahiptir



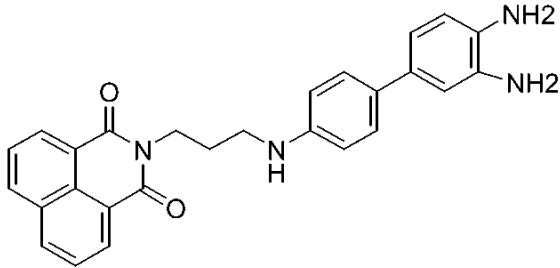
24. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 15 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 25. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 16 ile gösterilen yapıya sahiptir

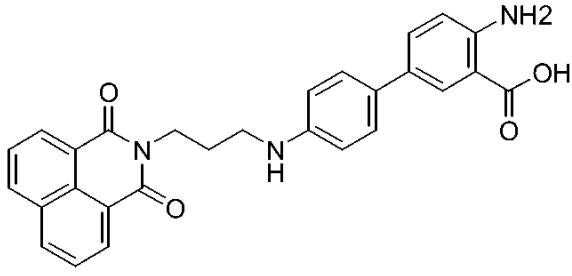


26. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 17 ile gösterilen yapıya sahiptir

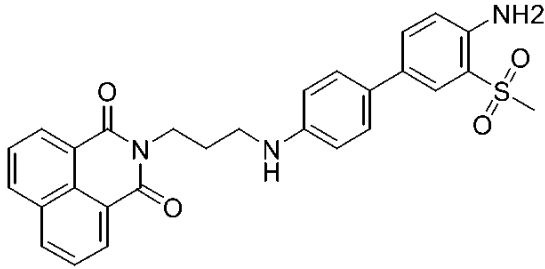


10

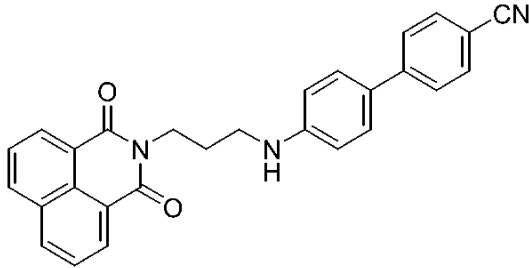
27. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 18 ile gösterilen yapıya sahiptir



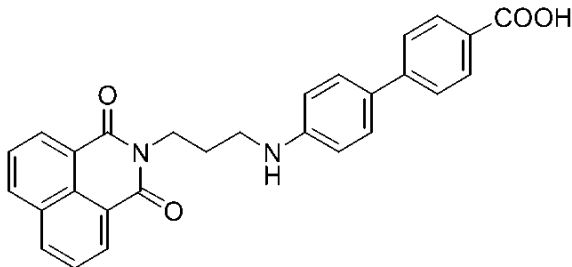
28. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 19 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 29. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 20 ile gösterilen yapıya sahiptir

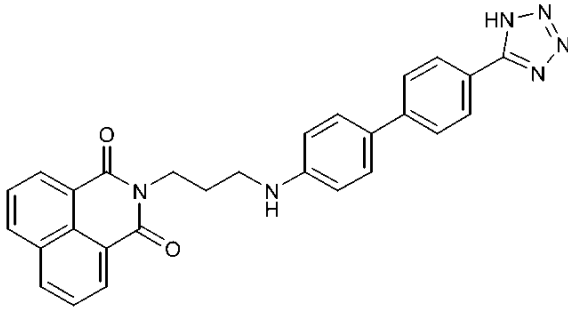


30. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 21 ile gösterilen yapıya sahiptir

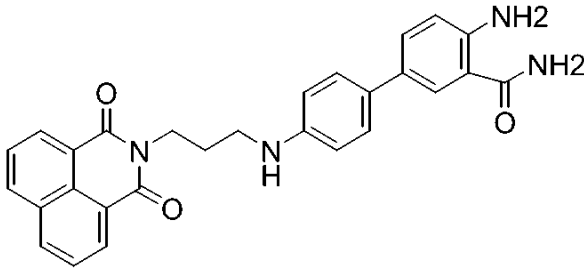


10

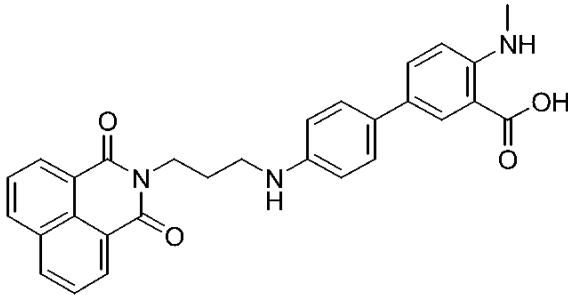
31. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 22 ile gösterilen yapıya sahiptir



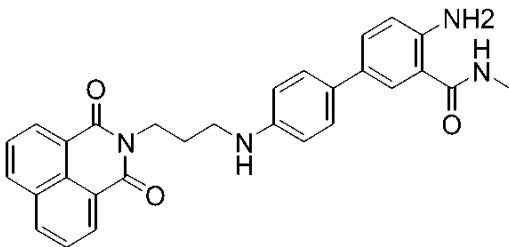
32. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 23 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 33. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 24 ile gösterilen yapıya sahiptir

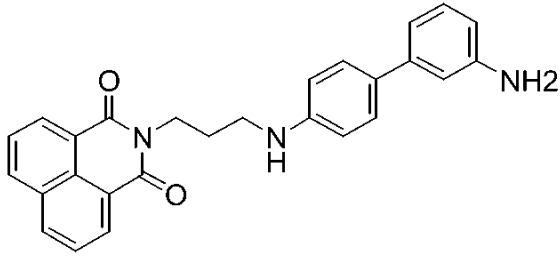


34. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 25 ile gösterilen yapıya sahiptir

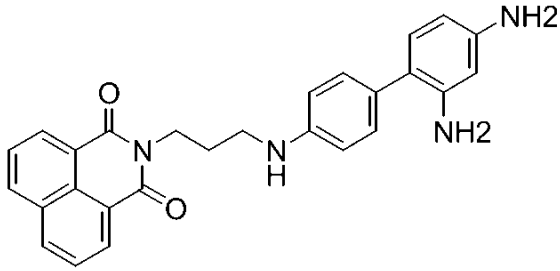


10

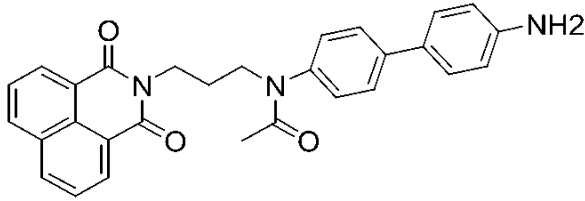
35. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 26 ile gösterilen yapıya sahiptir



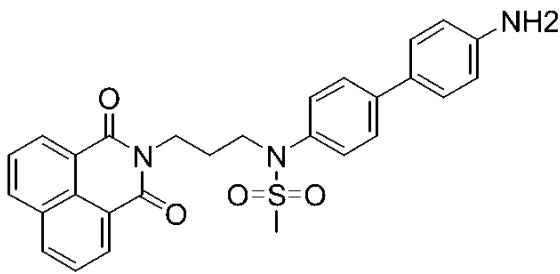
36. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 27 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 37. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 28 ile gösterilen yapıya sahiptir

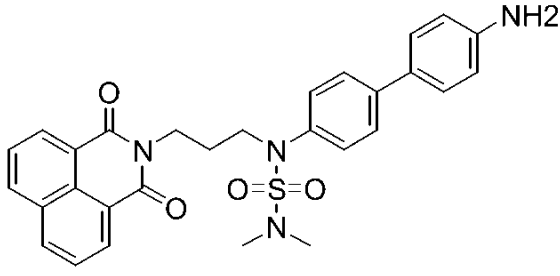


38. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 29 ile gösterilen yapıya sahiptir

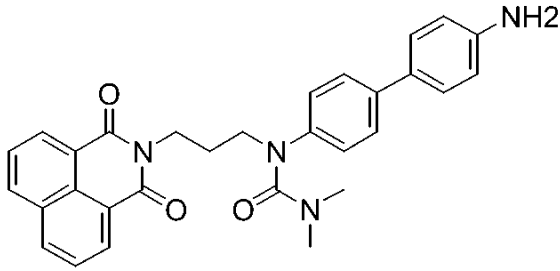


10

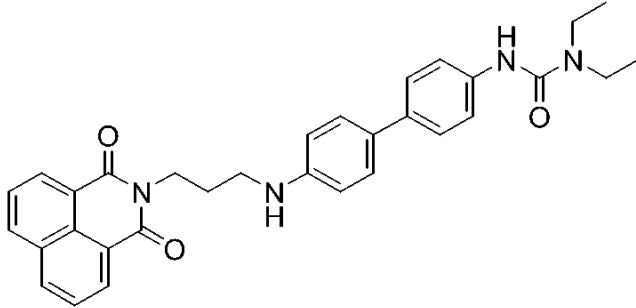
39. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 30 ile gösterilen yapıya sahiptir



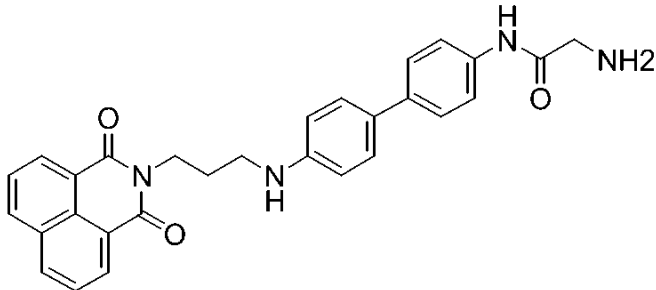
40. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 31 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 41. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 32 ile gösterilen yapıya sahiptir

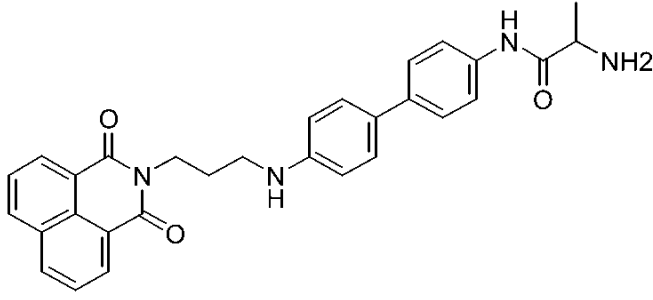


42. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 33 ile gösterilen yapıya sahiptir

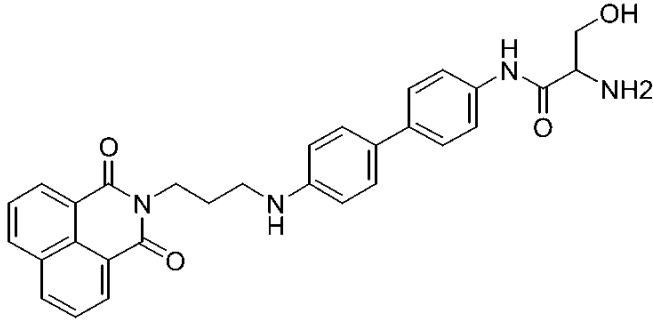


10

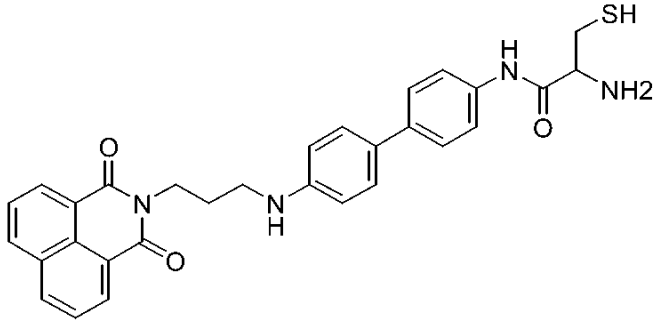
43. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 34 ile gösterilen yapıya sahiptir



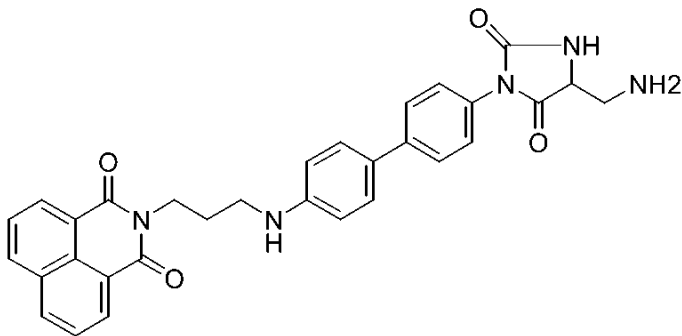
44. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 35 ile gösterilen yapıya sahiptir



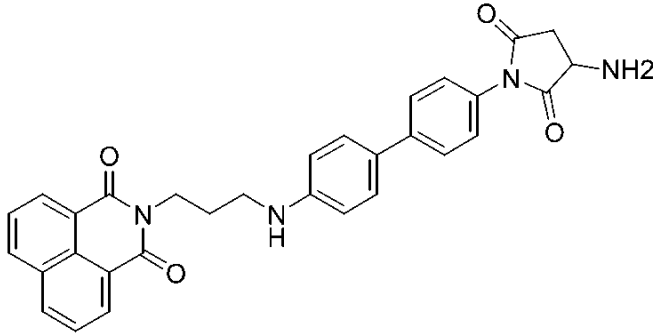
5 45. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 36 ile gösterilen yapıya sahiptir



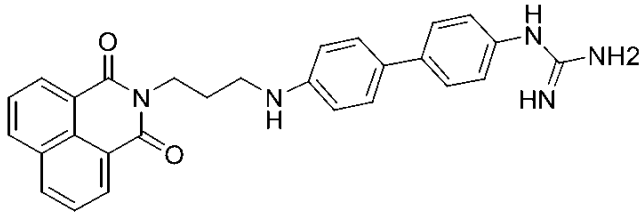
46. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 37 ile gösterilen yapıya sahiptir



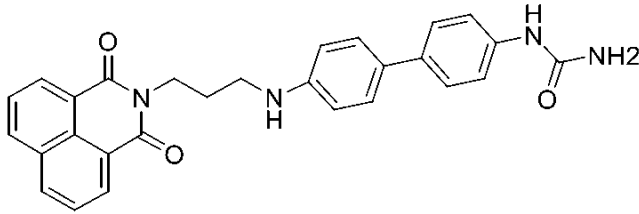
47. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 38 ile gösterilen yapıya sahiptir



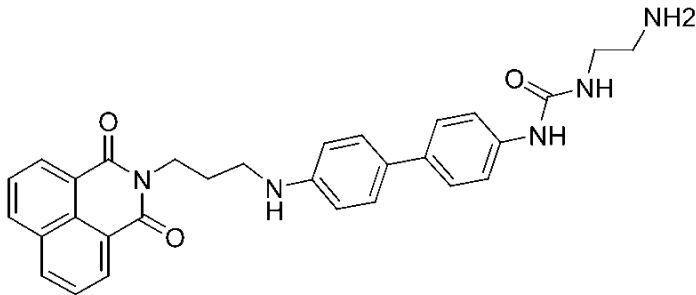
48. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 39 ile gösterilen yapıya sahiptir



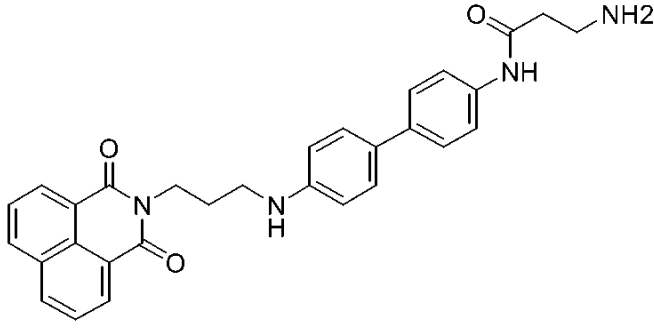
49. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 40 ile gösterilen yapıya sahiptir



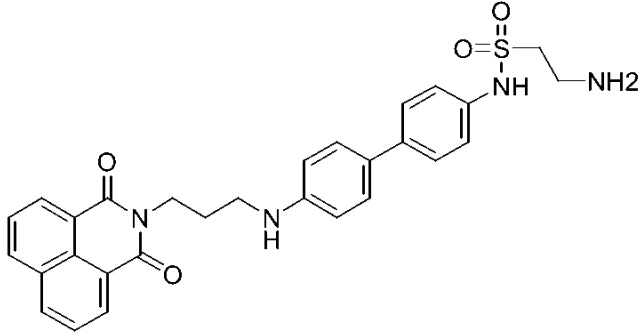
50. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 41 ile gösterilen yapıya sahiptir



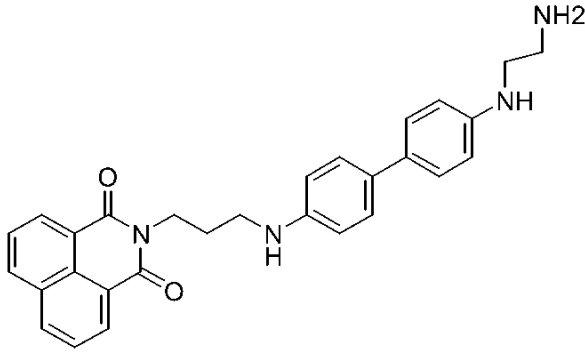
51. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 42 ile gösterilen yapıya sahiptir



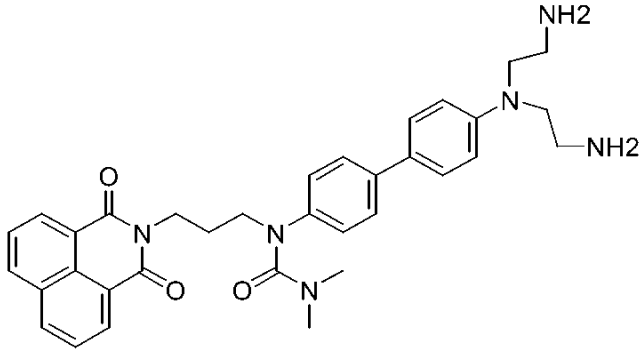
52. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 43 ile gösterilen yapıya sahiptir



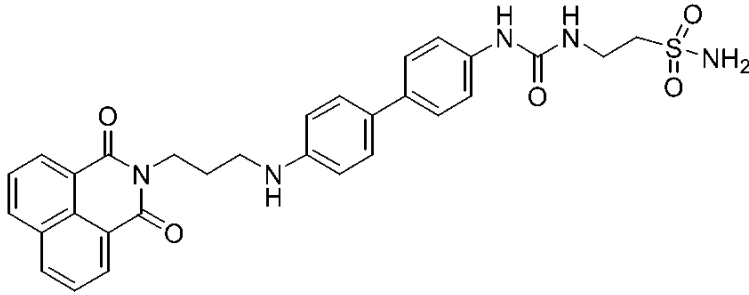
5 53. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 44 ile gösterilen yapıya sahiptir



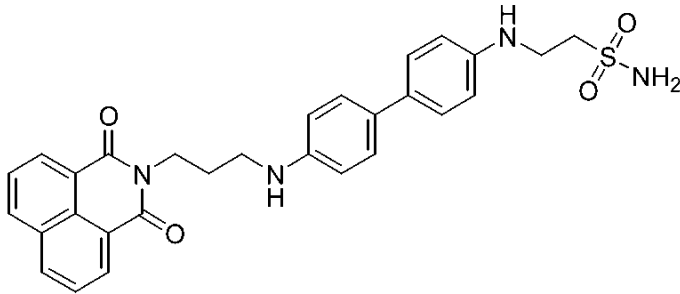
54. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 45 ile gösterilen yapıya sahiptir



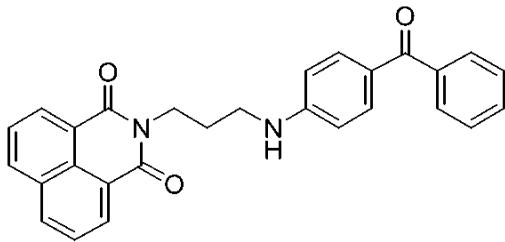
55. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 46 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 56. İstem 1'e göre formül I ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 47 ile gösterilen yapıya sahiptir

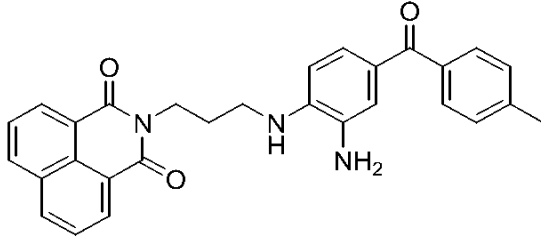


57. İstem 1'e göre formül II ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 48 ile gösterilen yapıya sahiptir

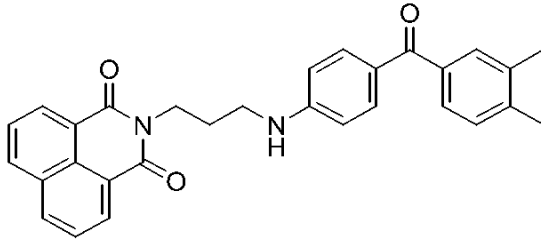


10

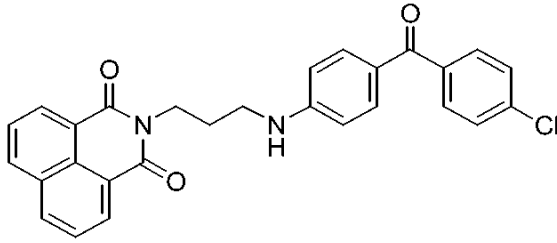
58. İstem 1'e göre formül II ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 49 ile gösterilen yapıya sahiptir



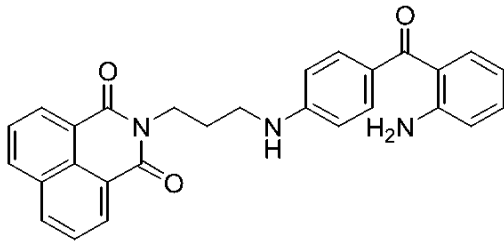
59. İstem 1'e göre formül II ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 50 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 60. İstem 1'e göre formül II ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 51 ile gösterilen yapıya sahiptir

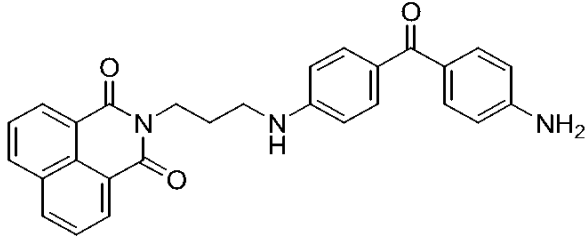


61. İstem 1'e göre formül II ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 52 ile gösterilen yapıya sahiptir

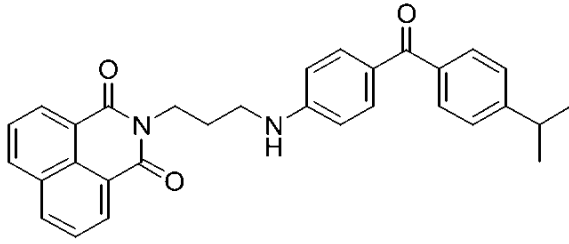


10

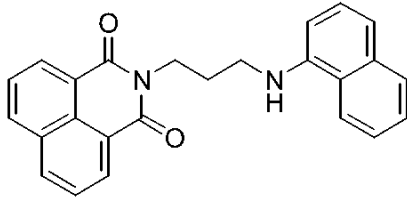
62. İstem 1'e göre formül II ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 53 ile gösterilen yapıya sahiptir



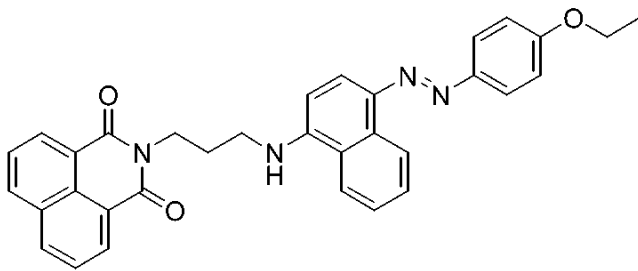
63. İstem 1'e göre formül II ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 54 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 64. İstem 1'e göre formül III ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 55 ile gösterilen yapıya sahiptir

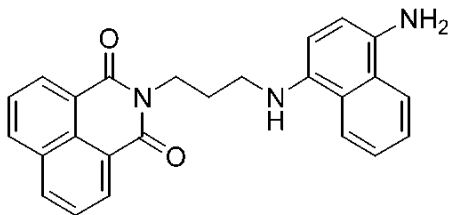


65. İstem 1'e göre formül III ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 56 ile gösterilen yapıya sahiptir

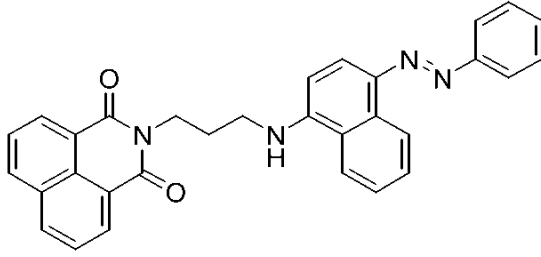


10

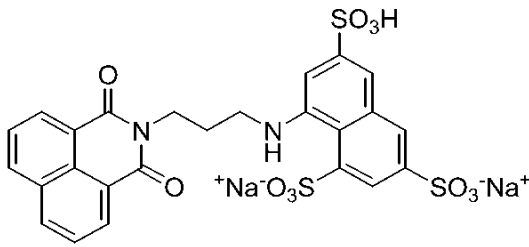
66. İstem 1'e göre formül III ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 57 ile gösterilen yapıya sahiptir



