

(11) رقم البراءة : 8395

(51)التصنيف الدولي: C07H19/06
A61K31/7064

(52)التصنيف المحلي : 4

(21) رقم طلب البراءة : IQ/00240199

(22) تاريخ التقديم : 2024/4/29

(45)تاريخ المنح : 2025/3/20

(30) الاسبقية :

الرقم : -

التاريخ : -

البلد : -

(19)الجهاز المركزي للتقييس والسيطرة النوعية
رئاسة الجهاز
مديرية براءات الاختراع والنماذج الصناعية
القسم: الاداري – شعبة التوثيق والاستثمار

(12) براءة اختراع

(72) اسم المخترع وعنوانه:

أ.م.د. رنا نعمة عطية عبد

جامعة الكوفة / كلية الصيدلة/ فرع الكيمياء الصيدلانية

الباحث ناجي موسى علي

محافظة النجف الاشرف / قضاء النجف /حي الزهراء م116 ز18
د278

ا.د. انغام جاسم محمد علي / عميد

ا.د. عماد عباس جعفر

م.د.حيدر خضير خطار

جامعة الفرات الاوسط التقنية/كلية التقنيات الصحية والطبية / الكوفة

(73) اسم صاحب البراءة وعنوانه :

الذوات اعلاه

(74)اسم الوكيل وعنوانه :

(54)عنوان الاختراع: تحضير مشتقات البيريமிدين الجديدة كعوامل مضادة للسرطان والميكروبات.

(57) الملخص :

الفعاليات الحيوية لمشتقات البيريமிدين الجديدة كعوامل مضادة لسرطان الثدي وللميكروبات البكتريا الموجبة والسالبة والفطريات)تضمنت طريقة التحضير تفاعل المركب من تفاعل كل مركب من المركبات (9-5) (0.10 ملي مول) مع N- هالوسكسينيميد - كلوروسكسينيميد ، N-بروموسكسينمايد -N-ايودوسكسينمايد (0.12) ملي مول في 15 مل) DMF بعد التبريد إلى صفر درجة مئوية من خلال الحمام الثلجي بعد ذلك يحرك خليط التفاعل لمدة 10 ساعات في درجة حرارة الغرفة ثم يضاف خليط التفاعل الى 50 مل) من اثير اسيتو اسيتو وغسلها بواسطة محلول ملحي مشبع (50) مل (3) الطبقة العضوية تجفف بواسطة $MgSO_4$ وينقى المنتج الخام باستخدام EtOA Petroleum ether - لإعطاء لمركبات المستهدفة.

6-methyl-2-thioxo-2,3-dihydropyrimidine-4-(1H) - one

مع هاليدات الكيل معوضه في الداى مثيل سلفوكسايد وكاربونات البوتاسيوم لينتج المشتقات (9-5) التي بدورها تتفاعل مع

chlorosuccinimide, N-bromosuccinimide and N-iodosuccinimide في DMF على التوالي ليتم الحصول على مشتقات البيريமிدين الجديدة مدرجة ادناه

2-Arylkalkylthio-5-chloro-6-methylpyrimidine-4-(3H)-one

(12,13,16,19and 22)

2- Aryl alkyl thio-5-bromo-6-methylpyrimidine-4-(3H)-one

(11,14,17,20and23)

2-Aryl alky 1 thio-5-iodo-6-methylpyrimidine-4-(3H)-one

(12, 15, 18, 21and 24)

استخدمت الطرائق الطيفية (^{13}C -NMR, 1H -NMR, FT-IR) لإثبات تراكيب المشتقات

المحضرة. اختبار النشاط الحيوي لبعض المشتقات الجديدة (12-15) و (21-24) طبقت على نوعين من البكتيريا العنقودية الذهبية (موجبة الغرام) والبكتيريا القولونية سالبة الجرام) وقورنت النتائج مع بنزيل البنسلين كمضاد قياسي وعلى نوع واحد من الفطريات (المبيضات البيض) وقورنت النتائج مع فلوكونازول كمضاد قياسي. اعطت المشتقات المحضرة نتائج جيدة ضد البكتريا المختبرة مقارنة بالمضاد القياسي كذلك اظهرت جميع المشتقات المختبرة كمضاد للفطريات نشاط بيولوجي اعلى من المضاد القياسي عند تركيز $100 \mu g/mL$. اما دراسة النشاط المضاد لسرطان الثدي للمركب (15) بينت ان المركب المفحوص له نشاط واعد هام ضد سرطان الثدي من خلال تأثيره الفعال ضد خلايا سرطان مقارنة بتأثيره القليل جدا على الخلايا الطبيعية. اظهرت الدراسة الأولية لاختبار النشاط الحيوي للمركب (15) على خط خلايا سرطان الثدي MCF-7 تأثير سمية عالية يقدر ب (72.3) بينما أظهر تأثير سمية منخفض على الخلايا الطبيعية (11.3) وبنفس التركيز.