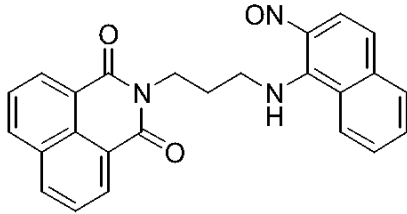
67. İstem 1'e göre formül III ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 58 ile gösterilen yapıya sahiptir



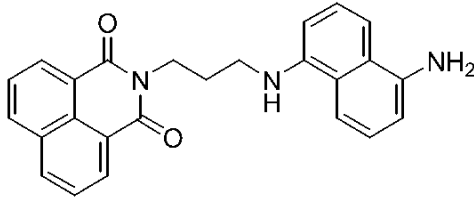
68. İstem 1'e göre formül III ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi
5 molekül formül 59 ile gösterilen yapıya sahiptir



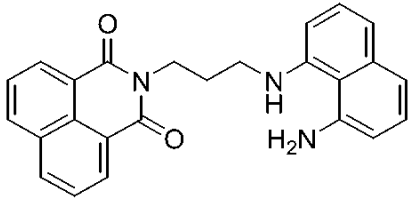
69. İstem 1'e göre formül III ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 60 ile gösterilen yapıya sahiptir



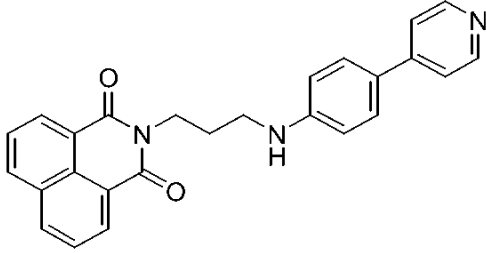
10 70. İstem 1'e göre formül III ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 61 ile gösterilen yapıya sahiptir



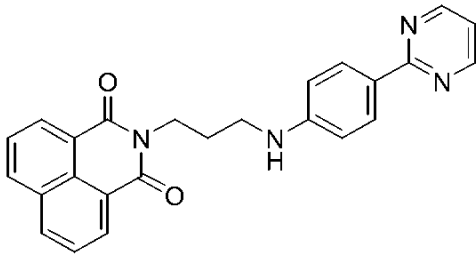
71. İstem 1'e göre formül III ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 62 ile gösterilen yapıya sahiptir



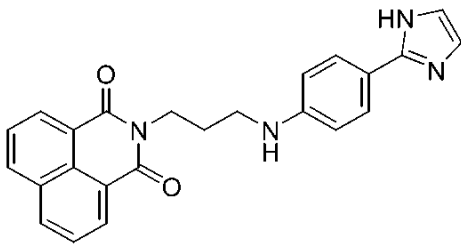
72. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 63 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 73. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 64 ile gösterilen yapıya sahiptir

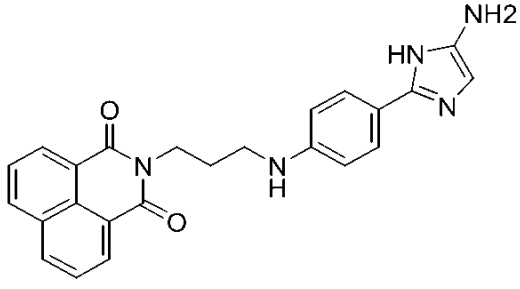


74. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 65 ile gösterilen yapıya sahiptir

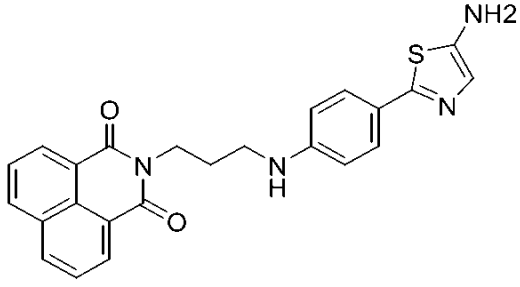


10

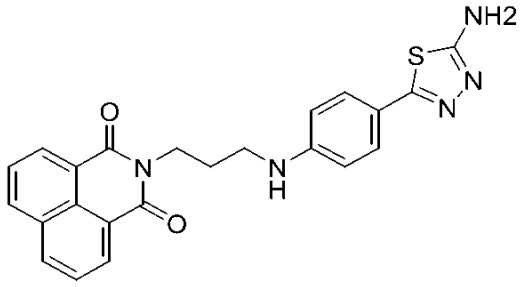
75. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 66 ile gösterilen yapıya sahiptir



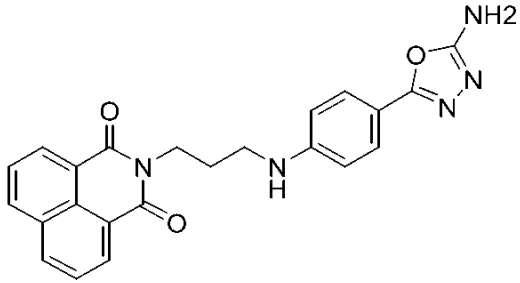
76. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 67 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 77. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 68 ile gösterilen yapıya sahiptir

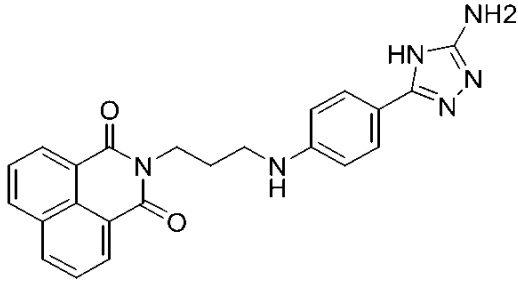


78. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 69 ile gösterilen yapıya sahiptir

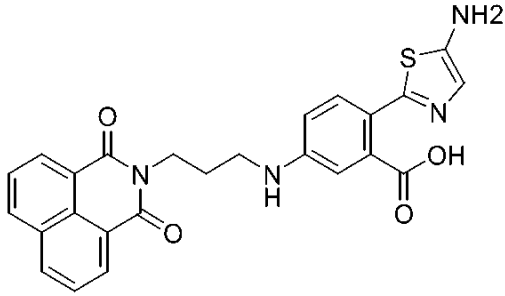


10

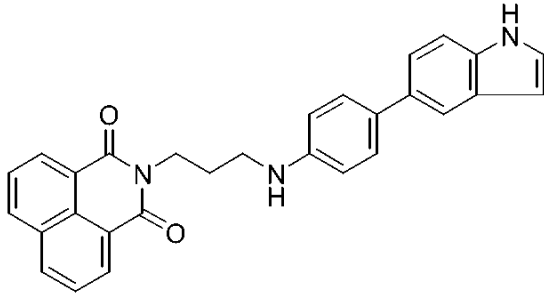
79. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 70 ile gösterilen yapıya sahiptir



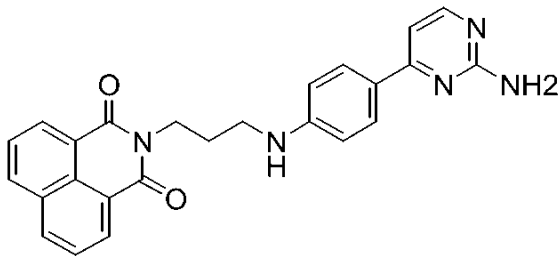
80. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 71 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 81. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 72 ile gösterilen yapıya sahiptir

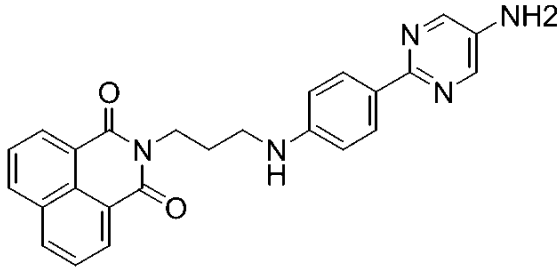


82. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 73 ile gösterilen yapıya sahiptir

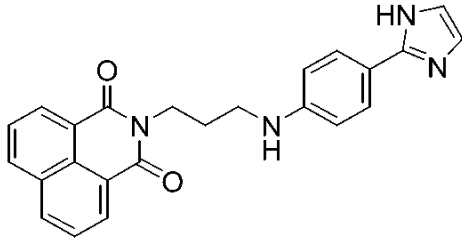


10

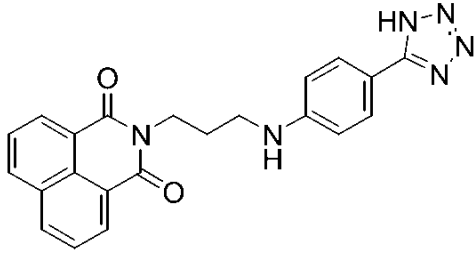
83. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 74 ile gösterilen yapıya sahiptir



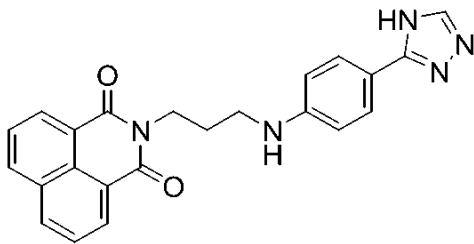
84. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 75 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 85. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 76 ile gösterilen yapıya sahiptir

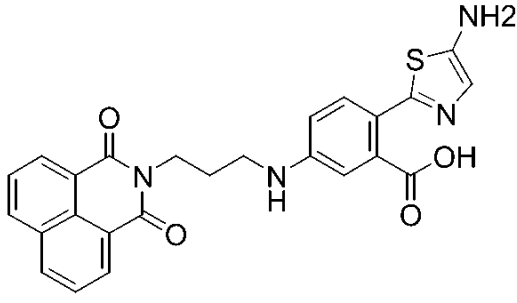


86. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 77 ile gösterilen yapıya sahiptir

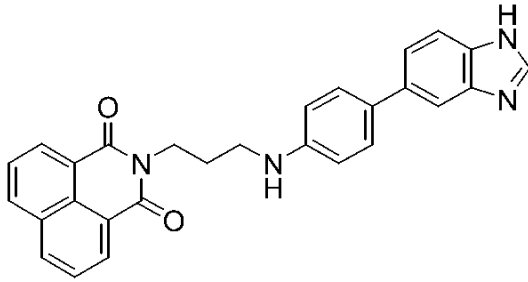


10

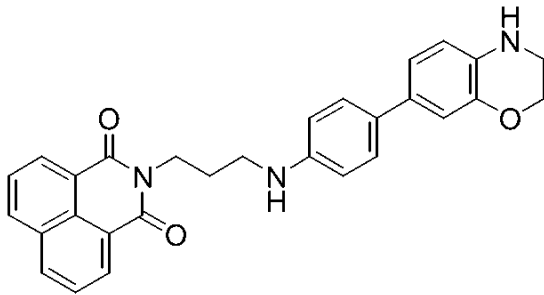
87. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 78 ile gösterilen yapıya sahiptir



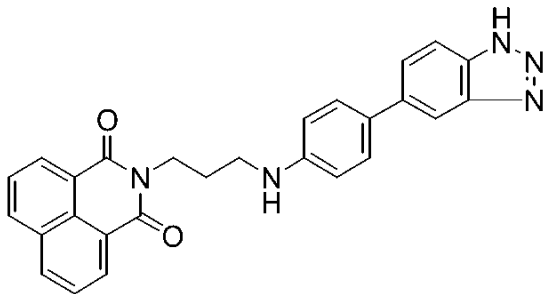
88. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 79 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 89. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 80 ile gösterilen yapıya sahiptir

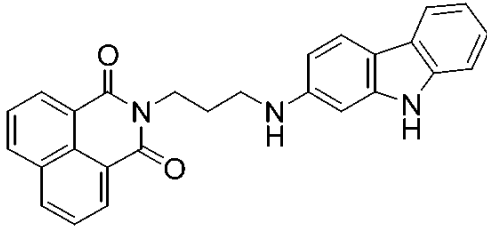


90. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 81 ile gösterilen yapıya sahiptir

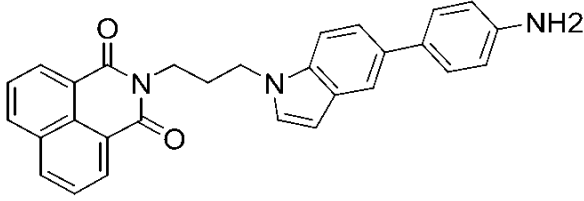


10

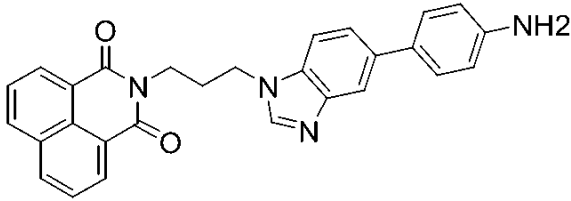
91. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 82 ile gösterilen yapıya sahiptir



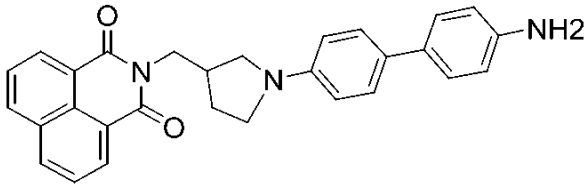
92. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 83 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 93. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 84 ile gösterilen yapıya sahiptir

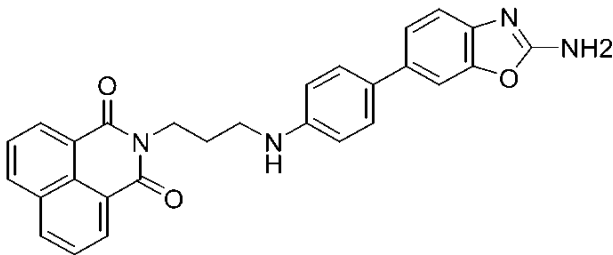


94. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 85 ile gösterilen yapıya sahiptir

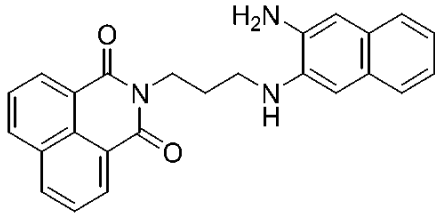


10

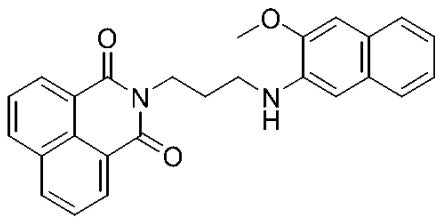
95. İstem 1'e göre formül IV ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 86 ile gösterilen yapıya sahiptir



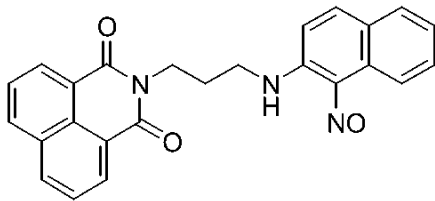
96. İstem 1'e göre formül V ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 87 ile gösterilen yapıya sahiptir



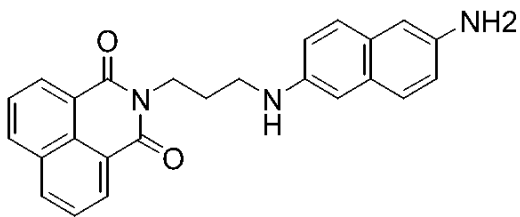
97. İstem 1'e göre formül V ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 88 ile gösterilen yapıya sahiptir



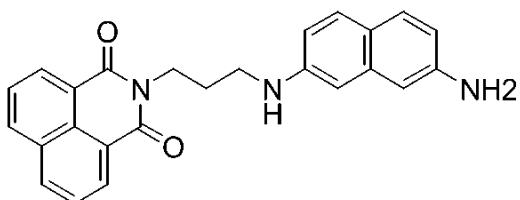
98. İstem 1'e göre formül V ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 89 ile gösterilen yapıya sahiptir



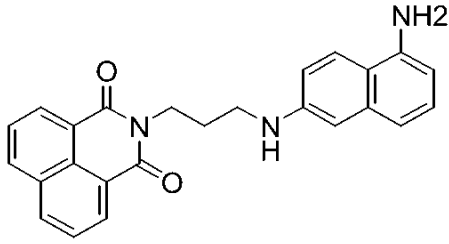
99. İstem 1'e göre formül V ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 90 ile gösterilen yapıya sahiptir



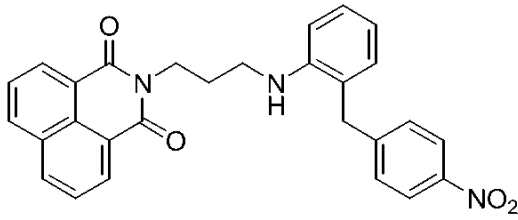
100. İstem 1'e göre formül V ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 91 ile gösterilen yapıya sahiptir



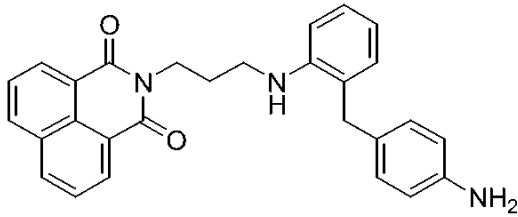
101. İstem 1'e göre formül V ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 92 ile gösterilen yapıya sahiptir



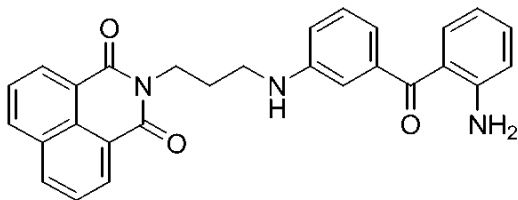
102. İstem 1'e göre formül VI ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 93 ile gösterilen yapıya sahiptir



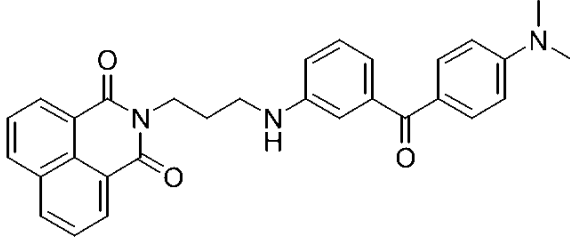
103. İstem 1'e göre formül VI ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 94 ile gösterilen yapıya sahiptir



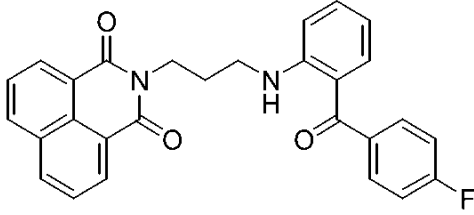
10 104. İstem 1'e göre formül VII ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 95 ile gösterilen yapıya sahiptir



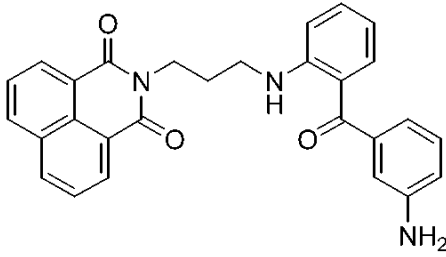
105. İstem 1'e göre formül VII ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 96 ile gösterilen yapıya sahiptir



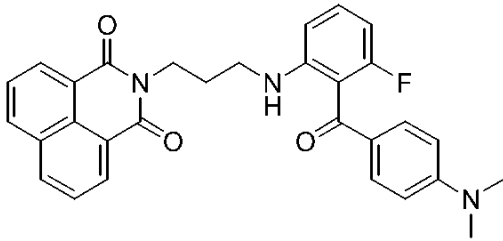
106. İstem 1'e göre formül VIII ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 97 ile gösterilen yapıya sahiptir



5 107. İstem 1'e göre formül VIII ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 98 ile gösterilen yapıya sahiptir



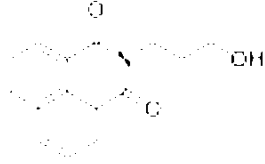
108. İstem 1'e göre formül VIII ile gösterilen bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi molekül formül 99 ile gösterilen yapıya sahiptir



10

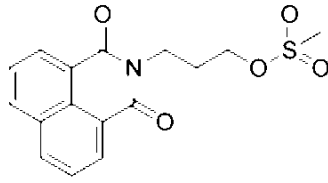
109. İstem 1-108'e göre bisnaphthalimidopropil (BNIP) türevi moleküllerin hazırlanmasında kullanılacak bir metot olup;

a) Formül X ile gösterilen maddenin çözücü varlığında para-metil sülfonil klorid ile reaksiyona sokulması,



Formül X

- b) Oluşan ara ürünün (Formül Y) çözücü varlığında NaI ile karıştırılması ve bu karışıma çözücü, tercihen asetonitril içerisinde, diamino bileşiği ile K_2CO_3 çözeltisi ilave edilmesi



Formül Y

- c) Son ürünün reaksiyon karışımından izole edilmesi adımlarını içerir.
110. İstem 109'a göre bir metot olup, a) ve b) adımımda kullanılacak çözücü asetik asit, aseton, asetonitril, benzen, 1-butanol, 2-butanol, 2-butanon, t-butil alkol, karbon tetraklorür, klorobenzen, kloroform, sikloheksan, 1,2-dikloroetan, dietilen glikol, dietileter, dietilen glikol dimetil eter, 1,2-dimetoksietan (DME), dimetilformamid (DMF), dimetilsülfoksit (DMSO), 1,4-dioksan, etanol, etil asetat, etilen glikol, gliserin, heptan, hekzametilfosforamid (HMPA), hekzametilfosforus triamid (HMPT), hekzan, metanol, metilt-bütıl eter (MTBE), metilen klorür (DCM), N-metil-2-pirolidon (NMP), nitrometan, pentan, petrol eteri, 1-propanol, 2-propanol, piridin, tetrahidrofuran (THF), tolüen, trietil amin, su, o-ksilen, m-ksilen, p-ksilen'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir.
111. İstem 109 ve 110'a göre bir metot olup a) adımımda çözücü olarak diklorometan ve b) adımımda çözücü olarak asetonitril kullanılır.
112. İstem 109-111'e göre bir metot olup 0-90 °C aralığında bir sıcaklıkta tercihen veya 25-80 °C aralığında bir sıcaklıkta gerçekleştirilir.
113. İstem 1-108'e göre Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bisnaftalimidopropil (BNIP)

türevi moleküllerin bakteriyel, viral, parazitik ve neoplastik hastalıkların tedavisinde ilaç olarak kullanımı.

114. İstem 113'e göre bir kullanım olup parazitik hastalık şistozomiyaz, opistorşiyaz, klonorkiyaz, dikrosölyoz, fasioliyazis, paragonimiyaz, fasiolopsiyaz, 5 ekinokokiyaz, tenyazis, sistiserkoz, difilobotriyaz, sparganoz, himenolepiyaz, drakunkuliyaz, onkoserkiyazis, filaryaz, elefantiyazis, mansonelloz, trişinelozis, ankilostomiyaz, nekatoryaz, ankilostomyazis, askardiyoz, strongiloidiyaz, trişüriyaz, enterobiyazis, anisakiyaz, helmintiyazis, trikostronjiloz, anjiyostrongiloz, gnatostomiyaz, anjiyostrongiloz, singamiyaz, hirudiniyaz, 10 akantosefallyaz, gongilonemiyaz, metastrongilyaz, telaziyaz, pediküloz, pithiriyaz, skabiyez, miyaz, tungiyaz, trombikuloz, skarabiazis, hirudiniyaz, linguatuloz, porosefaliyaz, leishmania, trypanosomiasis, plazmodyum falsiparum'un neden olduğu malarya, plazmodyum vivax'ın neden olduğu malarya, plazmodyum malariae'nin neden olduğu malarya, chagas hastalığı, 15 toksoplazma, pnömosistoz, babeziyoz, piroplazmoz, akantamebiyaz, naegleriyaz ve/veya mikrosporidioz olabilir.

115. İstem 114'e göre bir kullanım olup parazitik hastalık leishmaniasis'tir.

116. İstem 113'e göre bir kullanım olup parazitik hastalık *L. Arabica*, *L. archibaldi*, *L. aristedesii*, *L. braziliensis*, *L. chagasi*, *L. colombiensis*, *L. Deanei*, *L. donovani*, 20 *L. enriettii*, *L. equatorensis*, *L. forattinii*, *L. garnhami*, *L. gerbil*, *L. guyanensis*, *L. herreri*, *L. hertigi*, *L. infantum*, *L. killicki*, *L. lainsoni*, *L. major*, *L. Mexicana*, *L. naiiffi*, *L. panamensis*, *L. peruviana*, *L. pifanoi*, *L. shawi*, *L. tarentolae*, *L. tropica*, *L. turanica*, *L. venezuelensis* türü parazitlerin neden olduğu bir hastalıktır.

117. İstem 113'e göre bir kullanım olup bakteriyel hastalık basili, bartonella, 25 bordetella, borrelia, brusella, kampilobakter, kalamidya, kalamidofila, klostridyum, korinebakteryum, enterokokkus, eşerya, fransiyella, hemofilus, helikobakter, lejyonella, leptospira, listeria, mikobakteryum, mikoplazma, nisserya, psödomonas, riketsiya, salmonella, şigella, stafilokokkus, streptokokkus, treponema, üreplazma, vibrio, yersinia, ana gruplarına mensup bakteriler 30 nedeniyle oluşan herhangi bir bakteriyel hastalıktır.

118. İstem 117'ye göre bir kullanım olup bakteriyel hastalık bubonic veba, pnömonik veba, kolera, sifilis, konjenital sifilis, post streptokoksik

glomerulonefrit, lohusa humması, impetigo, yılanlık, ateşli romatizma, kızıl, streptokokkal faranjit, sepsis, akut bakteriyel pnömoni, menenjit, orta kulak iltihabı, endometrit, neonatal sepsis, neonatal menenjit, neonatal pnömoni, sistit, osteomiyelit, toksik şok sendromu, stafilokokkal gıda zehirlenmesi, şigelloz, salmonella, paratifo, tifo, kayalık dağlar lekeli humması, idrar yolu enfeksiyonları, kornea enfeksiyonları, pnömoni, endokardit, menenjit, gnore, pelvik enflamatuvar hastalığı, tüberküloz, cüzzam, listeriyoz, leptospiroz, lejyoner hastalığı, peptik ülser, üst solunum yolu enfeksiyonları, kronik gastrit, bronşit, septik artrit, tularemia, kanlı diyare, idrar yolu enfeksiyonları, endokardit, safra yolu enfeksiyonları, difteri, tetanoz, papağan humması, trachoma, neonatal konjunktivit, üretrit, epididimit, prostatit, lenfogradüloz, atipik pnömoni, Guillain-Barre Sendromu, broselloz, malta humması, lyme hastalığı olabilir.

119. İstem 113'e göre bir kullanım olup viral hastalık adenoviridae, herpesviridae, papillomaviridae, polyomaviridae, poxviridae, heradnaviridae, parvoviridae, astroviridae, caliciviridae, picornaviridae, coronaviridae, flaviviridae, togaviridae, hepeviridae, retroviridae, ortomiksoviridae, arenaviridae, bunyaviridae, filoviridae, paramiksoviridae, rabdoviridae, reoviridae ana ailelerine mensup olan herhangi bir virüsün neden olduğu bir hastalık olabilir.

120. İstem 119'a göre bir kullanım olup viral hastalık gastroenterit, keratokonjunktivit, farenjit, krup, pnömoni, sistit, el-ayak-ağız hastalığı, pleurodria, septik menenjit, perikardit, miyokardit, Burkitt'e Lenfoma, Hodgkin's lenfoma, nasafaranjiyel karsinom, akut hepatit, kronik hepatit, hepatic siroz, hepatoselüler karsinom, tonsilit, sitomegalik inklüzyon hastalığı, Kaposi sarkomu, castleman hastalığı, influenza, kızamık, reye sendromu, kabakulak, anogenital siğil, poliomyelit, kuduz, konjenital rubella, kızamıkçık, çiçek hastalığı, zona, konjenital su çiçeği sendromu olabilir.

121. İstem 113'e göre bir kullanım olup neoplastik hastalık kanser hastalığı örneğin; karsinoma, lenfoma, blastoma sarkoma veya lösemi olabilir.

122. İstem 121'e göre bir kullanım olup kanser hastalığı; meme kanseri, prostat kanseri, kolorektal kanser, deri kanseri, küçük hücreli akciğer kanseri, küçük hücreli olmayan akciğer kanseri, mezotelyom, gastrointestinal kanser, pankreas kanseri, gliyoblastom, vulva kanseri, rahim ağzı kanseri, endometriyal karsinom,

yumurtalık kanseri, karaciğer kanseri, hepatom, mesane kanseri, böbrek kanseri, tükürük bezi karsinomu, tiroid kanseri ve çeşitli baş ve boyun kanserleri olabilir.

123. İstem 1-108'e göre Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşikler içeren farmasötik bileşimler.

124. İstem 123'e göre farmasötik bileşim olup Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşiklere ilaveten en az bir diğer etken madde içerir.

125. İstem 124'e göre farmasötik bileşim olup diğer etken madde antiparazitik, antibakteriyel, antiviral, antineoplastik ve/veya sitotoksik ve/veya antimetastatik etki gösteren bilinen aktif bileşiklerle veya bunların ikili, üçlü kombinasyonları içerisinde seçilir.

126. İstem 125'e göre farmasötik bileşim olup antibakteriyel etki gösteren aktif bileşik amikasin, gentamisin, kanamisin, neomisin, netilmisin, tobramisin, paromisin, streptomisin, spektinomisin, geldanamisin, herbimisin, rifaksimin, lorakarbef, ertapenem, doripenem, imipenem, meropenem, sefadroksil, sefazolin, sefalotin, sefalekssin, sefaklor, sefamandol, sefoksitin, sefprozil, sefuroksim, sefiksim, sefdinir, sefditoren, sefoperazon, sefotaksim, sefpodoksime, seftazidim, seftibüten, seftizoksime, sefepim, seftarolin fosamil, seftobiprol, teikoplanin, vankomisin, televansin, dalbavansin,oritavansin, clindamisin, linkomisin, daptomisin, azitromisin, klaritromisin, diritromisin, eritromisin, roksitromisin, troleandomisin, telitromisin, spiramisin, aztreonam, furazolidon, nitrofurantoin, linezolid, posizolid, radezolid, torezolid, amoksisilin, ampisilin, azlosilin, karbenisilin, kloksasilin, dikloksasilin, flukloksasilin, mezlosilin, metisilin, nafsilin, okzasilin, penisilin G, penisilin V, piperasilin, temosilin, tikarsilin, klavulanat, sulbaktam, tazobaktam, basitrasin, kolistin, polimiksin B, siprofloksasin, enoksasin, gatifloksasin, gemifloksasin, levofloksasin, lomefloksasin, moksifloksasin, nalidixik asit, norfloksasin, ofloksasin, trovafloksasin, grepafloksasin, sparfloksasin, temafloksasin, mafenid, sulfasetamid, sulfadiazin, sülfadimetoksin, sülfametizol, sülfametoksazol, sulfanilimid, sülfasalazin, sülfisoksazol, trometoprim, demeklosiklin, doksisisiklin, minosiklin, oksitetrasiklin, tetrasiklin, klofazimin, dapson, kapreomisin,

sikloserin, etambutol, isoniyazid, pyrazinamid, rifampisin, rifabutin, rifapentin, streptomisin, arsfenamin, kloramfenikol, fosfomisin, fusidik asit, metronidazol, mupirosin, platensimisin, kinupristin, dalfopristin, tiamfenikol, tigesiklin, tinidazol, trimetoprim'i içeren grubun içerisinde veya burada sayılan ajanların ikili veya üçlü kombinasyonları içerisinde seçilir.

127. İstem 125'e göre bir farmasötik bileşim olup antiviral etki gösteren aktif bileşikler abakavir, asiklovir, adefovir, amantadin, amprenavir, ampligen, arbidol, atazanavir, atipla, balavir, sidofovir, kombivir, dolutegravir, darunavir, delavirdin, didanosin, dokosanol, eduksudin, efavirenz, emtrisitabin, enfuvirtid, entekavir, ekoliver, famsiklovir, fomivirsen, fosamprenavir, foskarnet, fosfonet, gansiklovir, ibasitabin, imunovir, idoksüridin, imikuimod, indinavir, inosin, interferon tip I, interferon tip II, interferon tip III, interferon, lamivudin, lopinavir, lovrid, maravirok, moroksidin, metisazon, nelfinavir, nevirapin, neksavir, nitazoksanit, novir, oseltamivir, peginterferon alfa-2a, pensiklovir, peramivir, plekonaril, podofilotoksin, proteaz inhibitörü, nükleosit analogları, ralgetavir, ribavirin, rimantadin, ritonavir, piramidin, saquinavir, sofosbuvir, stavudin, telaprevir, tenofovir, tipranavir, triflüridine, trizivir, tromantadin, trovada, valasiklovir, valgansiklovir, vidarabin, viramidin, zalsitabin, zanamivir, zidovudin'i içeren grubun içerisinde veya burada sayılan ajanların ikili veya üçlü kombinasyonları içerisinde seçilir.

128. İstem 125'e göre bir farmasötik bileşim olup antiparazitik etki gösteren aktif bileşikler nitazoksanit, melarsoprol, eflornitin, metronidazol, tinidazol, miltefosin, mebendazol, pirantel pamoat, tiyabendazol, dietilkarbamazin, ivermektin, niklosamid, prazikuantel, albendazol, rifampin, amfoterisin B, fumagillin, furazolidon, nifursemizon, nitaksozanid, ornidazol, paramomisin sülfat, pentamidin, pirimetamine, tinidazol, albendazol, mebendazol, tiyabendazol, fenbendazol, triklabendazol, flubendazol, abamektin, dietilkarbamazin, ivermektin, suramin, pirantel pamoat, levamisol, niklosamid, nitaksozanid, oksiklonazd, monepantel, derquantel, amfoterisin B, üre stibamin, sodyum stiboglukonat, meglumin antimoniat, paromomisin, miltefosin, flukonazol, pentamidin'den oluşan bir grubun içerisinde veya bunların ikili, üçlü kombinasyonları içerisinde seçilir.

129. İstem 125'e göre bir farmasötik bileşim olup antineoplastik etki gösteren aktif bileşikler siklofosfamid, ifosfamid, temozolomid, kapesitabin, 5-floro urasil, metotreksat, gemesitabin, pemetrekset, mitomisin, bleomisin, epirubisin, doksorubisin, etoposif, paklitaksel, irinotekan, dosetaksel, vinkristin, karboplatin, cisplatin, okzaliplatin, bevacizumab, setuksimab, gefitinib, imatinib, trastuzumab, denosumab, rituksimab, sunitinib, zoledronat, abirateron, anastrozol, bikalutamid, eksemestan, goserelin, medroksiprogesteron, oktreotid, tamoksifen, bendamustin, karmustin, klorambusil, lomustin, melfalan, prokarbazin, streptozosin, fludarabin, raltitrexed, aktinomisin D, daktinomisin, doksorubisin, mitoksantron, eribulin, topotekan, vinblastin, vinorelbin, afatinib, aflibersept, krizotinib, dabrafenib, interferon, ipilimumab, lapatinib, nivolumab, panitumumab, pembrolizumab, pertuzumab, sorafenib, trastuzumab emtansin, temsorilimus, vemurafenib, ibandronik asit, pamidronat, bexarotan, buserelin, siproteron, degarelik, folinik asit, fulvestrant, lanreotid, lenalidomid, letrozole, leuprorelin, megestrol, mesna, talidomid'den oluşan bir grubun içerisinde veya bunların ikili veya üçlü kombinasyonları içerisinde seçilir.
130. İstem 123-129'dan herhangi birine göre bir farmasötik bileşim olup en az bir yardımcı madde içerir.

TARİFNAME

ÖZGÜN BİSNAFTALİMİDOPROPİL (BNIP) TÜREVİ AKTİF İLAÇ ETKEN MADDELERİ

5

Mevcut buluş bisnaftalimidopropil (BNIP) türevi özgün ilaç moleküllerine ve söz konusu özgün ilaç moleküllerinin viral, bakteriyel ve neoplastik hastalıkların tedavisinde kullanımına ve söz konusu özgün moleküllerin viral, bakteriyel ve neoplastik hastalıkların tedavisinde kullanıma uygun bir farmasötik bileşimin hazırlanmasında kullanılmasına ilişkindir.

10

Tekniğin bilinen durumu

Bakteriyel, viral ve neoplastik hastalıklar dünya popülasyonunun önemli kısmını etkilemekte ve ortalama insan ömrü, yaşam kalitesi v.b. parametrelerin belirlenmesinde önemli rol oynamaktadır. Bu tip hastalıklar hem iş gücünde önemli kayıplara hem de tedavi masrafı nedeniyle ekonomik yüke neden olmaktadır.

15

Bilinen teknikte bakteriyel, viral, parazitik ve neoplastik hastalıkların tedavisi için ajanlar bulunmaktadır ancak yine de etkin tedavi sağlayacak özgün ajanlara ihtiyaç duyulmaktadır.

Özellikle, teknolojinin bilinen durumunda var olan ilaçların sayıca az olması, uygulama yöntemlerinin medikal gözlem gerektirmesi ve ciddi yan etkilerinin olması bu hastalığın tedavisini zorlaştırmaktadır bu durum yeni etken maddelerin geliştirilmesi ihtiyacını doğurmaktadır.

20

Yapılan çalışmalar neticesinde, mitonafid gibi naftalimid bileşiklerinin rahim kanseri ve lösemi üzerinde etkili olduğu bulunmuştur, ancak yapılan klinik çalışmalarda doz artışıyla beraber bu ajanların merkezi sinir sistemi toksisitesine yol açtığı görülmüştür.

25

Tekniğin bilinen durumu göz önüne alındığında, buluş sahipleri bilinen moleküllerin, örneğin naftalimid türevi moleküllerin, sahip olduğu olumsuz yönleri ortadan kaldıran ve viral parazitik, neoplastik hastalıkların tedavisinde kullanıma uygun bir molekül geliştirmeyi amaçlamaktadırlar.

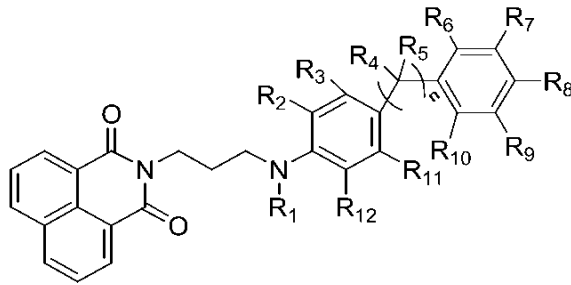
30

Buluşun bir diğer amacı ise bilinen moleküllerin aksine, doz kısıtlayıcı toksisite problemleri olmayan, çözünürlüğü ve biyoyararlanımı yüksek yeni moleküller geliştirmektir.

Bu amaçlar doğrultusunda çalışmalar gerçekleştiren buluş sahipleri formül I, formül II, formül III, formül IV, formül V, formül VI, formül VII, formül VIII ile gösterilen ve bakteriyel, viral, neoplastik hastalıkların tedavisinde kullanıma uygun molekülleri geliştirmişlerdir.

Buluşun Detaylı Anlatımı

Mevcut buluş Formül I ile gösterilen moleküllere ilişkindir.



Formül I

burada

n 0 ile 12 arasında bir doğal sayı olup;

R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁ ve R₁₂ birbirinden bağımsız olarak;

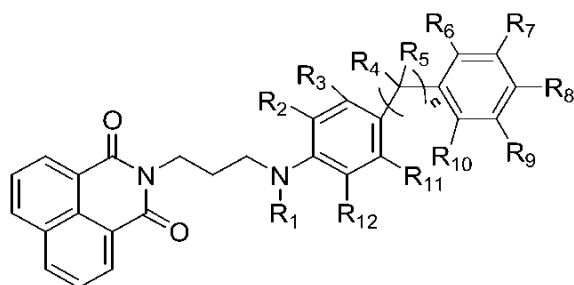
-H, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -NHNHR_X, -N(R_X)(NHR_Y), -N(R_X)(NR_YR_Z), R_X, R_Y, R_Z, Cl, F, Br, I, -OH, -NO, -NO₂, -COOH, -OR_X, -SO₂R_X, -SO₂NHR_X, -SO₂NR_XR_Y, -CN, -COOR_X, -CONHR_X, -CONR_XR_Y, -NHCOCH₂R_X, -NHCOCHR_XR_Y, -NHCNHR_X, -NHCOR_X, -NHCONHR_X, -NHCO₂R_X'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir ve;

R_X, R_Y ve R_Z birbirinden bağımsız olarak; ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkan, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alken, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 primer amin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 sekonder amin, ikameli veya ikamesiz alkol, ikameli veya ikamesiz alkil siyanid, ikameli veya ikamesiz sülfonamid, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkyl sülfonil, ikameli veya ikamesiz C3-C8 sikloalkil, ikameli veya ikamesiz aril, ikameli veya ikamesiz heteroaril, isteğe bağlı olarak birbirinden bağımsız olarak O, S ve N içerisinde

Mevcut buluş kapsamında kullanılan “alkan” terimi düz veya dallanmış doymuş hidrokarbon zincirlerini ifade etmektedir.

Mevcut buluş kapsamında kullanılan “alkin” terimi en az bir karbon-karbon üçlü bağı içeren düz veya dallanmış hidrokarbon zincirlerini ifade etmektedir.

10 gösterilmekte olup



Formül I

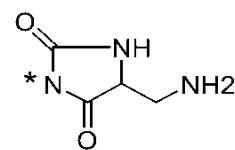
n 0 veya 1 veya 2 veya 3 veya 4 veya 5 veya 6 veya 7 veya 8 veya 9 veya 10 veya 11 veya 12 değerini alır;

15 $R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6, R_7, R_8, R_9, R_{10}, R_{11}$ ve R_{12} birbirinden bağımsız olarak;

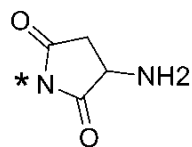
[illegible]

20 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_3$, Cl, F, Br, I, $-\text{OH}$, -
 OCH_3 , $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{NHCH}_3$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
25 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_3)$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)$, -
 $\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)$, $\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHNH}_2$, $-\text{NHNHCH}_3$, $-\text{NHNHCH}_2\text{CH}_3$, -

- $\text{NHNHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{NHN}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHN}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHN}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, -
 $\text{N}(\text{CH}_3)(\text{NHCH}_3)$, $-\text{N}(\text{CH}_3)(\text{N}(\text{CH}_3)_2)$, $-\text{COOH}$, $-\text{SO}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, -
 $\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CN}$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHCH}_3$, $-\text{CONHCH}_2\text{CH}_3$, -
5 $\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CON}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CON}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, -
 $\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{CON}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)$, -
 $\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{COCH}_3$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
10 COOCH_3 , $-\text{COOCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{COCH}(\text{CH}_3)_2$, -
 $\text{COC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{COCH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{COCH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, -
 SO_2NH_2 , SO_2NHCH_3 , $\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, -
15 $\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)$, -
 $\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCONHCH}_3$, $-\text{NHCON}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCONHCH}_2\text{CH}_3$, -
 $\text{NHCON}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{NHCON}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_3)(\text{NH}_2)$, -
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_3)(\text{NHCH}_3)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_3)(\text{N}(\text{CH}_3)_2)$, -
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{OH})(\text{NH}_2)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH})(\text{NH}_2)$, -
20 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH})(\text{NHCH}_3)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{OH})(\text{NHCH}_3)$,
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{OH})(\text{N}(\text{CH}_3)_2)$, $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{OH})(\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2)$, -
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{SH})(\text{NH}_2)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SH})(\text{NH}_2)$, -
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SH})(\text{NH}_2)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{SH})(\text{NHCH}_3)$, -



$\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{SH})(\text{NHCH}_2\text{CH}_3)$, $-\text{NHCOCH}(\text{CH}_2\text{SH})(\text{N}(\text{CH}_3)_2)$,

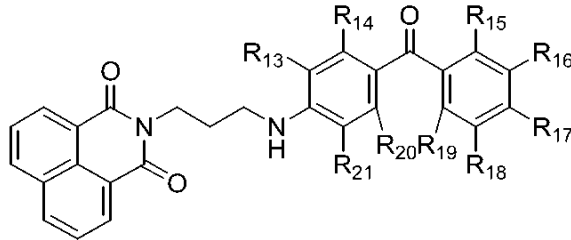


- 25 $-\text{NH}(\text{CNH})\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CN}(\text{CH}_3))\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CN}(\text{CH}_2\text{CH}_3))\text{NH}_2$, -
 $\text{NH}(\text{CN}(\text{CH}_3))\text{NH}(\text{CH}_3)$, $-\text{NH}(\text{CN}(\text{CH}_3))\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NH}(\text{CNH})\text{NHCH}_3$,
 $\text{NH}(\text{CNH})\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{NHCH}_2\text{NH}_2$, -
 $\text{NH}(\text{CO})\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2)$, -
 $\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{NH}_2$, $-\text{NH}(\text{CO})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2$, -

- NH(CO)CH₂CH₂CH₂CH₂NH₂, -NH(CO)CH₂CH₂NHCH₃, -NH(CO)CH₂CH₂N(CH₃)₂,
 -NH(CO)CH₂CH₂NH(CH₂CH₃), -NH(CO)CH₂CH₂N(CH₃)(CH₂CH₃), -
 NHSO₂CH₂CH₂NH₂, -NHSO₂CH₂CH₂CH₂NH₂, -NHSO₂CH₂CH₂NHCH₃, -
 NHSO₂CH₂CH₂N(CH₃)₂, -NHSO₂CH₂CH₂N(CH₃)(CH₂CH₃), -
 5 NHSO₂CH₂CH₂N(CH₂CH₃)(CH₂CH₃), -NHCH₂CH₂NH₂, -NHCH₂NH₂, -
 NHCH₂CH₂CH₂NH₂, -NHCH₂CH₂CH₂CH₂NH₂, -NHCH₂CH₂NHCH₃, -
 NHCH₂CH₂N(CH₃)₂, -N(CH₂CH₂NH₂)₂, -N(CH₂CH₂CH₂NH₂)₂, -N(CH₂NH₂)₂, -
 N(CH₂NHCH₃)₂, -N(CH₂CH₂NHCH₃)₂, -N(CH₂CH₂CH₂NHCH₃)₂, -
 NHCONHCH₂CH₂SO₂NH₂, -NHCONHCH₂CH₂CH₂SO₂NH₂, -
 10 NHCON(CH₃)(CH₂CH₂CH₂SO₂NH₂), -NHCON(CH₂CH₃)(CH₂CH₂CH₂SO₂NH₂), -
 NHCON(CH₃)(CH₂CH₂SO₂NH₂), -NHCONHCH₂CH₂SO₂NHCH₃, -
 NHCONHCH₂CH₂SO₂NHCH₂CH₃, - NHCONHCH₂CH₂SO₂N(CH₃)₂, -
 NHCH₂CH₂SO₂NH₂, -NHCH₂CH₂CH₂SO₂NH₂, - NHCH₂CH₂CH₂CH₂SO₂NH₂, -
 NHCH₂CH₂SO₂NHCH₃, -NHCH₂CH₂SO₂N(CH₃)₂'den oluşan bir grubun içerisinde
 15 seçilir.

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I ile gösterilen moleküllerde n=0 olduğunda R₄ ve R₅ boştur.

Buluşun bir diğer unsuru Formül II ile gösterilen moleküllerdir;



20 Formül II

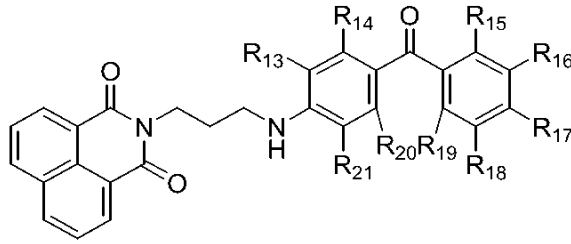
Burada R₁₃, R₁₄, R₁₅, R₁₆, R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀, R₂₁ birbirinden bağımsız olarak;

-H, -Cl, -F, -Br, -I, R_X, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -OH, -NO, -NO₂, -COOH, -OR_X, -COOR_X, -CN içerisinde seçilir ve

- R_X ve R_Y birbirinden bağımsız olarak; ikameli veya ikamesiz C₁-C₁₂ alkan, ikameli
 25 veya ikamesiz C₁-C₁₂ alken, ikameli veya ikamesiz C₁-C₁₂ alkin, ikameli veya
 ikamesiz C₁-C₁₂ primer amin, ikameli veya ikamesiz C₁-C₁₂ sekonder amin, ikameli
 veya ikamesiz alkol, ikameli veya ikamesiz alkil siyanid, ikameli veya ikamesiz
 sülfonamid, ikameli veya ikamesiz C₁-C₁₂ alkyl sülfonil, ikameli veya ikamesiz C₃-

C8 sikloalkil, ikameli veya ikamesiz aril, ikameli veya ikamesiz heteroaril, isteğe bağlı olarak birbirinden bağımsız olarak O, S ve N içerisinden seçilen bir veya daha fazla heteroatom içeren ikameli veya ikamesiz heterosiklik veya heteroaromatik halkalardan oluşan grubun içerisinden seçilir.

- 5 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında buluşa uygun moleküller Formül II ile gösterilmekte olup ;

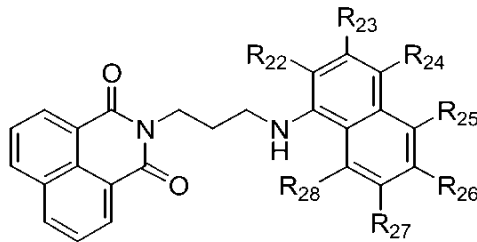


Formül II

Burada R₁₃, R₁₄, R₁₅, R₁₆, R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀, R₂₁ birbirinden bağımsız olarak;

- 10 -H, -Cl, -F, -Br, -I, -NH₂, -CH₃, C(CH₃)₂'den oluşan bir grubun içerisinden seçilir.

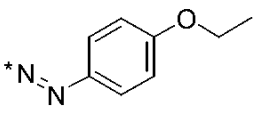
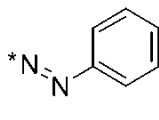
Buluşun bir diğer unsuru Formül III ile gösterilen moleküllerdir



Formül III

Burada R₂₂, R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆, R₂₇, R₂₈ birbirinden bağımsız olarak

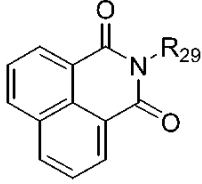
- 15 -H, -Cl, -F, -Br, -I, R_X, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -OH, -COOH, -OR_X, -COOR_X, -CN, -

SO₃H, -SO₃⁻Na⁺, , , -NO içerisinden seçilir ve

R_X ve R_Y birbirinden bağımsız olarak; ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkan, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alken, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 primer amin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 sekonder amin, ikameli veya ikamesiz alkol, ikameli veya ikamesiz alkil siyanid, ikameli veya ikamesiz sülfonamid, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkyl sülfonil, ikameli veya ikamesiz C3-

C8 sikloalkil, ikameli veya ikamesiz aril, ikameli veya ikamesiz heteroaril, isteğe bağlı olarak birbirinden bağımsız olarak O, S ve N içerisinden seçilen bir veya daha fazla heteroatom içeren ikameli veya ikamesiz heterosiklik veya heteroaromatik halkalardan oluşan grubun içerisinden seçilir.

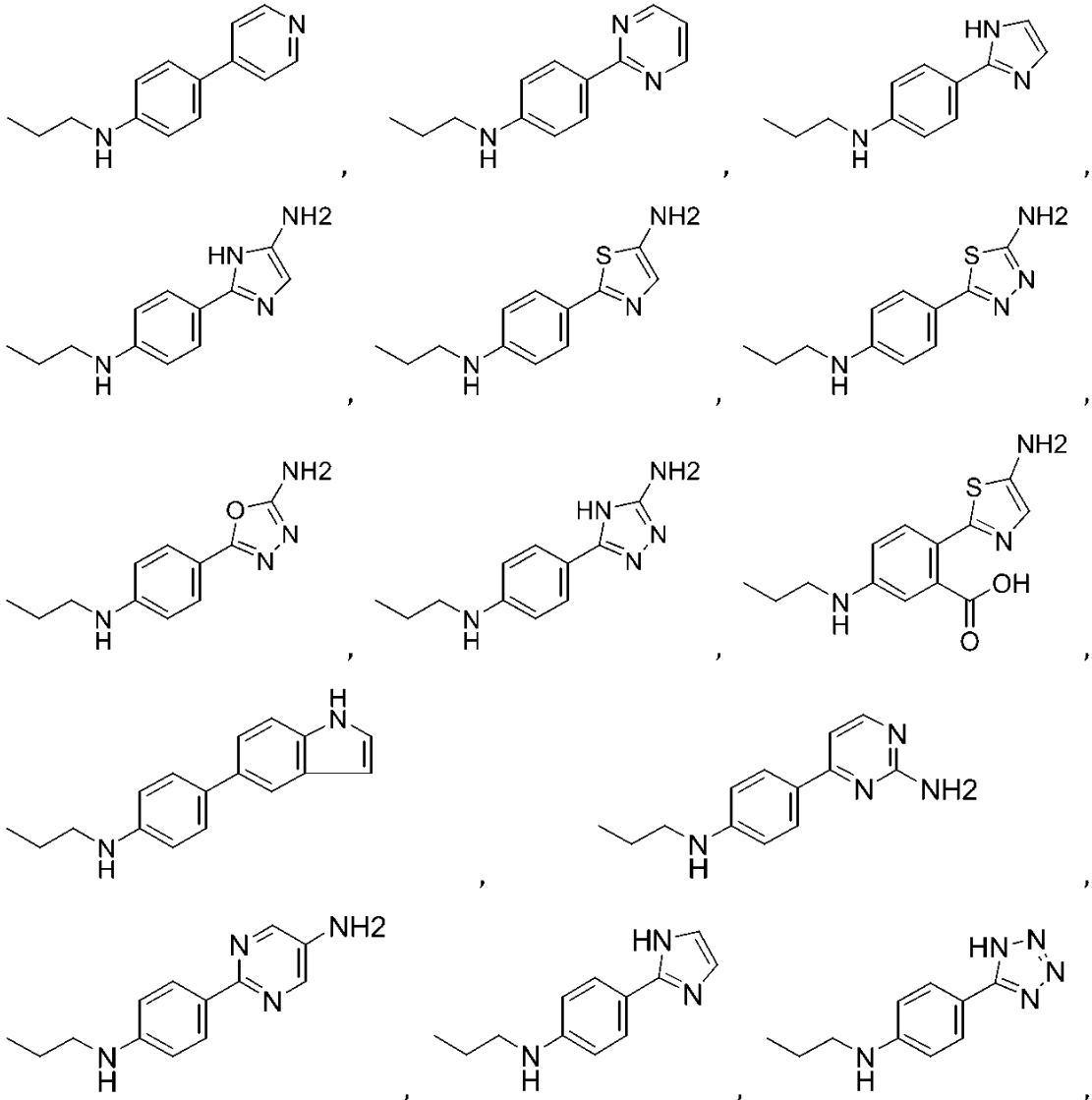
5 Buluşun bir diğer unsuru Formül IV ile gösterilen moleküllerdir

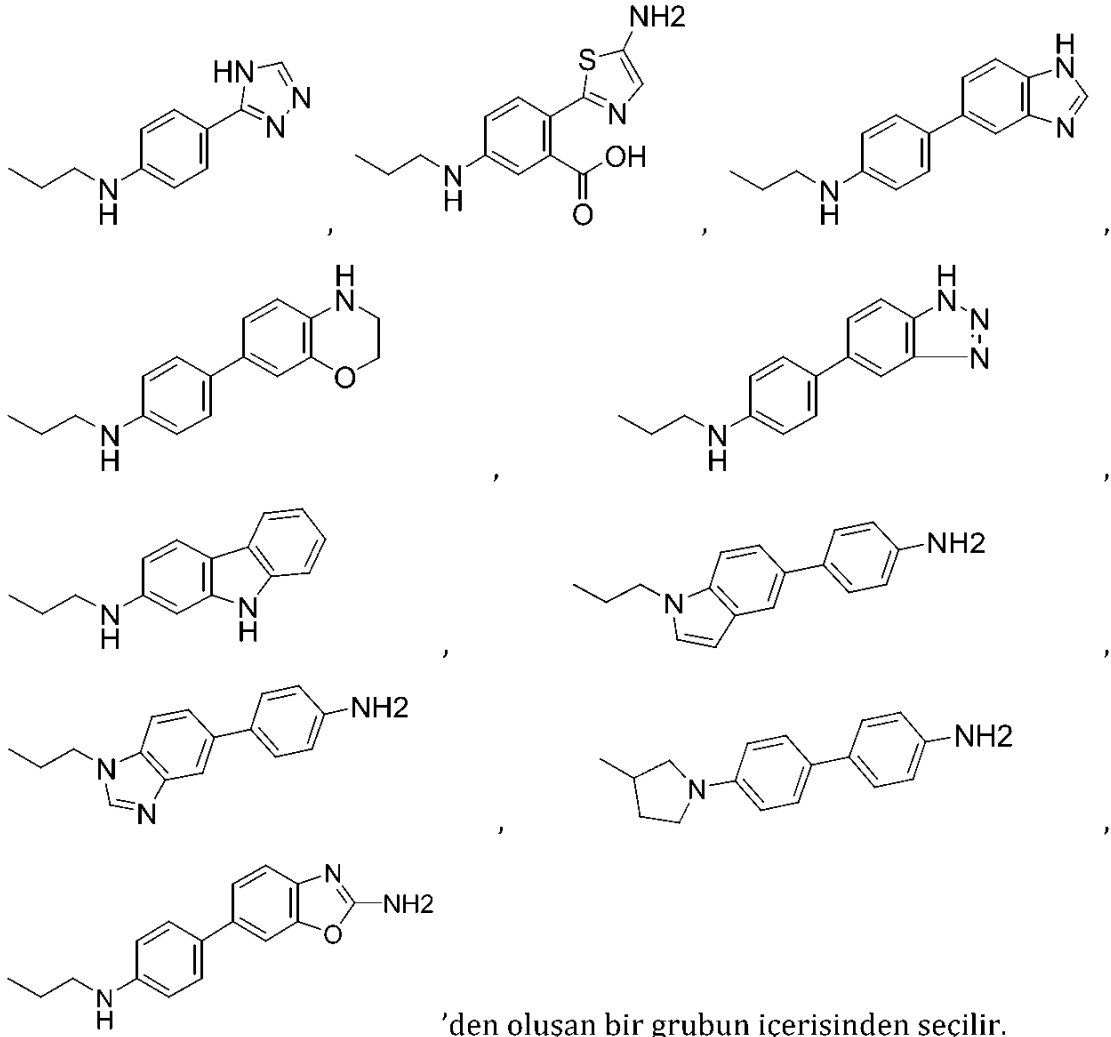


Formül IV

Burada R₂₉;

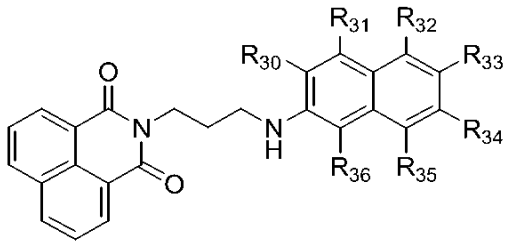
10





'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir.

Buluşun bir diğer unsuru Formül V ile gösterilen moleküllerdir



Formül V

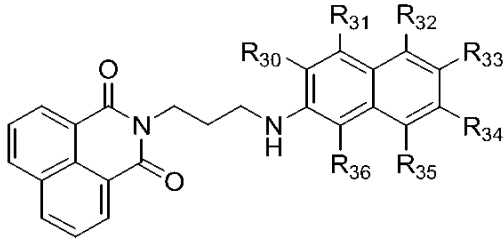
Burada R_{30} , R_{31} , R_{32} , R_{33} , R_{34} , R_{35} , R_{36} birbirinden bağımsız olarak;

- 10 -H, -Cl, -F, -Br, -I, R_X , $-NH_2$, $-NHR_X$, $-NR_XR_Y$, -OH, -NO, -COOH, $-OR_X$, $-COOR_X$, -CN'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir ve

R_X ve R_Y birbirinden bağımsız olarak; ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkan, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alken, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 primer amin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 sekonder amin, ikameli

- veya ikamesiz alkol, ikameli veya ikamesiz alkil siyanid, ikameli veya ikamesiz sülfonamid, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkyl sülfonil, ikameli veya ikamesiz C3-C8 sikloalkil, ikameli veya ikamesiz aril, ikameli veya ikamesiz heteroaril, isteğe bağlı olarak birbirinden bağımsız olarak O, S ve N içerisinden seçilen bir veya daha fazla heteroatom içeren ikameli veya ikamesiz heterosiklik veya heteroaromatik halkalardan oluşan grubun içerisinden seçilir.

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında buluşa uygun moleküller Formül V ile gösterilmekte olup,

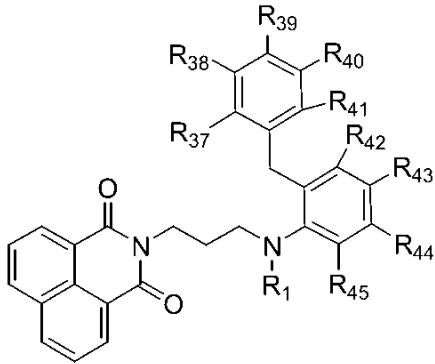


10 Formül V

burada R₃₀, R₃₁, R₃₂, R₃₃, R₃₄, R₃₅, R₃₆ birbirinden bağımsız olarak

-H, -NH₂, -OCH₃, -NO, -Cl, F, I, Br'dan oluşan bir grubun içerisinden seçilir.

Buluşun bir başka unsuru Formül VI ile gösterilen moleküllerdir;

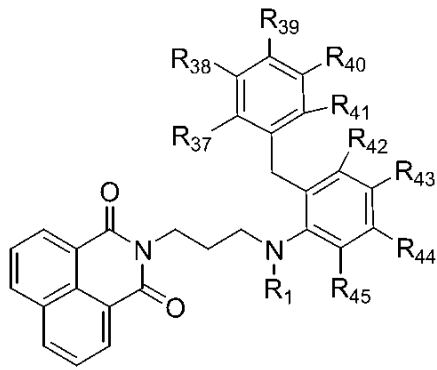


15 Formül VI

burada R₁, R₃₇, R₃₈, R₃₉, R₄₀, R₄₁, R₄₂, R₄₃, R₄₄, R₄₅ birbirinden bağımsız olarak;

-H, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -NHNHR_X, -N(R_X)(NHR_Y), -N(R_X)(NR_YR_Z), R_X, R_Y, R_Z, Cl, F, Br, I, -OH, -NO, -NO₂, -COOH, -OR_X, -SO₂R_X, -SO₂NHR_X, -SO₂NR_XR_Y, -CN, -COOR_X, -CONHR_X, -CONR_XR_Y, -NHCOCH₂R_X, -NHCOCHR_XR_Y, -NHCNHR_X, -NHCOR_X, -NHCONHR_X, -NHCO₂R_X'den oluşan bir grubun içerisinden seçilir ve;

- R_X , R_Y ve R_Z birbirinden bağımsız olarak; ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkan, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alken, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 primer amin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 sekonder amin, ikameli veya ikamesiz alkol, ikameli veya ikamesiz alkil siyanid, ikameli veya ikamesiz sülfonamid, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkyl sülfonil, ikameli veya ikamesiz C3-C8 sikloalkil, ikameli veya ikamesiz aril, ikameli veya ikamesiz heteroaril, isteğe bağlı olarak birbirinden bağımsız olarak O, S ve N içerisinden seçilen bir veya daha fazla heteroatom içeren ikameli veya ikamesiz heterosiklik veya heteroaromatik halkalardan oluşan grubun içerisinden seçilir.
- 10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında buluşa uygun moleküller Formül VI ile gösterilmekte olup,

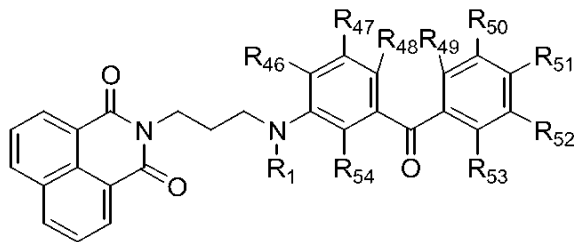


Formül VI

burada R_1 , R_{37} , R_{38} , R_{39} , R_{40} , R_{41} , R_{42} , R_{43} , R_{44} , R_{45} birbirinden bağımsız olarak;

- 15 -H, -NH₂, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -C(CH₃)₃, Cl, F, Br, I, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -NHCH₃, -NHCH₂CH₃, -N(CH₃)₂, -NO₂, -COOH, -COOCH₃, -COONH₂, -COONHCH₃, -COON(CH₃)₂'den oluşan bir grubun içerisinden seçilir.

Buluşun bir başka unsuru Formül VII ile gösterilen moleküllerdir;



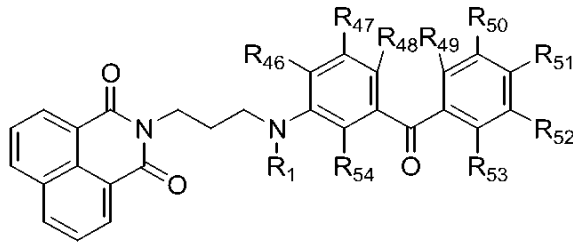
20 Formül VII

burada R_1 , R_{46} , R_{47} , R_{48} , R_{49} , R_{50} , R_{51} , R_{52} , R_{53} , R_{54} birbirinden bağımsız olarak;

-H, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -NHNH_X, -N(R_X)(NHR_Y), -N(R_X)(NR_YR_Z), R_X, R_Y, R_Z, Cl, F, Br, I, -OH, -NO, -NO₂, -COOH, -OR_X, -SO₂R_X, -SO₂NHR_X, -SO₂NR_XR_Y, -CN, -COOR_X, -CONHR_X, -CONR_XR_Y, -NHCOCH₂R_X, -NHCOCHR_XR_Y, -NHCNHR_X, -NHCOR_X, -NHCONHR_X, -NHCO₂R_X'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir ve;

- 5 R_X, R_Y ve R_Z birbirinden bağımsız olarak; ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkan, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alken, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 primer amin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 sekonder amin, ikameli veya ikamesiz alkol, ikameli veya ikamesiz alkil siyanid, ikameli veya ikamesiz sülfonamid, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkyl sülfonil, ikameli veya
- 10 ikamesiz C3-C8 sikloalkil, ikameli veya ikamesiz aril, ikameli veya ikamesiz heteroaril, isteğe bağlı olarak birbirinden bağımsız olarak O, S ve N içerisinde seçilen bir veya daha fazla heteroatom içeren ikameli veya ikamesiz heterosiklik veya heteroaromatik halkalardan oluşan grubun içerisinde seçilir.

- Buluşun tercih edilen bir uygulamasında buluşa uygun moleküller Formül VII ile
- 15 gösterilmekte olup,



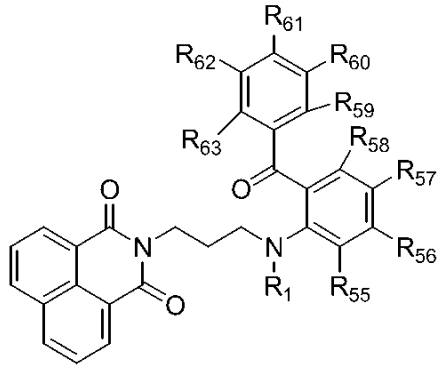
Formül VII

burada R₁, R₄₆, R₄₇, R₄₈, R₄₉, R₅₀, R₅₁, R₅₂, R₅₃, R₅₄ birbirinden bağımsız olarak;

- H, -NH₂, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -C(CH₃)₃, Cl, F, Br, I, -OH, -OCH₃, -
- 20 OCH₂CH₃, -NHCH₃, -NHCH₂CH₃, -N(CH₃)₂, -NO₂, -COOH, -COOCH₃, -COONH₂, -COONHCH₃, -COON(CH₃)₂'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir.

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında formül VII'ye uygun moleküllerde R₁ – H'dir.

Buluşun bir başka unsuru Formül VIII ile gösterilen moleküllerdir;



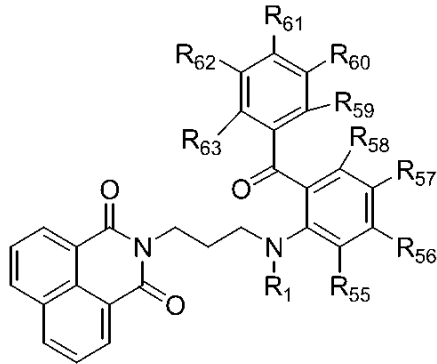
Formül VIII

burada R_1 , R_{55} , R_{56} , R_{57} , R_{58} , R_{59} , R_{60} , R_{61} , R_{62} , R_{63} birbirinden bağımsız olarak;

- 5 -H, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -NHNHR_X, -N(R_X)(NHR_Y), -N(R_X)(NR_YR_Z), R_X, R_Y, R_Z,
Cl, F, Br, I, -OH, -NO, -NO₂, -COOH, -OR_X, -SO₂R_X, -SO₂NHR_X, -SO₂NR_XR_Y, -CN,
-COOR_X, -CONHR_X, -CONR_XR_Y, -NHCOCH₂R_X, -NHCOCHR_XR_Y, -NHCNHR_X, -
NHCOR_X, -NHCONHR_X, -NHCO₂R_X'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir ve;

- 10 R_X, R_Y ve R_Z birbirinden bağımsız olarak; ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkan,
ikameli veya ikamesiz C1-C12 alken, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkin, ikameli
veya ikamesiz C1-C12 primer amin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 sekonder amin,
ikameli veya ikamesiz alkol, ikameli veya ikamesiz alkil siyanid, ikameli veya
ikamesiz sülfonamid, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkyl sülfonil, ikameli veya
ikamesiz C3-C8 sikloalkil, ikameli veya ikamesiz aril, ikameli veya ikamesiz
heteroaril, isteğe bağlı olarak birbirinden bağımsız olarak O, S ve N içerisinde
15 seçilen bir veya daha fazla heteroatom içeren ikameli veya ikamesiz heterosiklik veya
heteroaromatik halkalardan oluşan grubun içerisinde seçilir.

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında buluşa uygun moleküller Formül VIII ile gösterilmekte olup



Formül VIII

burada $R_1, R_{55}, R_{56}, R_{57}, R_{58}, R_{59}, R_{60}, R_{61}, R_{62}, R_{63}$ birbirinden bağımsız olarak;

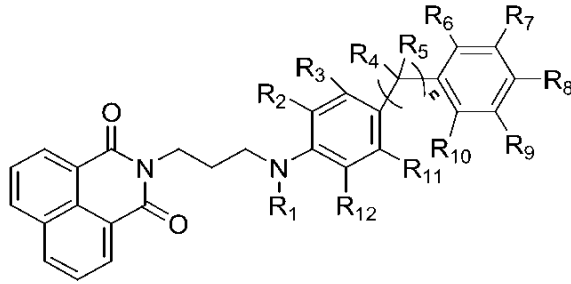
-H, -NH₂, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -C(CH₃)₃, Cl, F, Br, I, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -NHCH₃, -NHCH₂CH₃, -N(CH₃)₂, -NO₂, -COOH, -COOCH₃, -COONH₂,

5 -COONHCH₃, -COON(CH₃)₂'den oluşan bir grubun içerisinde seçilir.

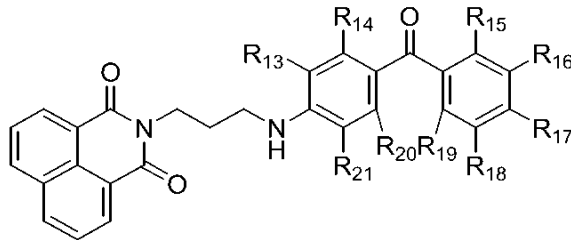
Buluşun tercih edilen bir uygulamasında formül VIII'e uygun moleküllerde R_1 - H'dir.

Buna göre mevcut buluş bisnaftalimidopropil türevi moleküllere yönelik olup, buluşa uygun moleküller;

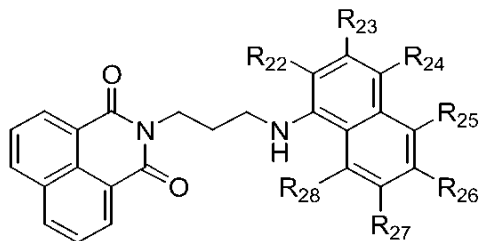
10 a) Formül I;



b) Formül II;

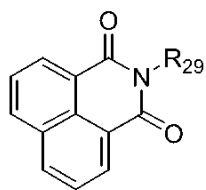


c) Formül III;

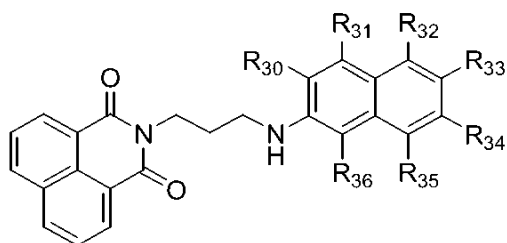


15

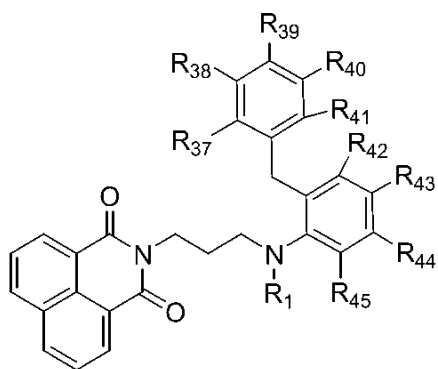
d) Formül IV;



e) Formül V;

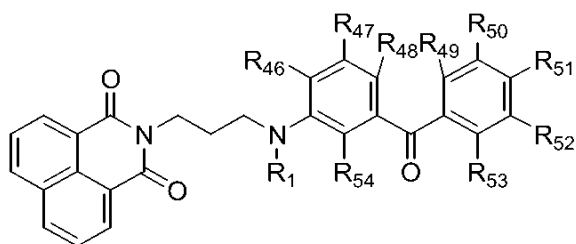


f) Formül VI;

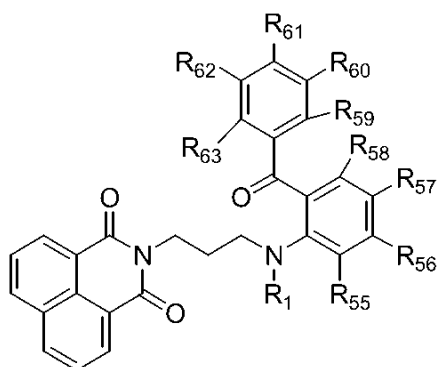


5

g) Formül VII;



h) Formül VIII;



ile gösterilmekte olup burada;

-n 0 ile 12 arasında bir doğal sayıdır,

- R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₃₇, R₃₈, R₃₉, R₄₀, R₄₁, R₄₂, R₄₃, R₄₄, R₄₅, R₄₆, R₄₇, R₄₈, R₄₉, R₅₀, R₅₁, R₅₂, R₅₃, R₅₄, R₅₅, R₅₆, R₅₇, R₅₈, R₅₉, R₆₀, R₆₁, R₆₂, R₆₃,

5 birbirinden bağımsız olarak;

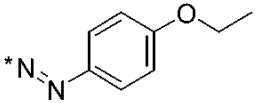
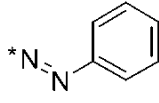
-H, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -NHNHR_X, -N(R_X)(NHR_Y), -N(R_X)(NR_YR_Z), R_X, R_Y, R_Z, Cl, F, Br, I, -OH, -NO, -NO₂, -COOH, -OR_X, -SO₂R_X, -SO₂NHR_X, -SO₂NR_XR_Y, -CN, -COOR_X, -CONHR_X, -CONR_XR_Y, -NHCOCH₂R_X, -NHCOCHR_XR_Y, -NHCNHR_X, -NHCOR_X, -NHCONHR_X, -NHCO₂R_X'den oluşan bir grubun içerisinde;

10 - R₁₃, R₁₄, R₁₅, R₁₆, R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀, R₂₁ birbirinden bağımsız olarak;

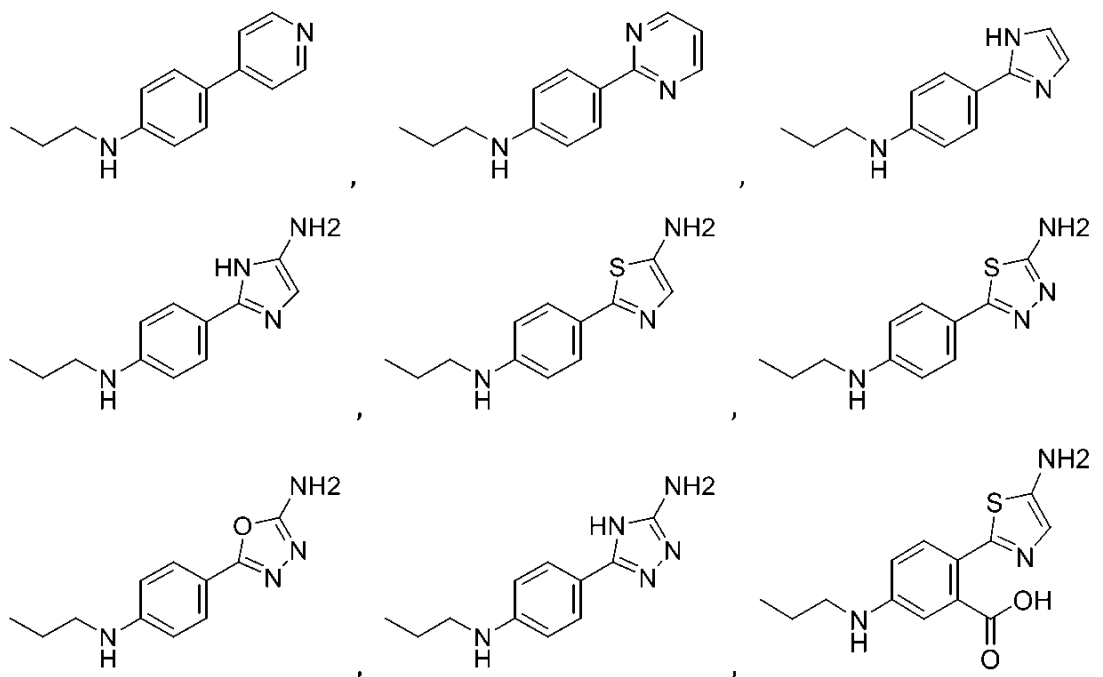
-H, -Cl, -F, -Br, -I, R_X, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -OH, -NO, -NO₂, -COOH, -OR_X, -COOR_X, -CN içerisinde;

- R₂₂, R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆, R₂₇, R₂₈ birbirinden bağımsız olarak

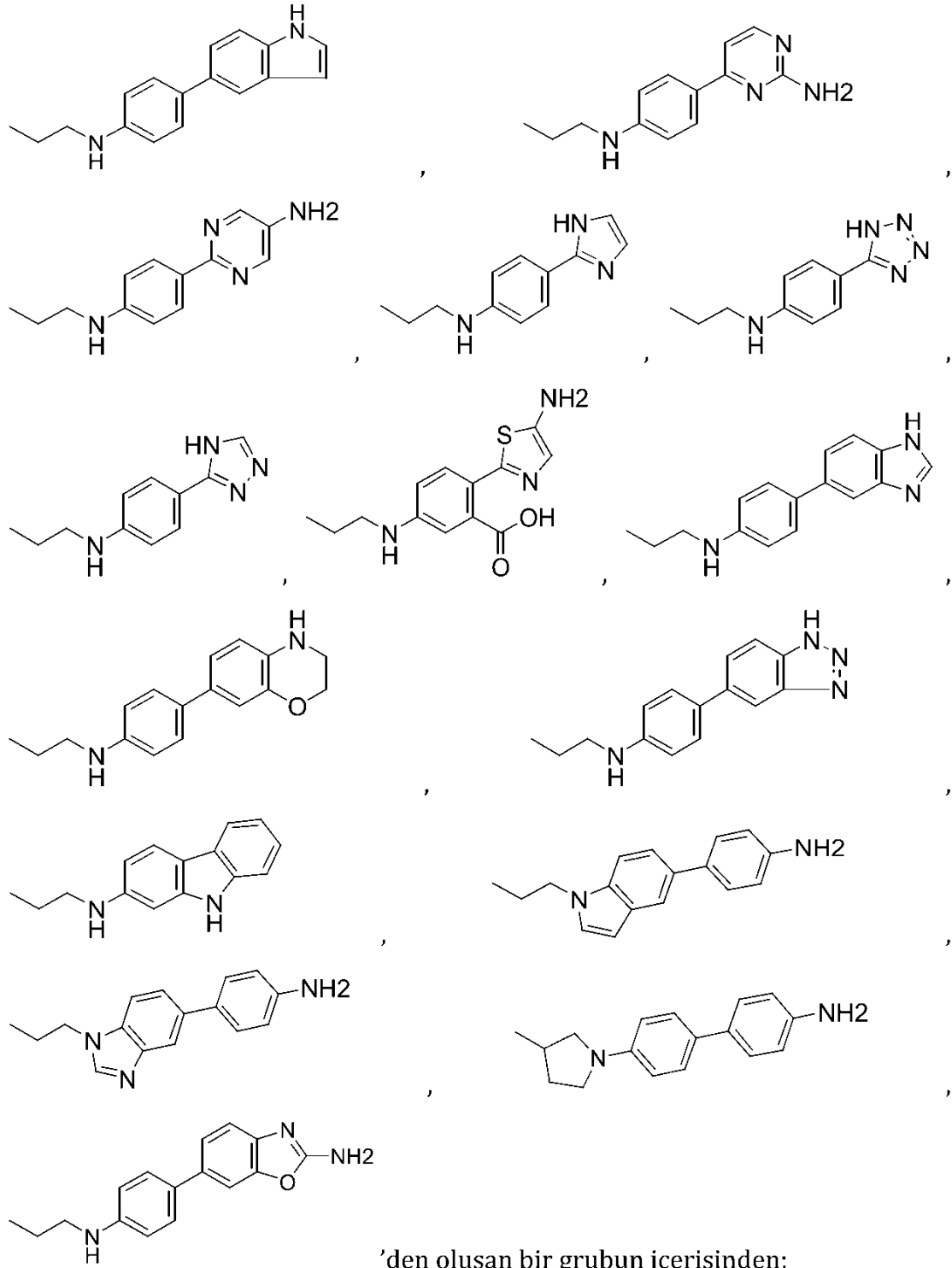
-H, -Cl, -F, -Br, -I, R_X, -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -OH, -COOH, -OR_X, -COOR_X, -CN, -

15 SO₃H, -SO₃⁻Na⁺, , , -NO içerisinde;

- R₂₉;



5



- R_{30} , R_{31} , R_{32} , R_{33} , R_{34} , R_{35} , R_{36} birbirinden bağımsız olarak;

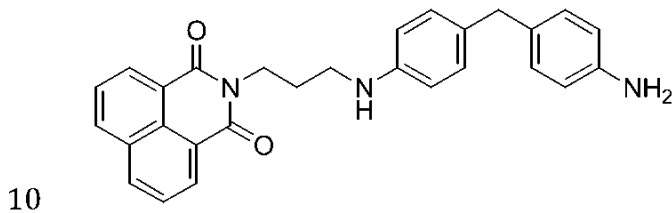
-H, -Cl, -F, -Br, -I, R_X , -NH₂, -NHR_X, -NR_XR_Y, -OH, -NO, -COOH, -OR_X, -COOR_X,

10 -CN'den oluşan bir grubun içerisinde;

R_X , R_Y ve R_Z ise birbirinden bağımsız olarak; ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkan, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alken, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkin, ikameli

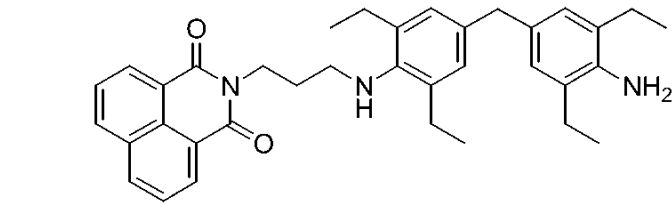
- veya ikamesiz C1-C12 primer amin, ikameli veya ikamesiz C1-C12 sekonder amin, ikameli veya ikamesiz alkol, ikameli veya ikamesiz alkil siyanid, ikameli veya ikamesiz sülfonamid, ikameli veya ikamesiz C1-C12 alkyl sülfonil, ikameli veya ikamesiz C3-C8 sikloalkil, ikameli veya ikamesiz aril, ikameli veya ikamesiz heteroaril, isteğe bağlı olarak birbirinden bağımsız olarak O, S ve N içerisinden seçilen bir veya daha fazla heteroatom içeren ikameli veya ikamesiz heterosiklik veya heteroaromatik halkalardan oluşan grubun içerisinden seçilir.

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 1 ile gösterilmektedir;



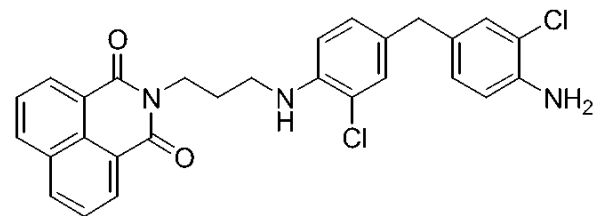
Formül 1

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 2 ile gösterilmektedir;



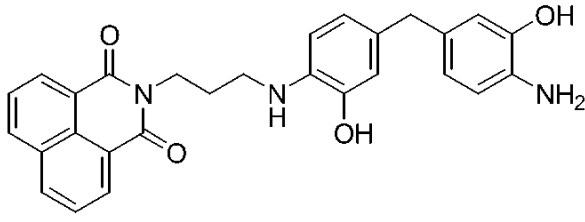
Formül 2

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 3 ile gösterilmektedir;



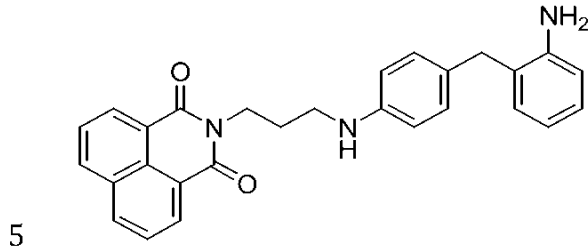
Formül 3

- 20 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 4 ile gösterilmektedir;



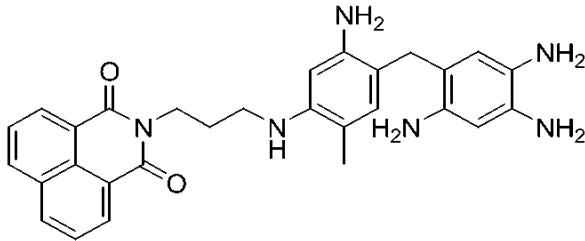
Formül 4

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 5 ile gösterilmektedir;



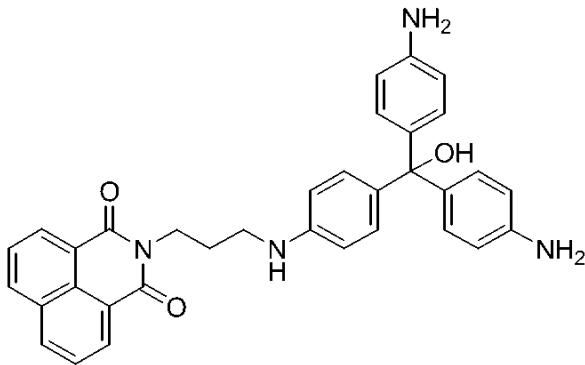
Formül 5

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 6 ile gösterilmektedir;



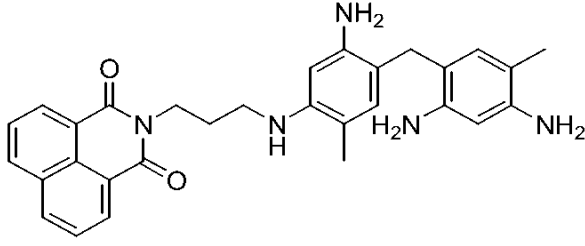
10 Formül 6

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 7 ile gösterilmektedir;



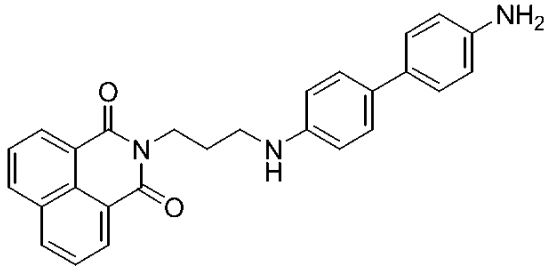
Formül 7

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 8 ile gösterilmektedir;



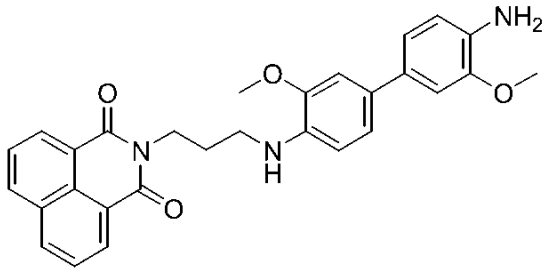
Formül 8

- 5 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 9 ile gösterilmektedir;



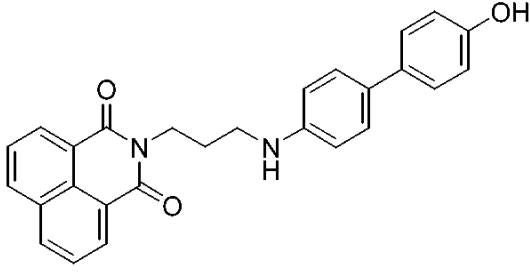
Formül 9

- 10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 10 ile gösterilmektedir;



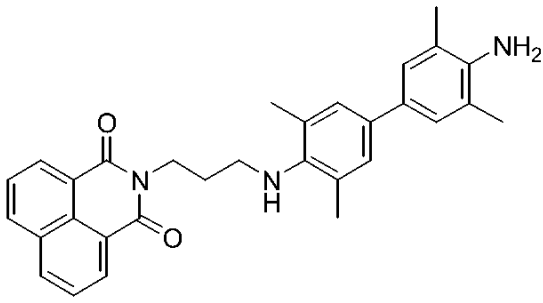
Formül 10

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 11 ile gösterilmektedir;



Formül 11

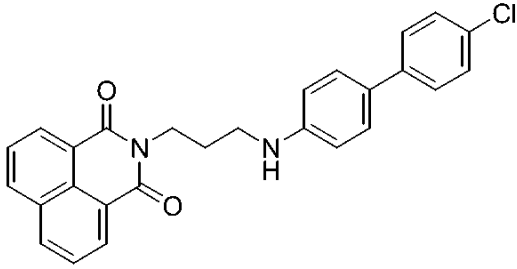
Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 12 ile gösterilmektedir;



5

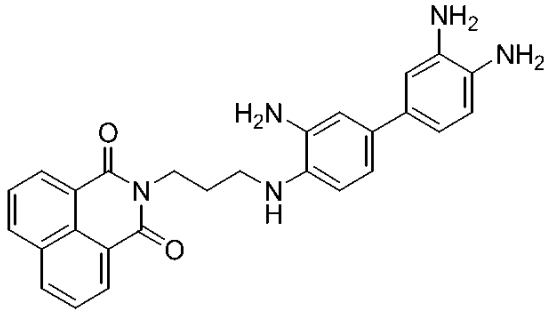
Formül 12

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 13 ile gösterilmektedir;



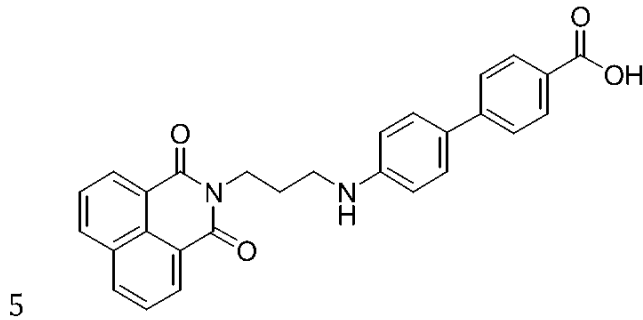
10 *Formül 13*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 14 ile gösterilmektedir;



Formül 14

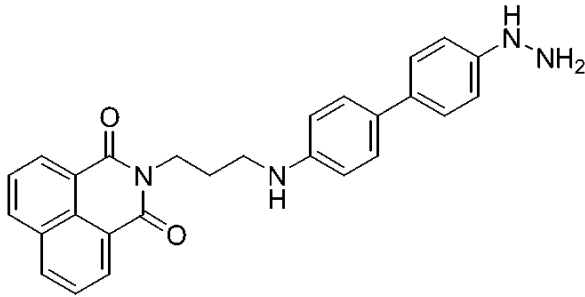
Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 15 ile gösterilmektedir;



5

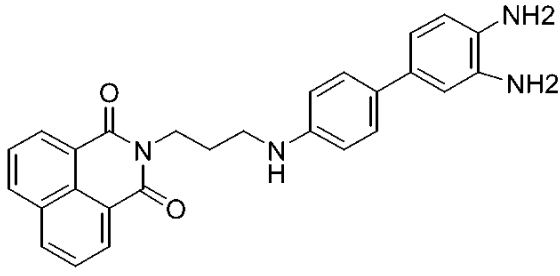
Formül 15

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 16 ile gösterilmektedir;



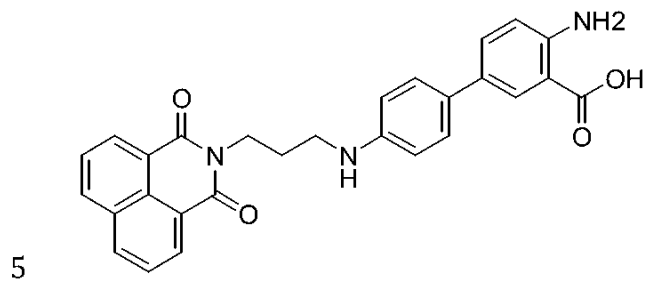
10 Formül 16

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 17 ile gösterilmektedir;



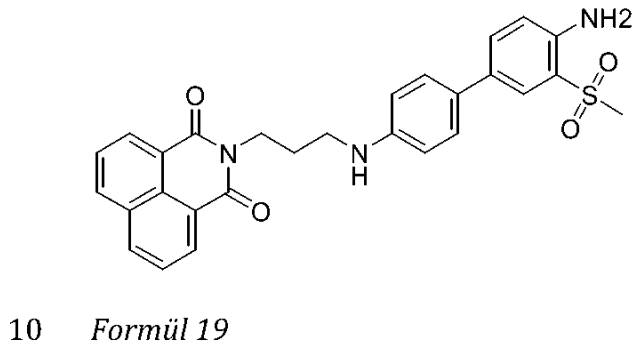
Formül 17

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 18 ile gösterilmektedir;



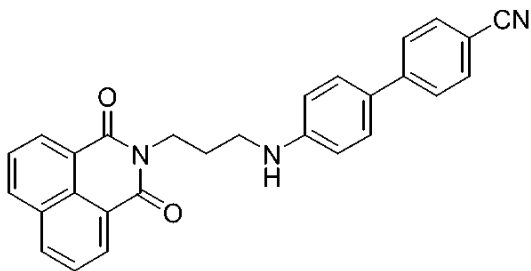
Formül 18

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 19 ile gösterilmektedir;



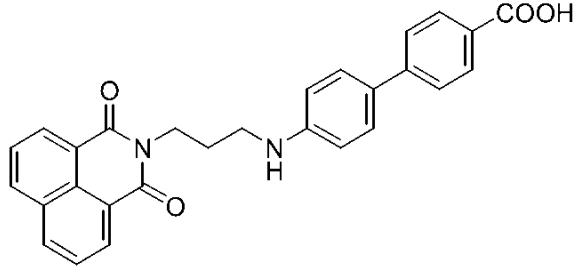
Formül 19

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 20 ile gösterilmektedir;



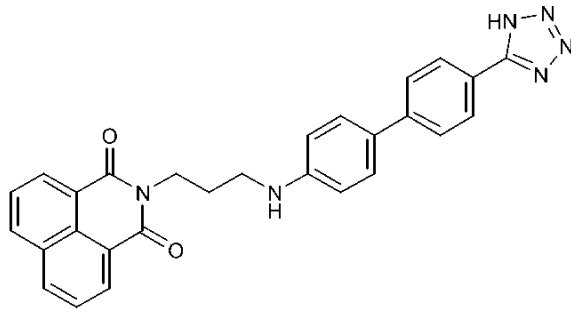
Formül 20

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 21 ile gösterilmektedir;



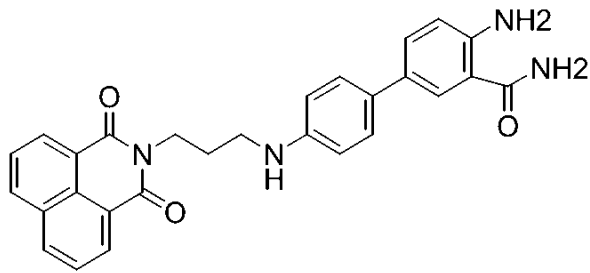
5 *Formül 21*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 22 ile gösterilmektedir;



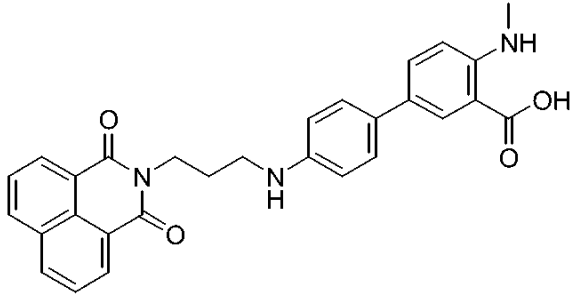
Formül 22

10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 23 ile gösterilmektedir;



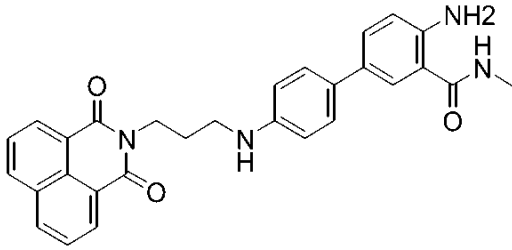
Formül 23

15 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 24 ile gösterilmektedir;



Formül 24

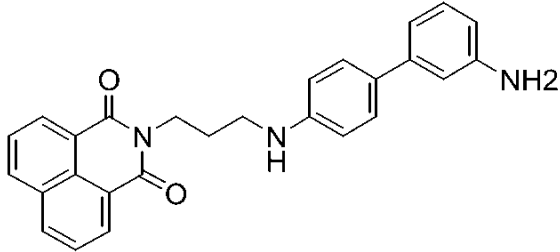
Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 25 ile gösterilmektedir;



5

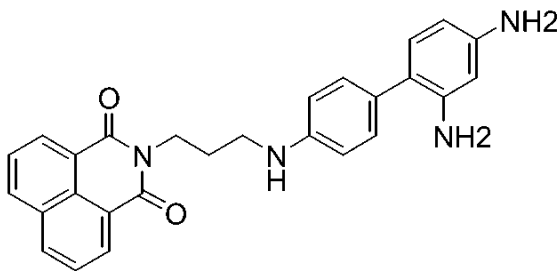
Formül 25

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 26 ile gösterilmektedir;



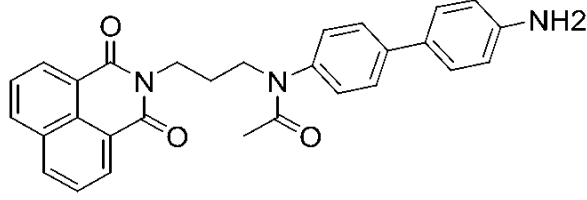
10 Formül 26

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 27 ile gösterilmektedir;



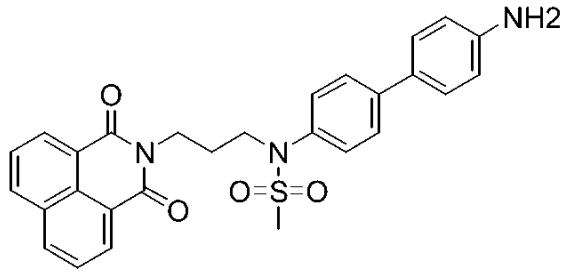
Formül 27

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 28 ile gösterilmektedir;



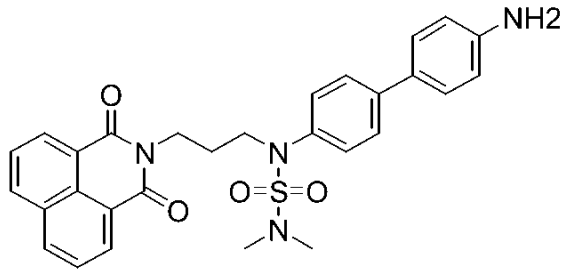
5 *Formül 28*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 29 ile gösterilmektedir;



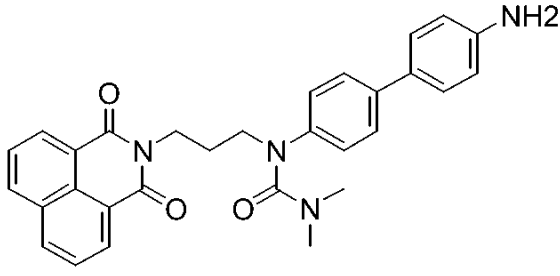
Formül 29

10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 30 ile gösterilmektedir;



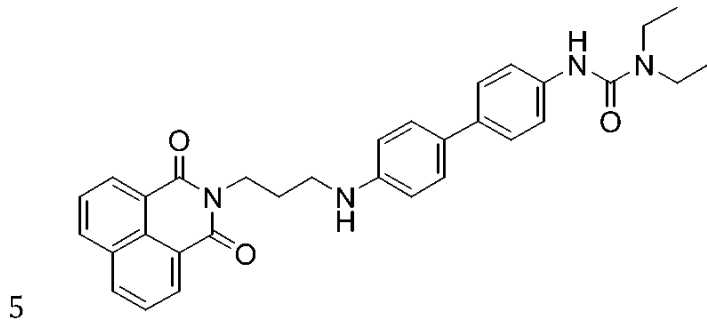
Formül 30

15 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 31 ile gösterilmektedir;



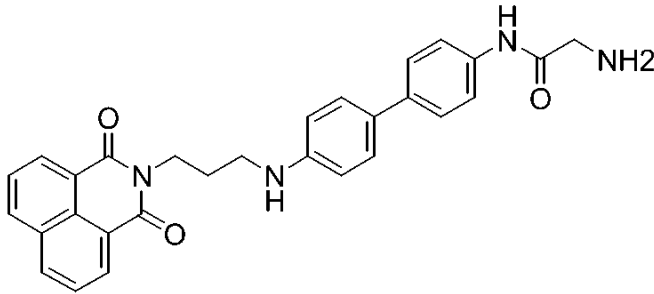
Formül 31

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 32 ile gösterilmektedir;



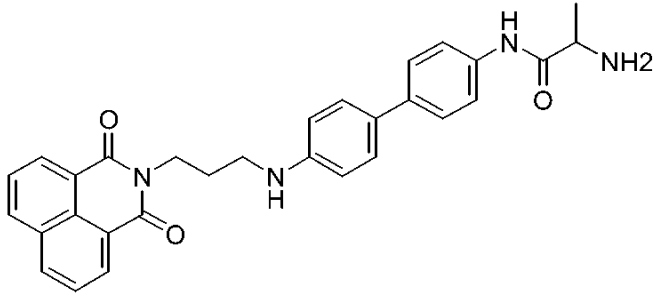
Formül 32

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 33 ile gösterilmektedir;



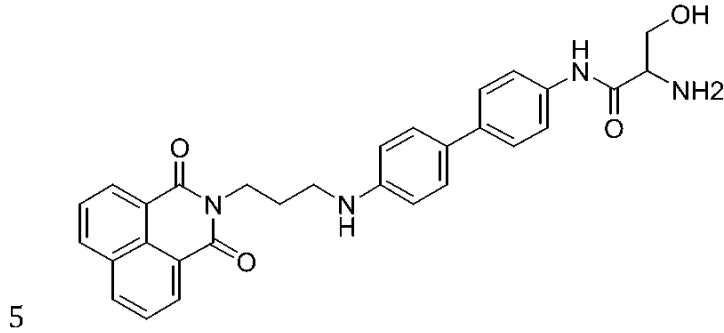
10 *Formül 33*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 34 ile gösterilmektedir;



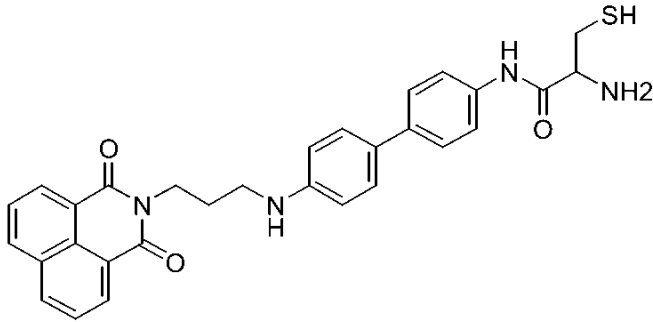
Formül 34

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 35 ile gösterilmektedir;



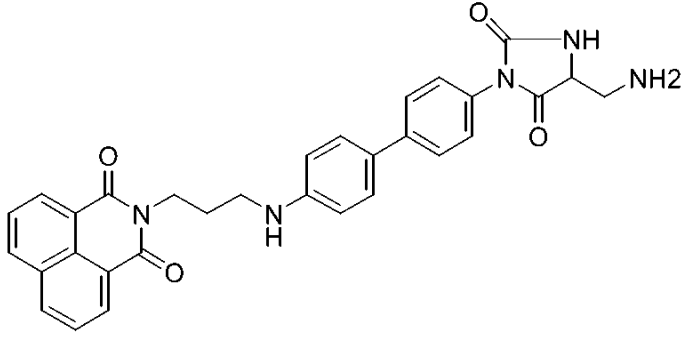
Formül 35

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 36 ile gösterilmektedir;



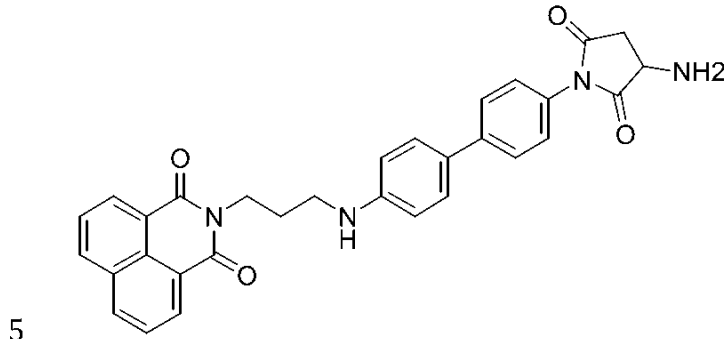
10 *Formül 36*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 37 ile gösterilmektedir;



Formül 37

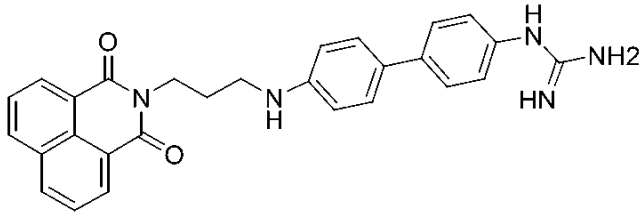
Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 38 ile gösterilmektedir;



5

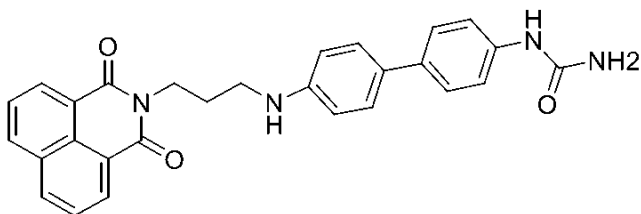
Formül 38

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 39 ile gösterilmektedir;



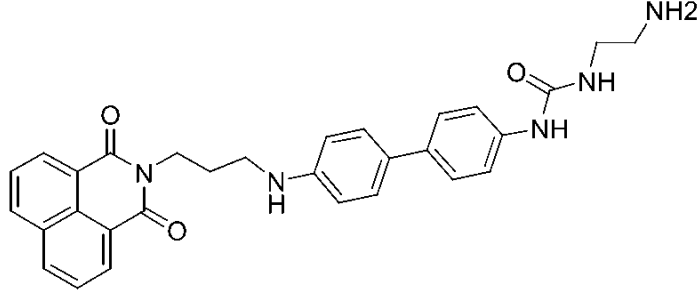
10 Formül 39

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 40 ile gösterilmektedir;



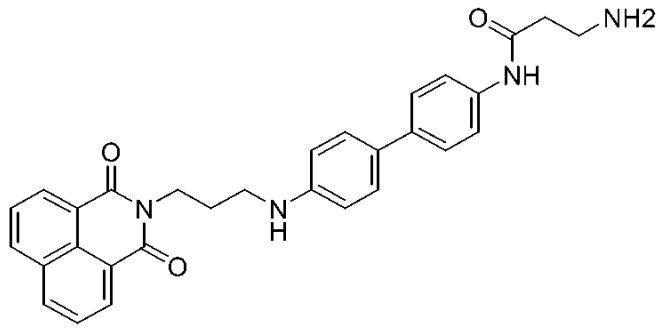
Formül 40

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 41 ile gösterilmektedir;



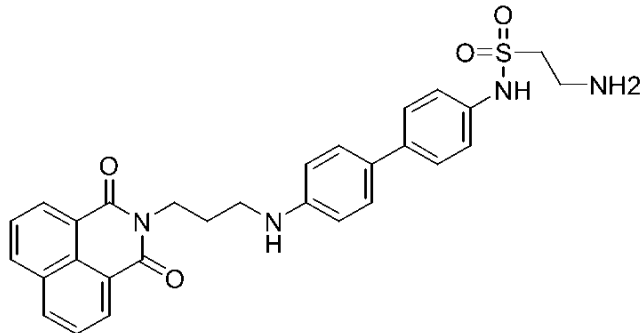
5 *Formül 41*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 42 ile gösterilmektedir;



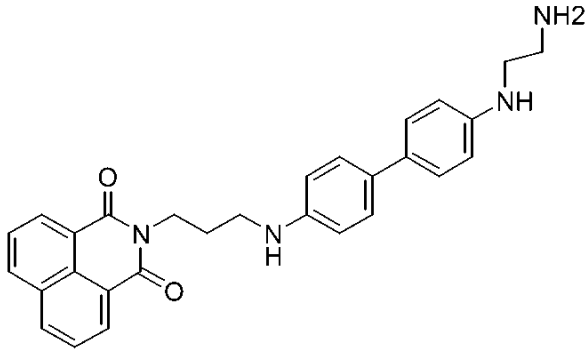
Formül 42

10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 43 ile gösterilmektedir;



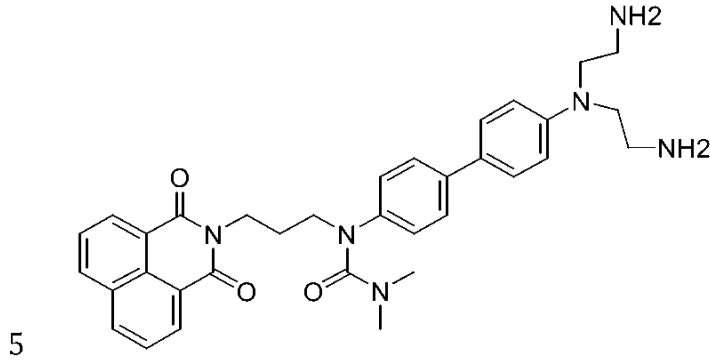
Formül 43

15 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 44 ile gösterilmektedir;



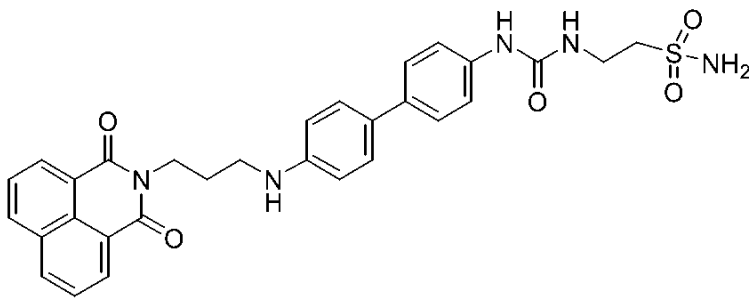
Formül 44

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 45 ile gösterilmektedir;



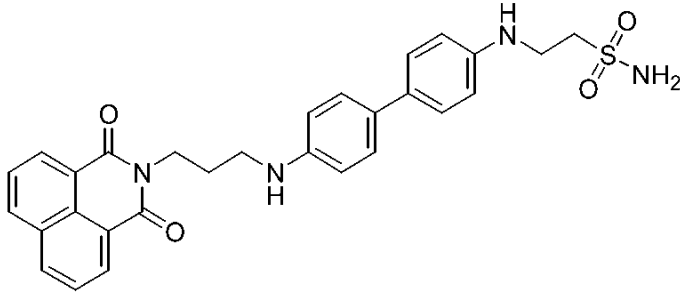
Formül 45

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 46 ile gösterilmektedir;



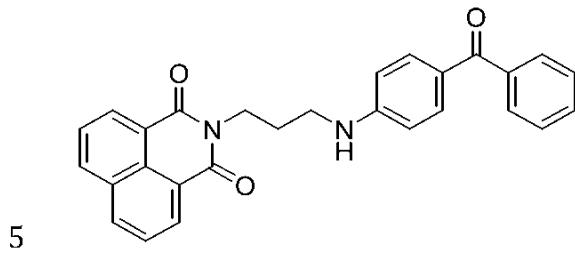
10 Formül 46

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I'e uygun molekül Formül 47 ile gösterilmektedir;



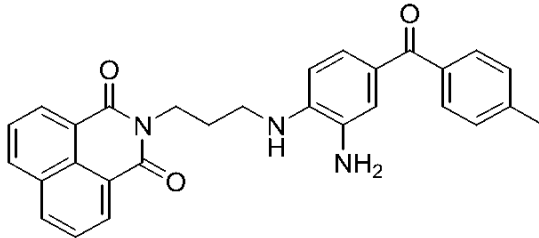
Formül 47

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül II'ye uygun molekül Formül 48 ile gösterilmektedir;



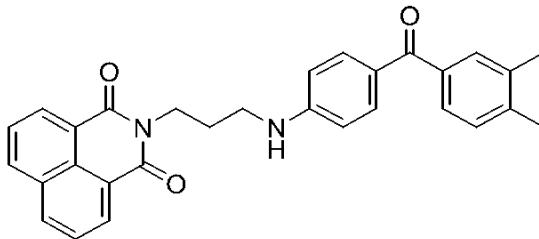
Formül 48

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül II'ye uygun molekül Formül 49 ile gösterilmektedir;



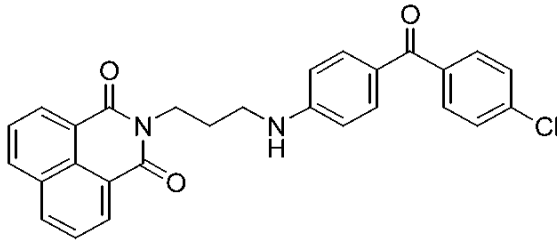
10 Formül 49

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül II'ye uygun molekül Formül 50 ile gösterilmektedir;



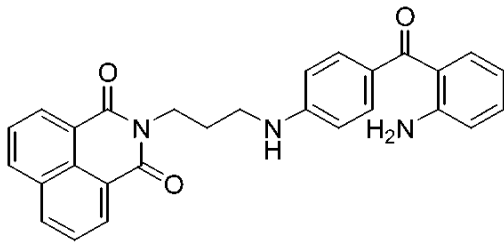
Formül 50

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül II'ye uygun molekül Formül 51 ile gösterilmektedir;



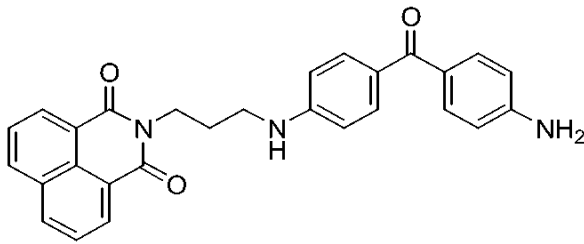
Formül 51

- 5 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül II'ye uygun molekül Formül 52 ile gösterilmektedir;



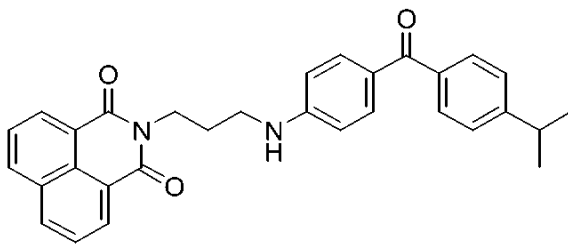
Formül 52

- 10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül II'ye uygun molekül Formül 53 ile gösterilmektedir;



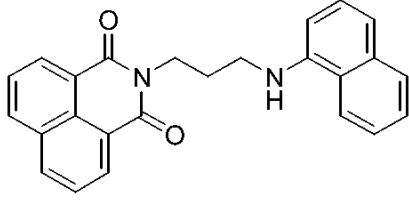
Formül 53

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül II'ye uygun molekül Formül 54 ile gösterilmektedir;



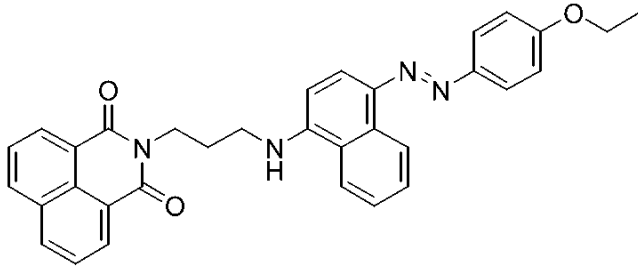
Formül 54

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül III'e uygun molekül Formül 55 ile gösterilmektedir;



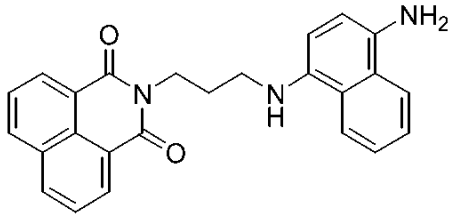
5 *Formül 55*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül III'e uygun molekül Formül 56 ile gösterilmektedir;



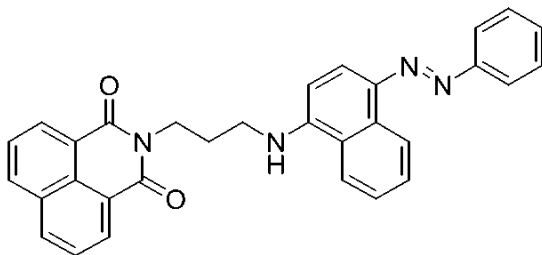
Formül 56

10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül III'e uygun molekül Formül 57 ile gösterilmektedir;



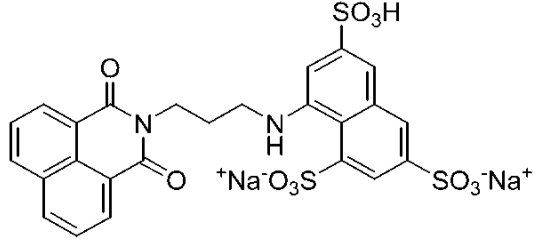
Formül 57

15 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül III'e uygun molekül Formül 58 ile gösterilmektedir;



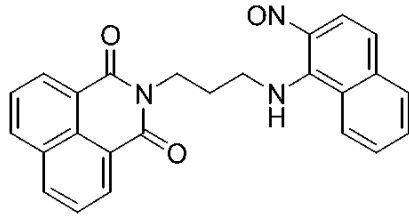
Formül 58

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül III'e uygun molekül Formül 59 ile gösterilmektedir;



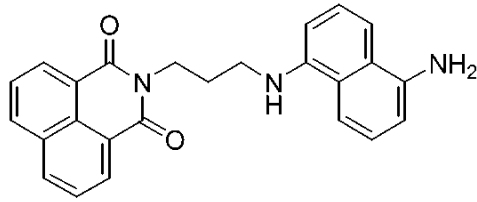
5 *Formül 59*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül III'e uygun molekül Formül 60 ile gösterilmektedir;



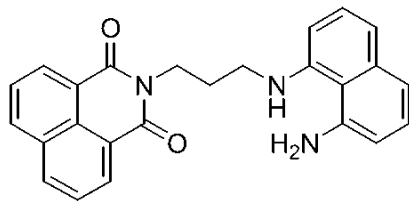
Formül 60

10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül III'e uygun molekül Formül 61 ile gösterilmektedir;



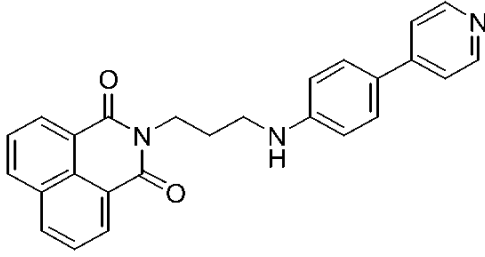
Formül 61

15 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül III'e uygun molekül Formül 62 ile gösterilmektedir;



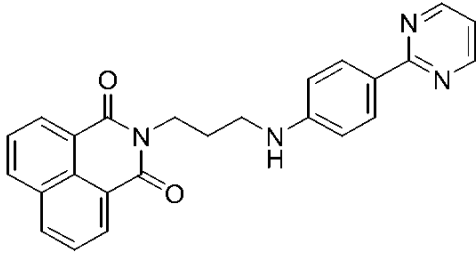
Formül 62

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 63 ile gösterilmektedir;



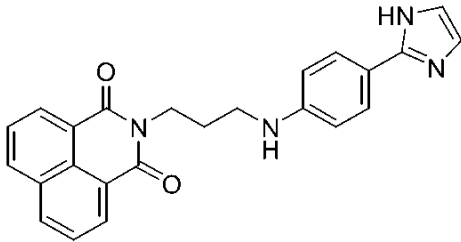
Formül 63

- 5 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 64 ile gösterilmektedir;



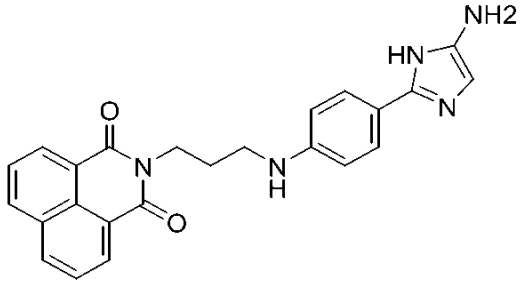
Formül 64

- 10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 65 ile gösterilmektedir;



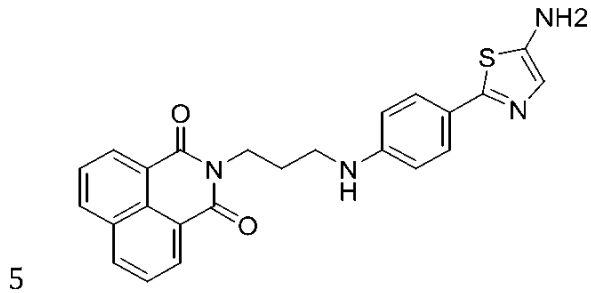
Formül 65

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 66 ile gösterilmektedir;



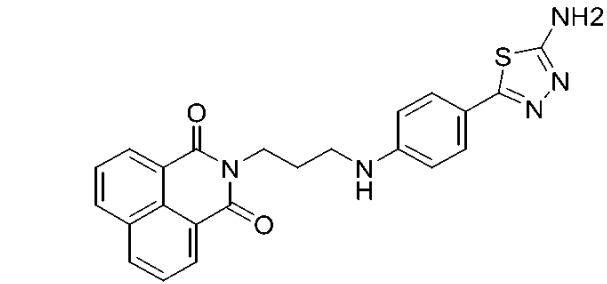
Formül 66

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 67 ile gösterilmektedir;



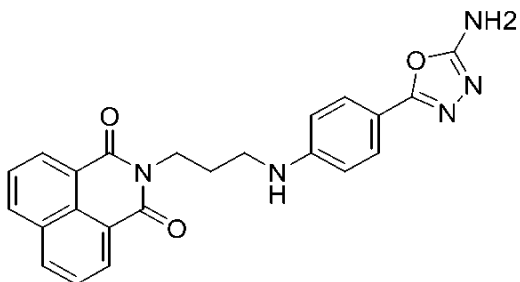
Formül 67

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 68 ile gösterilmektedir;



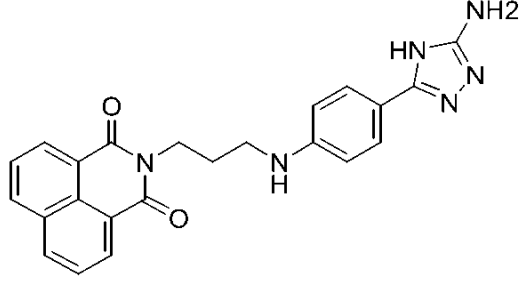
Formül 68

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 69 ile gösterilmektedir;



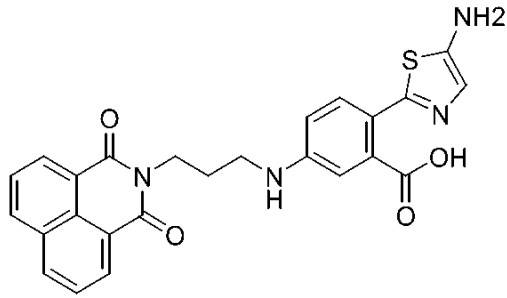
Formül 69

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 70 ile gösterilmektedir;



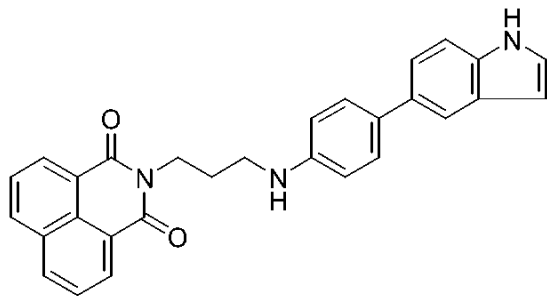
5 *Formül 70*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 71 ile gösterilmektedir;



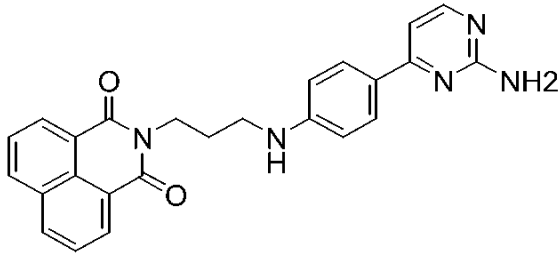
Formül 71

10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 72 ile gösterilmektedir;



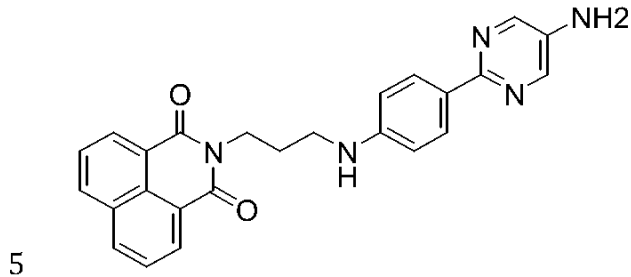
Formül 72

15 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 73 ile gösterilmektedir;



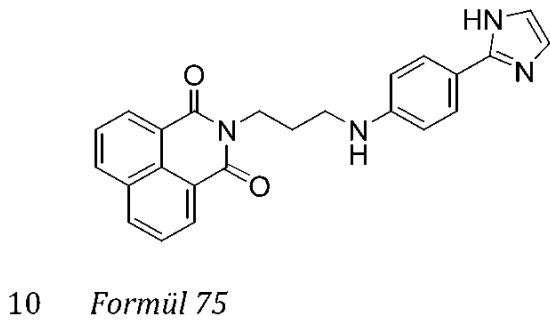
Formül 73

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 74 ile gösterilmektedir;



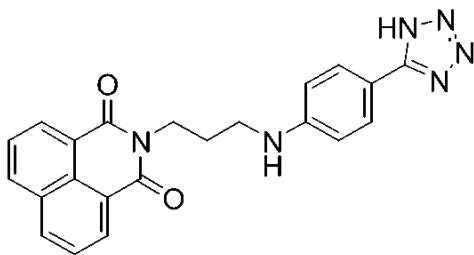
Formül 74

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 75 ile gösterilmektedir;



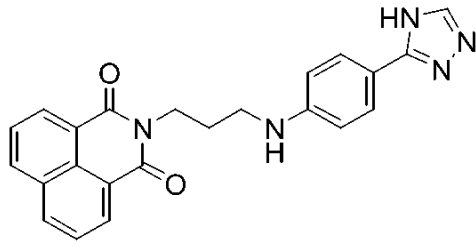
Formül 75

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 76 ile gösterilmektedir;



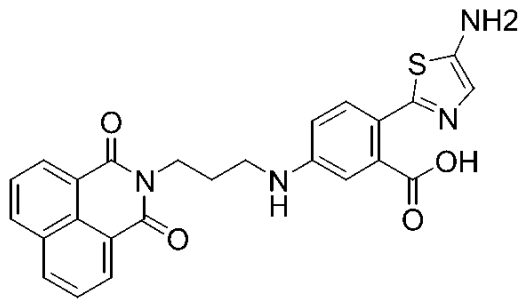
Formül 76

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 77 ile gösterilmektedir;



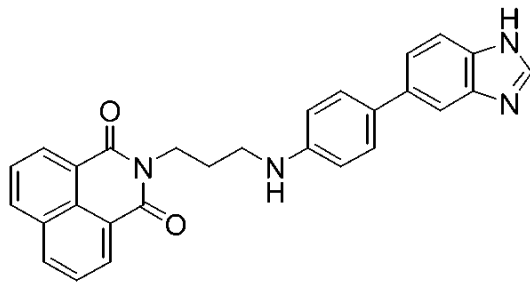
Formül 77

- 5 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 78 ile gösterilmektedir;



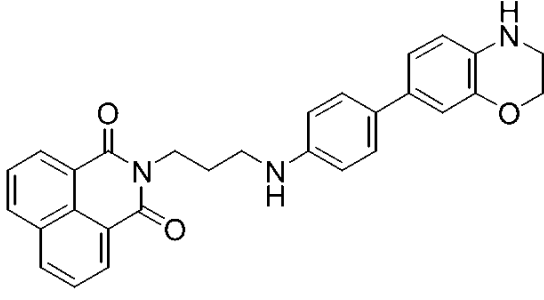
Formül 78

- 10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 79 ile gösterilmektedir;



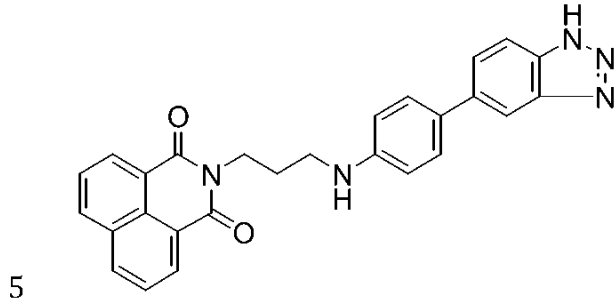
Formül 79

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 80 ile gösterilmektedir;



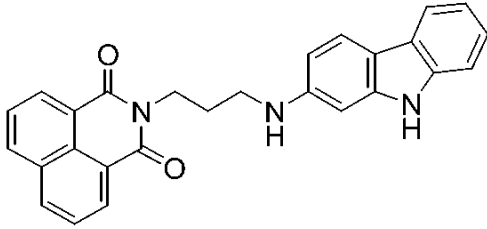
Formül 80

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 81 ile gösterilmektedir;



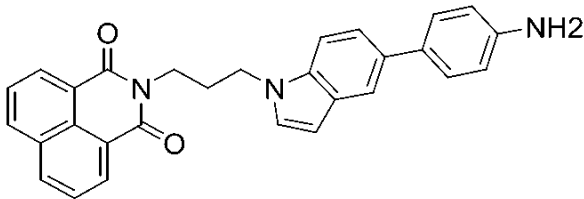
Formül 81

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 82 ile gösterilmektedir;



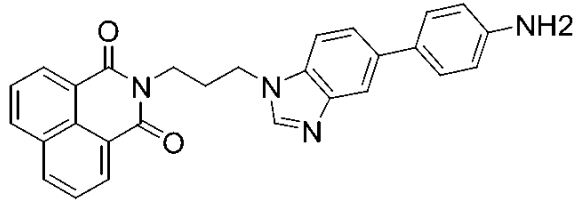
10 *Formül 82*

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 83 ile gösterilmektedir;



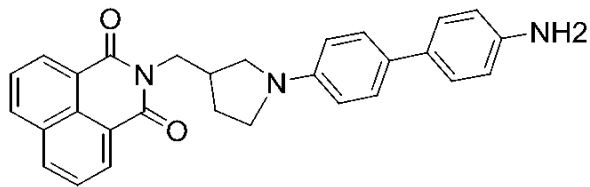
Formül 83

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 84 ile gösterilmektedir;



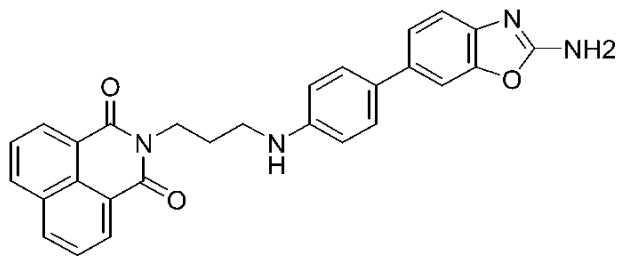
Formül 84

- 5 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 85 ile gösterilmektedir;



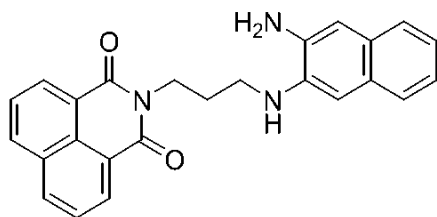
Formül 85

- 10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül IV'e uygun molekül Formül 86 ile gösterilmektedir;



Formül 86

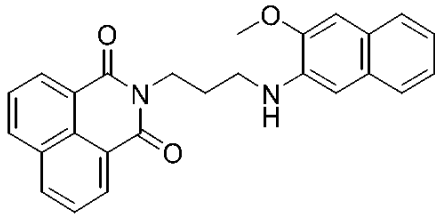
Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül V'e uygun molekül Formül 87 ile gösterilmektedir;



15

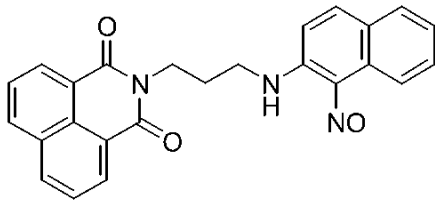
Formül 87

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül V'e uygun molekül Formül 88 ile gösterilmektedir;



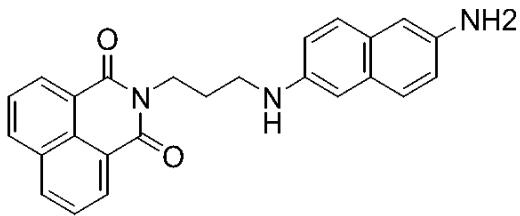
Formül 88

- 5 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül V'e uygun molekül Formül 89 ile gösterilmektedir;



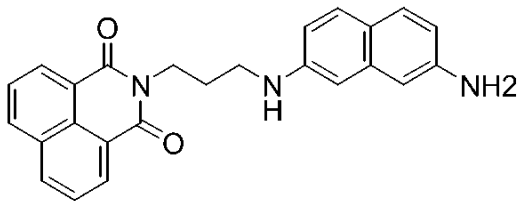
Formül 89

- 10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül V'e uygun molekül Formül 90 ile gösterilmektedir;



Formül 90

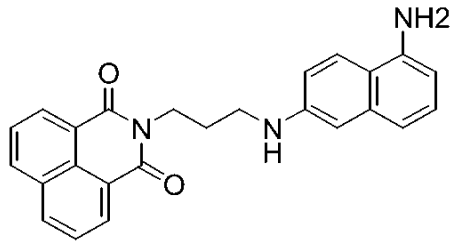
Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül V'e uygun molekül Formül 91 ile gösterilmektedir;



15

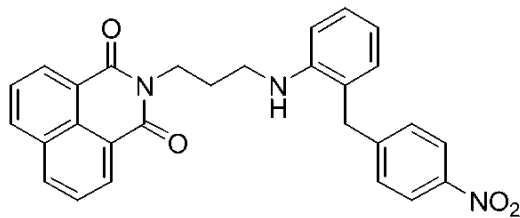
Formül 91

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül V'e uygun molekül Formül 92 ile gösterilmektedir;



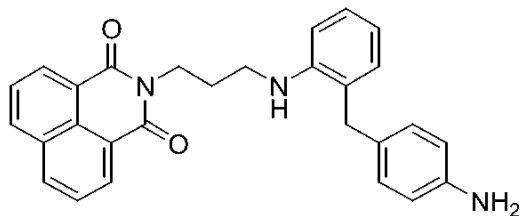
Formül 92

- 5 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül VI'ya uygun molekül Formül 93 ile gösterilmektedir;



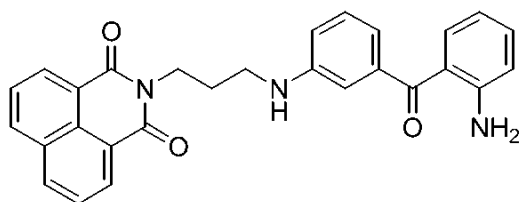
Formül 93

- 10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül VI'ya uygun molekül Formül 94 ile gösterilmektedir;



Formül 94

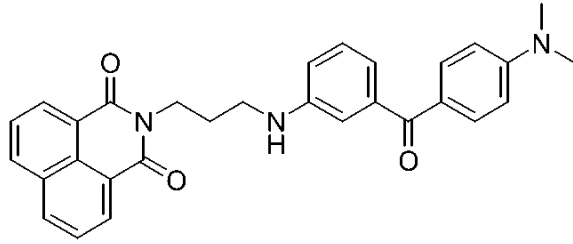
Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül VII'ye uygun molekül Formül 95 ile gösterilmektedir;



15

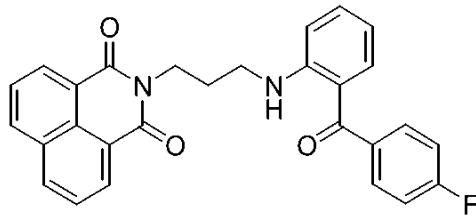
Formül 95

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül VII'ye uygun molekül Formül 96 ile gösterilmektedir;



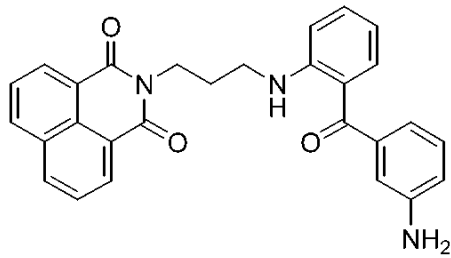
Formül 96

- 5 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül VIII'e uygun molekül Formül 97 ile gösterilmektedir;



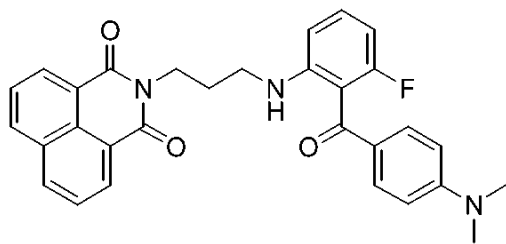
Formül 97

- 10 Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül VIII'e uygun molekül Formül 98 ile gösterilmektedir;



Formül 98

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül VIII'e uygun molekül Formül 99 ile gösterilmektedir;

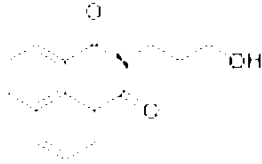


Formül 99

Yukarıda kimyasal yapıları ve spesifik kimyasal isimlendirmeleri verilen formül 1-99 ile gösterilen buluşa uygun moleküller buluşu açıklamak amaçlı verilmiş olup buluş kapsamı bu moleküllerle sınırlandırılmamaktadır.

- 5 Buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen etken maddelerin elde edilmesinde kullanılabilecek bir metot;

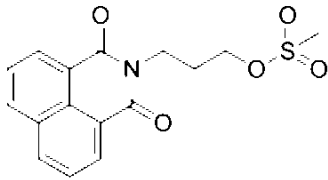
- a) Formül X ile gösterilen maddenin çözücü, tercihen diklorometan, varlığında para-metil sülfonil klorid ile reaksiyona sokulması,



10

Formül X

- b) Oluşan ara ürünün (Formül Y) çözücü, tercihen asetonitril, varlığında NaI ile karıştırılması ve bu karışıma çözücü, tercihen asetonitril içerisinde, diamino bileşiği ile K_2CO_3 çözeltisi ilave edilmesi



15

Formül Y

- c) Son ürünün reaksiyon karışımından izole edilmesi adımlarını içermektedir.

Burada kullanılan “çözücü” terimi, reaksiyon esnasında kullanılan reaktiflerin çözünmesini sağlayacak herhangi bir organik solventi ifade etmektedir.

- 20 Söz konusu organik solvent asetik asit, aseton, asetonitril, benzen, 1-butanol, 2-butanol, 2-butanon, t-butil alkol, karbon tetraklorür, klorobenzen, kloroform, sikloheksan, 1,2-dikloroetan, dietilen glikol, dietileter, dietilen glikol dimetil eter, 1,2-dimetoksietan (DME), dimetilformamid (DMF), dimetilsülfoksit (DMSO), 1,4-dioksan, etanol, etil asetat, etilen glikol, gliserin, heptan, heksametilfosforamid (HMPA), heksametilfosforus triamid (HMPT), hekzan, metanol, metilt-bütül eter (MTBE), metilen klorür (DCM), N-metil-2-pirolidon (NMP), nitrometan, pentan,
- 25

petrol eteri, 1-propanol, 2-propanol, piridin, tetrahidrofuran (THF), tolüen, trietil amin, su, o-ksilen, m-ksilen, p-ksilen'den oluşan bir grubun içerisinde seçilebilir.

Metot I ile gösterilen yöntem 0-90 °C aralığında bir sıcaklıkta tercihen veya 25-80 °C aralığında bir sıcaklıkta gerçekleştirilebilirler. Metot içerisindeki her bir adım bir
5 diğerinden farklı bir sıcaklıkta gerçekleştirilebilir.

Buluşa uygun yöntemlerle elde edilen ürünler,filtrasyon, santrifüj, ekstrasyon, kristalizasyon, rekristalizasyon, kromatografi, distilasyon gibi yöntemlerle saflaştırılabilir.

Burada bahsedilen kromatografi yöntemi; kolon kromatografisi, gaz kromatografisi,
10 sıvı kromatografisi, ters fazlı sıvı kromatografisi içerisinde seçilebilir.

Buluş bir diğer açıdan Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşiklerin ilaç olarak kullanımını açıklamaktadır.

Mevcut buluş bir açıdan buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV,
15 Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen moleküllerin parazitik hastalıkların tedavisinde kullanımına ilişkindir.

Burada kullanılan “parazitik hastalıklar” ifadesi bir parazitin neden olduğu veya bulaştırdığı hastalıkları ifade etmektedir.

Burada bahsedilen parazitik hastalıklar şistozomiyaz, opistorşiyaz, klonorkiyaz,
20 dikrosölyoz, fasioliyazis, paragonimiyaz, fasiolopsiyaz, ekinokokiyaz, tenyazis, sistiserkoz, difilobotriyaz, sparganoz, himenolepiyaz, drakunkuliyaz, onkoserkiyazis, filaryaz, elefantiyazis, mansonelloz, trişinelozis, ankilostomiyaz, nekatoryaz, ankilostomyazis, askardiyo, strongiloidiyaz, trişüriyaz, enterobiyazis, anisakiyaz, helmintiyazis, trikostrongiloz, anjiyostrongiloz, gnatostomiyaz, anjiyostrongiloz,
25 singamiyaz, hirudiniyaz, akantosefallyaz, gongilonemiyaz, metastrongilyaz, telaziyaz, pediküloz, pithiriyaz, skabiye, miyaz, tungiyaz, trombikuloz, skarabiazis, hirudiniyaz, linguatuloz, porosefaliyaz, leishmania, trypanosomiasis, plazmodyum falsiparum'un neden olduğu malarya, plazmodyum vivax'ın neden olduğu malarya, plazmodyum malariae'nin neden olduğu malarya, chagas hastalığı, toksoplazma,
30 pnömosistoz, babeziyo, piroplazmoz, akantamebiyaz, naegleriyaz ve/veya mikrosporidiaz olabilir.

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen moleküller Leishmaniasis tedavisinde kullanıma uygun bir ilacın içerisinde kullanılır.

5 Buluş, tercihen Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen moleküllerin leishmaniasis tedavisinde kullanımına ilişkindir. Burada bahsi geçen Leishmaniasis hastalığı kütanöz, mukokütanöz veya viseral Leishmaniasis olabilir.

10 Buluş bir diğer açıdan *L. Arabica*, *L. archibaldi*, *L. aristedesi*, *L. braziliensis*, *L. chagasi*, *L. colombiensis*, *L. Deanei*, *L. donovani*, *L. enrieti*, *L. equatorensis*, *L. forattinii*, *L. garnhami*, *L. gerbil*, *L. guyanensis*, *L. herreri*, *L. hertigi*, *L. infantum*, *L. killicki*, *L. lainsoni*, *L. major*, *L. Mexicana*, *L. naiffi*, *L. panamensis*, *L. peruviana*, *L. pifanoi*, *L. shawi*, *L. tarentolae*, *L. tropica*, *L. turanica*, *L. venezuelensis* türü parazitlerin neden olduğu enfeksiyonel hastalıkların tedavisinde mevcut buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, 15 Formül VIII ile gösterilen moleküllerin kullanımına ilişkindir.

Mevcut buluş bir açıdan buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen moleküllerin bakteriyel hastalıkların tedavisinde kullanımına ilişkindir.

20 Burada kullanılan “bakteriyel hastalıklar” ifadesi patojenik bakterilerin neden olduğu enfeksiyonlardan kaynaklanan hastalıkları ifade etmektedir.

Mevcut buluş kapsamındaki bakteriyel hastalıklar basili, bartonella, bordetella, borrelia, brusella, kampilobakter, kalamidya, kalamidofila, klostridyum, korinebakteryum, enterokokkus, eşerya, fransiyella, hemofilus, helikobakter, lejyonella, leptospira, listeria, mikobakteryum, mikoplazma, nisserya, psödomonas, 25 riketsiya, salmonella, şigella, stafilokokkus, streptokokkus, treponema, üreplazma, vibrio, yersinia, ana gruplarına mensup bakteriler nedeniyle oluşan herhangi bir bakteriyel hastalık olabilir.

30 Söz konusu bakteriyel hastalıklar, örneğin bubonic veba, pnömonik veba, kolera, sifilis, konjenital sifilis, post streptokoksik glomerulonefrit, lohusa humması, impetigo, yılancık, ateşli romatizma, kızıl, streptokokkal faranjit, sepsis, akut bakteriyel pnömoni, menenjit, orta kulak iltihabı, endometrit, neonatal sepsis, neonatal menenjit, neonatal pnömoni, sistit, osteomyelit, toksik şok sendromu,

- stafilokokkal gıda zehirlenmesi, şigeloz, salmonella, paratifo, tifo, kayalık dağlar lekeli humması, idrar yolu enfeksiyonları, kornea enfeksiyonları, pnömoni, endokardit, menenjit, gnore, pelvik enflamatuvar hastalığı, tüberküloz, cüzzam, listeriyoz, leptospiroz, lejyoner hastalığı, peptik ülser, üst solunum yolu
- 5 enfeksiyonları, kronik gastrit, bronşit, septik artrit, tularemia, kanlı diyare, idrar yolu enfeksiyonları, endokardit, safra yolu enfeksiyonları, difteri, tetanoz, papağan humması, trachoma, neonatal konjuktivit, üretrit, epididimit, prostatit, lenfogranülomatoz, atipik pnömoni, Guillain-Barre Sendromu, broseloz, malta humması, lyme hastalığı olabilir.
- 10 Mevcut buluş bir açıdan buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen moleküllerin viral hastalıkların tedavisinde kullanımına ilişkindir.
- Mevcut buluş kapsamında kullanılan “viral hastalıklar” ifadesi patojenik virüslerin ve bulaşıcı virus partiküllerin (viron) kendilerini hürelere bağlayıp hürelere giriş
- 15 yapmasıyla oluşan hastalıkların tamamını ifade etmektedir.
- Bahsedilen viral hastalıklar adenoviridae, herpesviridae, papillomaviridae, polyomaviridae, poxviridae, heradnaviridae, parvoviridae, astroviridae, caliciviridae, picornaviridae, coronaviridae, flaviviridae, togaviridae, hepeviridae, retroviridae, ortomiksoviridae, arenaviridae, bunyaviridae, filoviridae, paramiksoviridae,
- 20 rabdoviridae, reoviridae ana ailelerine mensup olan herhangi bir virüsün neden olduğu bir hastalık olabilir.
- Söz konusu viral hastalıklara ait özel örnekler, gastroentirit, keratokonjuktivit, farenjit, krup, pnömoni, sistit, el-ayak-ağız hastalığı, pleurodnia, septik menenjit, perikadit, miyokardit, Burkitt’e Lenfoma, Hodgkin’s lenfoma, nasafaranjiyel karsinom,
- 25 akut hepatit, kronik hepatit, hepatic siroz, hepatoselüler karsinom, tonsilit, sitomegalik inklüzyon hastalığı, Kaposi sarkomu, castleman hastalığı, influenza, kızamık, reye sendromu, kabakulak, anogenital siğil, poliomiyellit, kuduz, konjenital rubella, kızamıkçık, çiçek hastalığı, zona, konjenital su çiçeği sendromu. olabilir.
- Mevcut buluş bir açıdan buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV,
- 30 Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen moleküllerin neoplastik hastalıkların tedavisinde kullanımına ilişkindir.

Mevcut buluş kapsamında kullanılan “neoplastik hastalıklar” ifadesi habis (malign) tümörlere veya kontrolsüz hücre büyümesi ile karakterize olan bir fizyolojik duruma, örneğin kanser hastalığına işaret eder. Buluş kapsamında “neoplastik hastalık” ve “kanser” terimleri birbiri ile değişebilir şekilde kullanılabilir. Kanser örnekleri

5 karsinoma, lenfoma, blastoma sarkoma ve lösemiye içermekte olup bunlarla sınırlı değildir.

Karsinoma, burada kullanıldığı şekliyle, epitel hücrelerden oluşan bir kanser türünü ifade etmektedir.

10 Lenfoma, burada kullanıldığı şekliyle, lenfositlerden gelişen bir kanser türünü anlatmaktadır.

Blastoma, burada kullanıldığı şekliyle, blast hücre adıyla da bilinen öncü hücrelerden gelişen bir kanser türünü anlatmaktadır.

Sarkoma, burada kullanıldığı şekliyle, mezenkimal kökenli değişmiş hücrelerden kaynaklanan kanser türünü anlatmaktadır.

15 Lösemi, burada kullanıldığı şekliyle, kemik iliğinde başlayan ve yüksek sayıda anormal akyuvar hücresi oluşumuna neden olan kanser türünü ifade etmektedir.

Kanser türlerine ait daha özel örnekler meme kanseri, prostat kanseri, kolorektal kanser, deri kanseri, küçük hücreli akciğer kanseri, küçük hücreli olmayan akciğer kanseri, mezotelyom, gastrointestinal kanser, pankreas kanseri, gliyoblastom, vulva

20 kanseri, rahim ağzı kanseri, endometriyal karsinom, yumurtalık kanseri, karaciğer kanseri, hepatom, mesane kanseri, böbrek kanseri, tükürük bezi karsinomu, tiroid kanseri ve çeşitli baş ve boyun kanserlerini içerir.

Buluş ayrıca etken madde olarak buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşikleri

25 içeren bir farmasötik bileşime ilişkindir.

Söz konusu farmasötik bileşimler Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşiklere ilave olarak en az bir diğer etken madde içerebilir.

Mevcut buluşun bir başka uygulamasında Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen buluşa uygun bileşikler

30 diğer antiparazitik, antibakteriyel, antiviral, antineoplastik ve/veya sitotoksik ve/veya

antimetastatik etki gösteren bilinen aktif bileşiklerle veya bunların ikili/üçlü kombinasyonlarıyla beraber kullanılabilir. İkinci etken madde Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşiklerle beraber formüle edilebileceği gibi Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII'e uygun bileşiklerden ayrı şekilde formüle edilip beraber kullanıma uygun paketlerde satışa sunulabilir.

Buluşun tercih edilen bir uygulamasında Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşikler en az bir adet antibakteriyel etki gösteren aktif bileşiklerle kombine edilir.

- 10 Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşiklerle kombine olarak kullanılacak antibakteriyel etki gösteren aktif bileşikler amikasin, gentamisin, kanamisin, neomisin, netilmisin, tobramisin, paromisin, streptomisin, spektinomisin, geldanamisin, herbimisin, rifaksimisin, lorakarbef, ertapenem, doripenem, imipenem, meropenem, sefadroksil,
- 15 sefazolin, sefalotin, sefalekssin, sefaklor, sefamandol, sefoksitin, sefprozil, sefuroksim, sefiksim, sefdinir, sefditoren, sefoperazon, sefotaksim, sefpodoksime, seftazidim, seftibüten, seftizoksime, sefepim, seftarolin fosamil, seftobiprol, teikoplanin, vankomisin, televansin, dalbavansin, oritavansin, clindamisin, linkomisin, daptomisin, azitromisin, klaritromisin, diritromisin, eritromisin, roksitromisin, troleandomisin,
- 20 telitromisin, spiramisin, aztreonam, furazolidon, nitrofurantoin, linezolid, pozizolid, radezolid, torezolid, amoksisilin, ampisilin, azlosilin, karbenisilin, kloksasilin, dikloksasilin, flukloksasilin, mezlosilin, metisilin, nafsilin, okzasilin, penisilin G, penisilin V, piperasilin, temosilin, tikarsilin, klavulanat, sulbaktam, tazobaktam, basitrasin, kolistin, polimiksin B, siprofloksasin, enoksasin, gatifloksasin,
- 25 gemifloksasin, levofloksasin, lomefloksasin, moksifloksasin, nalidixik asit, norfloksasin, ofloksasin, trovafloksasin, grepafloksasin, sparfloksasin, temafloksasin, mafenid, sulfasetamid, sulfadiazin, sülfadimetoksin, sülfametizol, sülfametoksazol, sulfanilimid, sülfasalazin, sülfisoksazol, trometoprim, demeklosiklin, doksisisiklin, minosiklin, oksitetrasiklin, tetrasiklin, klofazimin, dapson, kapreomisin, sikloserin,
- 30 etambutol, isoniyazid, pyrazinamid, rifampisin, rifabutin, rifapentin, streptomisin, arsfenamin, kloramfenikol, fosfomisin, fusidik asit, metronidazol, mupirosin, platensimisin, kinupristin, dalbopristin, tiamfenikol, tigesiklin, tinidazol, trimetoprim'i

içeren grubun içerisinde veya burada sayılan ajanların ikili veya üçlü kombinasyonları içerisinde seçilebilir.

Buluşun tercih edilen bir diğer uygulamasında Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşikler en az bir adet antiviral etki gösteren aktif bileşiklerle kombine edilir.

Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşiklerle kombine olarak kullanılacak antiviral etki gösteren aktif bileşikler abakavir, asiklovir, adefovir, amantadin, amprenavir, ampligen, arbidol, atazanavir, atripla, balavir, sidofovir, kombivir, dolutegravir, darunavir, delavirdin, didanosin, dokosanol, eduksudin, efavirenz, emtrisitabin, enfuvirtid, entekavir, ekoliver, famsiklovir, fomivirsen, fosamprenavir, foskarnet, fosfonet, gansiklovir, ibasitabin, imunovir, idoksuridin, imikuimod, indinavir, inosin, interferon tip I, interferon tip II, interferon tip III, interferon, lamivudin, lopinavir, lovrid, maravirok, moroksidin, metisazon, nelfinavir, nevirapin, neksavir, nitazoksanid, novir, oseltamivir, peginterferon alfa-2a, pensiklovir, peramivir, plekonaril, podofilotoksin, proteaz inhibitörü, nükleosit analogları, ralgetavir, ribavirin, rimantadin, ritonavir, piramidin, saquinavir, sofosbuvir, stavudin, telaprevir, tenofovir, tipranavir, trifliridine, trizivir, tromantadin, trovada, valasiklovir, valgansiklovir, vidarabin, viramidin, zalsitabin, zanamivir, zidovudin'i içeren grubun içerisinde veya burada sayılan ajanların ikili veya üçlü kombinasyonları içerisinde seçilebilir.

Buluşun tercih edilen bir diğer uygulamasında Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşikler en az bir adet antiparazitik etki gösteren aktif bileşiklerle kombine edilir.

Formül I ile gösterilen bileşiklerle kombine olarak kullanılacak antiparazitik etki gösteren aktif bileşikler nitazoksanit, melarsoprol, eflornitin, metronidazol, tinidazol, miltefosin, mebendazol, pirantel pamoat, tiyabendazol, dietilkarbamazin, ivermektin, niklosamid, prazikuantel, albendazol, rifampin, amfoterisin B, fumagillin, furazolidon, nifursemizon, nitaksozanid, ornidazol, paramomisin sülfat, pentamidin, pirimetamine, tinidazol, albendazol, mebendazol, tiyabendazol, fenbendazol, triklabendazol, flubendazol, abamektin, dietilkarbamazin, ivermektin, suramin, pirantel pamoat, levamisol, niklosamid, nitaksozanid, oksiklonazd, monepantel,

derquantel, amfoterisin B, üre stibamin, sodyum stiboglukonat, meglumin antimoniat, paromomisin, miltefosin, flukonazol, pentamidin'den oluşan bir grubun içerisinde veya bunların ikili, üçlü kombinasyonları içerisinde seçilebilir.

5 Buluşun tercih edilen bir diğer uygulamasında Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşikler en az bir adet antineoplastik etki gösteren aktif bileşik ile kombine edilir.

Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen bileşiklerle kombine olarak kullanılabilecek antineoplastik etki gösteren aktif bileşikler siklofosfamid, ifosfamid, temozolomid, kapesitabin, 5-
10 floro urasil, metotreksat, gemesitabin, pemetrekset, mitomisin, bleomisin, epirubisin, doksorubisin, etoposid, paklitaksel, irinotekan, dosetaksel, vinkristin, karboplatin, cisplatin, okzaliplatin, bevacizumab, setuksimab, gefitinib, imatinib, trastuzumab, denosumab, rituksimab, sunitinib, zoledronat, abirateron, anastrozol, bikalutamid, eksemestan, goserelin, medroksiprogesteron, oktreotid, tamoksifen, bendamustin,
15 karmustin, klorambusil, lomustin, melfalan, prokarbazin, streptozosin, fludarabin, raltitrexed, aktinomisin D, daktinomisin, doksorubisin, mitoksantron, eribulin, topotekan, vinblastin, vinorelbin, afatinib, aflibersept, krizotinib, dabrafenib, interferon, ipilimumab, lapatinib, nivolumab, panitumumab, pembrolizumab, pertuzumab, sorafenib, trastuzumab emtansin, temsorilimus, vemurafenib, ibandronik
20 asit, pamidronat, bexarotan, buserelin, siproteron, degarelik, folinik asit, fulvestrant, lanreotid, lenalidomid, letrozole, leuprorel, megestrol, mesna, talidomid'den oluşan bir grubun içerisinde veya bunların ikili veya üçlü kombinasyonları içerisinde seçilebilir.

Buluşun bir diğer uygulamasında en az bir diğer etken madde buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII
25 bileşikleriyle beraber veya ayrı ayrı formüle edilebilir ve söz konusu en az bir diğer etken madde Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII bileşikleriyle aynı veya farklı dozaj formunda olabilir.

Buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII bileşikleriyle beraber yukarıda sayılan en az bir diğer etken maddenin kullanılması durumunda söz konusu diğer etken maddeler Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII'e uygun
30

maddelerle aynı zamanda, birbirini takip eder şekilde sıralı olarak veya birbirinden farklı zamanlarda verilebilir.

5 Buluşa uygun formülasyonlar Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen etken maddelere ilaveten en az bir yardımcı madde içerebilir.

10 Buluşa uygun Formül I, Formül II, Formül III, Formül IV, Formül V, Formül VI, Formül VII, Formül VIII ile gösterilen etken maddelerin kullanılabileceği doz aralığı hastanın ihtiyaçları, hastalığın evresi ve kullanılacak etken maddeye göre belirlenir. Belirli bir duruma uygun dozun belirlenmesi tekniğin bilinen durumunda yetkili kişilerce bilinmektedir.

Bu tarifname bağlamında içerir ifadesinin kapsar ifadesini belirtmesi amaçlanmıştır.

Teknik açıdan uygun olan yerlerde, buluşun uygulamaları birleştirilebilir.

15 Uygulamalar burada belirli özellikler/elemanlar içerecek şekilde açıklanmıştır. Tarifname ayrıca esas olarak bahsi geçen özellikleri/elemanları içeren ya da bunlardan meydana gelen diğer uygulamaları da kapsamaktadır.

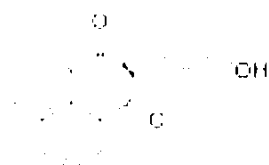
Patentler ve başvurular benzeri teknik referanslar referans yolu ile bu dokümana dahil edilmiştir.

Burada spesifik olarak ve açıkça anlatılan uygulamalar tek başına ya da bir veya birkaç diğer uygulama ile birlikte bir feragatnameye esas teşkil edebilir.

20 Şimdi buluş sadece örnek amaçlı olan ve bu buluşun kapsamını herhangi bir şekilde kısıtlar olarak yorumlanmaması gereken aşağıdaki örneklere atıfta bulunularak açıklanacaktır.

ÖRNEKLER:

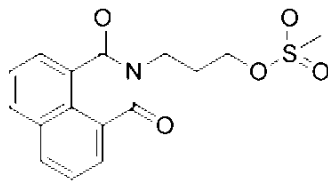
25 Örnek 1: 2-(3-hidroksipropil)-1H-benzo[de]izokinolin-1,3(2H)-dion (Formül X) sentez yöntemi



DMF içerisinde çözölen 4-amino-1,8-naftalik anhidrit (1 mmol) çözeltisinin içerisinde 3-Amino-1-propanol (1 mmol) ve DBU (1 mmol) ilave edilerek 4 saat boyunca 70°C sıcaklıkta karışması sağlandı. Ardından ortama buzlu su eklenerek oluşan katı filtre edildi ve ürün saf olarak elde edildi. Reaksiyonun ilerleyişı DCM/MeOH:40/1 çözöcü sistemi ile TLC çalışması yapılarak kontrol edildi. (Verim: %98)

Analiz Verileri: LC-MS: m/z 256 [M+1]

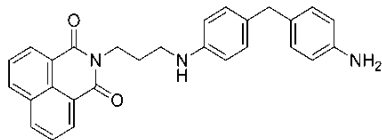
Örnek 2: 3-(1,3-diokso-1H-benzo[de]isokinolin-2(3H)-il)propil metansulfonat (Formöl Y) sentez yöntemi



10 2-(3-hidrokspropil)-1H-benzo[de]isokinolin-1,3(2H)-dion DCM'de çözöldü. Ardından ortama TEA (1.2 mmol) eklendi ve 15 dakika boyunca 0°C de karışması sağlandı. Sonra ortama para-metil sülfonil klorid (1.2 mmol) eklenerek 2 saat boyunca reaksiyon karıştırıldı. Reaksiyonun ilerleyişı DCM/MeOH (10/1) çözöcü sistemiyle kontrol edildi. Reaksiyon buzlu suda çöktürme ve süzme ile sonlandırılarak ürün saf olarak elde edildi. (Verim: %86)

Analiz Verileri: LC-MS: m/z 334 [M+1]

Örnek 3: 2,2'-(((metilenbis(4,1-fenilen)))bis(azandiil)))bis-(propan-3,1-diil))bis(1H-benzo[de]isokinolin-1,3(2H)-dion), (C₄₃H₃₆N₄O₄) (Formöl 1) sentez yöntemi



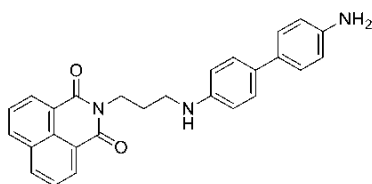
20 ACN ortamında 70°C de 2 saat boyunca Formöl Y'nin (1 mmol) NaI (6 mmol) ile karıştırılması sağlandı. Aynı zamanda başka bir reaksiyon balonunda Diaminodifenilmetan (1 mmol) ve K₂CO₃ (6 mmol)' ün ACN ortamında 70°C de 2 saat boyunca karışması sağlandı. Ardından bu iki reaksiyon birbirine karıştırılarak reaksiyona devam edildi. TLC kontrolü yapılarak 12 saat sonunda reaksiyonun 25 çözöcüsü vakumlu bir sistemde uzaklaştırıldı. Sonrasında kloroform ve sulu NaCl çözeltisi ile ekstraksiyon yapılarak reaksiyon sonlandırıldı. Organik faz kuru Na₂SO₄

içerisine konularak filtre edildi ve çözücüsü uzaklaştırıldı. Ürünün saflaştırılmasında DCM / MeOH (40: 1) çözücü sistemi kullanılarak kolon kromatografisi ile saflaştırma işlemi gerçekleştirilmiştir.

Analiz Verileri: LC-MS: m/z 436 [M+1].

- 5 ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃): δ= 1.95 (p, *J* = 6.7 Hz, 2H, CH₂), 3.10 (t, *J* = 6.5 Hz, 2H, NHCH₂), 3.66 (s, 2H, PhCH₂), 4.20 (t, *J* = 6.9 Hz, 2H, NCH₂), 6.52 – 6.48 (m, 4H, 4xArH), 6.87 (dd, *J* = 8.2, 5.3 Hz, 4H, 4xArH), 7.66 – 7.61 (m, 2H, 2xArH), 8.09 (dd, *J* = 8.3, 0.7 Hz, 2H, 2xArH), 8.48 (dd, *J* = 7.3, 0.9 Hz, 2H, 2xArH) ppm.

- Örnek 4: 2,2'-([1,1'-bifenil]-4,4'-diilbis(azandiil))bis-(propan-3,1-diil))bis(1H-
10 benzo[de]isokinolin-1,3(2H)-dion), (C₄₂H₃₄N₄O₄) (Formül 9) sentez yöntemi

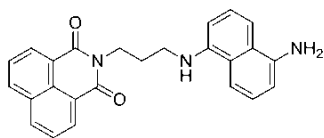


- ACN ortamında 70⁰C de 2 saat boyunca Formül Y'nin (1 mmol) NaI (6 mmol) ile karıştırılması sağlandı. Aynı zamanda başka bir reaksiyon balonunda Benzidin (1 mmol) ve K₂CO₃ (6 mmol)' ün ACN ortamında 70⁰C de 2 saat boyunca karışması
15 sağlandı. Ardından bu iki reaksiyon birbirine karıştırılarak reaksiyona devam edildi. TLC kontrolü yapılarak 12 saat sonunda reaksiyonun çözücüsü vakumlu bir sistemde uzaklaştırıldı. Sonrasında kloroform ve sulu NaCl çözeltisi ile ekstraksiyon yapılarak reaksiyon sonlandırıldı. Organik faz kuru Na₂SO₄ içerisine konularak filtre edildi ve çözücüsü uzaklaştırıldı. Ürünün saflaştırılmasında DCM / MeOH (20: 1) çözücü
20 sistemi kullanılarak kolon kromatografisi ile saflaştırma işlemi gerçekleştirilmiştir.

Analiz Verileri: LC-MS: m/z 423 [M+1].

- ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃): δ= 1.99-2.06 (m, 2H, CH₂), 3.18 (t, *J* = 6.4 Hz, 2H, NHCH₂), 4.26 (t, *J* = 6.8 Hz, 2H, NCH₂), 6.67 – 6.61 (m, 4H, 4xArH), 7.30 – 7.25 (m, 2H, 4xArH), 7.69 (dd, *J* = 12.8, 5.2 Hz, 2H, 2xArH), 8.16 (dd, *J* = 8.2, 0.7 Hz, 2H, 2xArH), 8.55 (dd, *J* = 7.3, 0.9 Hz, 2H, 2xArH) ppm.

Örnek 5: 2-(3-((5-aminonaftalen-1-il)amino)propil)-1H-benzo[de]isokinolin-1,3(2H)-dion, (C₂₅H₂₁N₃O₂) (Formül 61) sentez yöntemi

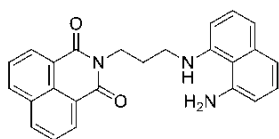


ACN ortamında 70⁰C de 2 saat boyunca Formül Y'nin (1 mmol) NaI (6 mmol) ile karıştırılması sağlandı. Aynı zamanda başka bir reaksiyon balonunda 1,5-Diaminodifenilmetan (1 mmol) ve K₂CO₃ (6 mmol)' ün ACN ortamında 70⁰C de 2 saat boyunca karışması sağlandı. Ardından bu iki reaksiyon birbirine karıştırılarak reaksiyona devam edildi. TLC kontrolü yapılarak 12 saat sonunda reaksiyonun çözücüsü vakumlu bir sistemde uzaklaştırıldı. Sonrasında kloroform ve sulu NaCl çözeltisi ile ekstraksiyon yapılarak reaksiyon sonlandırıldı. Organik faz kuru Na₂SO₄ içerisine konularak filtre edildi ve çözücüsü uzaklaştırıldı. Ürünün saflaştırılmasında DCM / MeOH (25: 1) çözücü sistemi kullanılarak kolon kromatografisi ile saflaştırma işlemi gerçekleştirilmiştir.

Analiz Verileri: LC-MS: m/z 396 [M+1].

¹H NMR (500 MHz, CDCl₃): δ= 2.13 (p, *J* = 6.6 Hz, 2H, CH₂), 3.33 (t, *J* = 6.3 Hz, 2H, NHCH₂), 4.33 (t, *J* = 6.7 Hz, 2H, NCH₂), 6.57 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H, ArH), 6.71 (d, *J* = 7.3 Hz, 1H, ArH), 7.09 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H, ArH), 7.22 (dd, *J* = 8.8, 1.3 Hz, 1H, ArH), 7.28 – 7.24 (m, 1H, ArH), 7.41 (t, *J* = 6.1 Hz, 1H, ArH), 7.70 (dt, *J* = 11.6, 5.8 Hz, 2H, 2xArH), 8.17 (dd, *J* = 8.3, 0.9 Hz, 2H, 2xArH), 8.58 (dd, *J* = 7.3, 1.0 Hz, 2H, 2xArH) ppm.

Örnek 6: 2-(3-((8-aminonaftalen-1-il)amino)propil)-1H-benzo[de]isokinoline-1,3(2H)-dion, (C₂₅H₂₁N₃O₂) (Formül 62) sentez yöntemi



ACN ortamında 70⁰C de 2 saat boyunca Formül Y'nin (1 mmol) NaI (6 mmol) ile karıştırılması sağlandı. Aynı zamanda başka bir reaksiyon balonunda 1,8-Diaminodifenilmetan (1 mmol) ve K₂CO₃ (6 mmol)' ün ACN ortamında 70⁰C de 2 saat boyunca karışması sağlandı. Ardından bu iki reaksiyon birbirine karıştırılarak reaksiyona devam edildi. TLC kontrolü yapılarak 12 saat sonunda reaksiyonun çözücüsü vakumlu bir sistemde uzaklaştırıldı. Sonrasında kloroform ve sulu NaCl çözeltisi ile ekstraksiyon yapılarak reaksiyon sonlandırıldı. Organik faz kuru Na₂SO₄

içerisine konularak filtre edildi ve çözücüsü uzaklaştırıldı. Ürünün saflaştırılmasında DCM / MeOH (100: 1) çözücü sistemi kullanılarak kolon kromatografisi ile saflaştırma işlemi gerçekleştirilmiştir.

Analiz verileri: LC-MS: m/z 396 [M+1].

- 5 ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃): δ= 2.17 – 2.13 (m, 2H, CH₂), 3.19 (t, *J* = 6.5 Hz, 2H, NHCH₂), 4.34 (dd, *J* = 13.9, 6.8 Hz, 2H, NCH₂), 6.57 (t, *J* = 8.2 Hz, 1H), 6.64 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 7.11 (d, *J* = 4.1 Hz, 1H), 7.13 (d, *J* = 3.7 Hz, 1H, ArH), 7.18 (d, *J* = 3.3 Hz, 1H, ArH), 7.20 (d, *J* = 5.4 Hz, 1H, ArH), 7.71 – 7.67 (m, 2H, 2xArH), 8.15 (dd, *J* = 8.3, 1.0 Hz, 2H, 2xArH), 8.54 (dd, *J* = 7.3, 1.0 Hz, 2H, 2xArH) ppm.

10 Örnek 7: Formül 9'un Leishmania Infantum Parazitlerine Karşı Biyolojik Aktivitesi

Metot ve Materyaller:

Parazit Kültürü: Leishmania infantum (MHOM/MA/67/ITMA-P263) promastigotları 27°C'de RPMI mediumunda (ısıca inaktive ettirilmiş %10 fetal bovin serum, 2 mM L-glutamine, 20 mM HEPES, 100 U/ml penicillin, 100 µg/ml streptomisin eşliğinde) 15 inkübe edilir. Logaritmik faza ulaşan parazitler (10⁶/ml) enfektif hale getirilir.

- Alamar Blue Hücre Canlılığı Testi: Leishmania infantum (MHOM/MA/67/ITMA-P263) promastigotları 27°C'de RPMI mediumu içerisinde (ısıca inaktive ettirilmiş %10 fetal bovin serum, 2 mM L-glutamine, 20 mM HEPES, 100 U/ml penicillin, 100 µg/ml streptomisin eşliğinde) 96 kuyucuklu kültür kaplarına (Corning Glasswork, 20 Corning, NY) 8x10⁶ parazit/kuyucuk olacak şekilde ekildikten sonra 3. gün parazitlerin canlılık düzeyleri ölçülmüştür. Alamar Blue testi (Sigma-Aldrich, Almanya) uygulanarak parazitlerin canlılığı tespit edilir. 100µl büyüme besiyeri içerisinde olan hücrelerin üzerine 10µl Alamar Blue solüsyonu eklenir ve bir gün karanlıkta inkübe edilir. İnkübasyon süresinden sonra 530/590 nm dalga boyunda 25 ELISA plaka okuyucu (Biotek, Winooski, VT) cihazı ile abzorban ölçümü yapılarak canlılık analizi gözlemlenir.

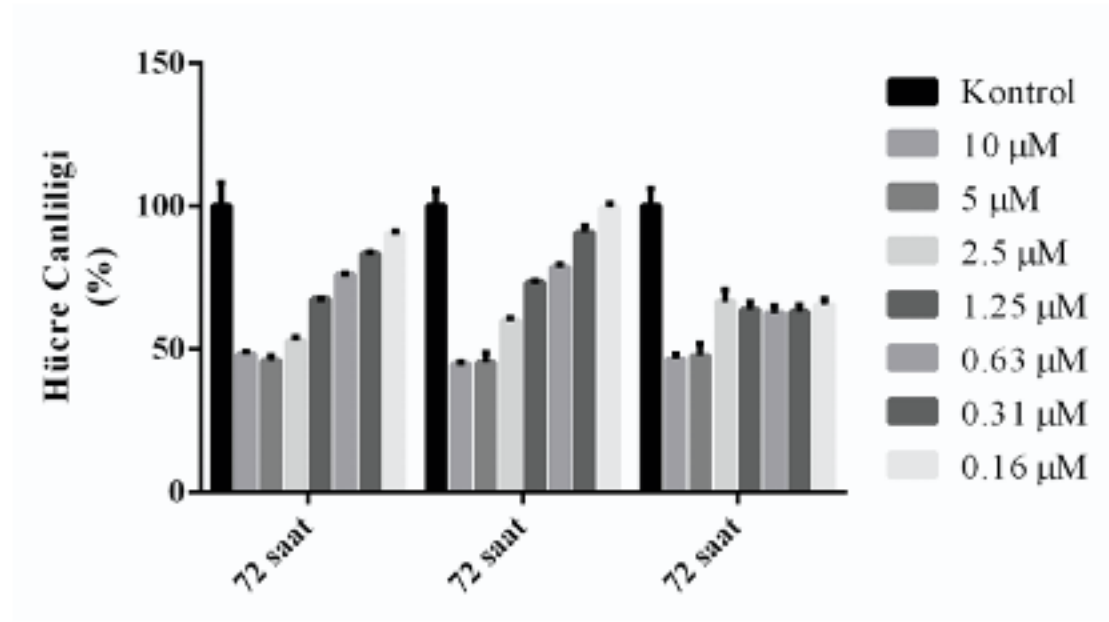
Sonuç:

- Buluş kapsamında tanımlanan moleküllerden *Formül 9'un Leishmania infantum* parazitleri üzerine olan etkisi gösterilmiştir. Formül 9 bileşiği, parazitler üzerine 30 verilip 3 gün boyunca parazit canlılığına bakıldığında, yaklaşık % 45'e varan ölüm

oranı gözlenmiştir (Şekil 1). Yapılan deneyler ışığında, geliştirilen molekülün *Leishmania infantum* parazitleri üzerinde etkili olduğuna ulaşılmıştır.

5

10



Şekil 1