



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20160168 T1

HR P20160168 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEJVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

C07H 17/08 (2006.01)
A61K 31/7048 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 25.03.2016.

(21) Broj predmeta: P20160168T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 16.02.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2011029424
Datum podnošenja međunarodne prijave: 22.03.2011.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 11760068.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 22.03.2011.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2011119604
Datum međunarodne objave: 29.09.2011.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2550286 A1
Datum objave europske prijave patenta: 30.01.2013.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2550286 B1
Datum objave europskog patenta: 09.12.2015.

(31) Broj prve prijave: 316063 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 22.03.2010. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

Cempra Pharmaceuticals, Inc., 6320 Quadrangle Drive, Suite 360, Chapel Hill, NC 27517, US

(72) Izumitelj:

David E. Pereira, 103 Lansbrooke Lane, Apex, NC 27502, US

(74) Zastupnik:

Tatjana Sučić, dipl. ing. i mr.sc. Gordana Turkalj, dipl. ing.kem.tehn., Callidea d.o.o., 10000 Zagreb, HR

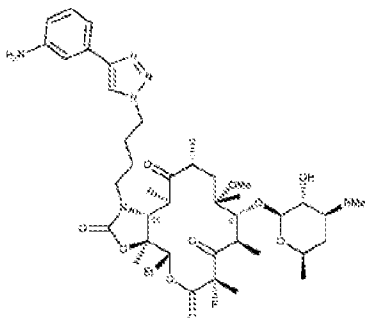
(54) Naziv izuma:

KRISTALNE FORME MAKROLIDA I NJIHOVA UPORABA

HR P20160168 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Spoj CEM-101 formule



- 10 kristalne Forme I koji ima rendgenski difraktogram praškastog uzorka uključujući pikove na oko $2\theta = 8.8, 10.5, 13.2, \text{ i } 18.6$; ili Forme II koji ima rendgenski difraktogram praškastog uzorka uključujući pikove na oko $2\theta = 5.6, 7.9, 9.3, 11.7, 12.9, \text{ i } 16.7$; gdje je svaki od navedenih pikova detektiran od upadnog snopa Cu K α zračenja, i je $60.2 \text{ } 2\theta$.
2. Forma prema zahtjevu 1, **naznačena time** da uključuje Formu I, ili je Forma I CEM-101 koja ima rendgenski difraktogram praškastog uzorka s pikovima na $2\theta = 8.8, 10.5, 13.2 \text{ i } 18.6$, koja je poželjno slobodna od Forme II CEM-101, još poželjnije, gdje su jedan ili više pikova na $2\theta = 5.6, 9.8, \text{ i/ili } 11.7$ odsutni, gdje je svaki od navedenih pikova detektiran od upadnog snopa Cu K α zračenja, i je $60.2 \text{ } 2\theta$.
- 15 3. Forma prema zahtjevu 1, **naznačena time** da uključuje Formu II, ili je Forma II CEM-101 koja ima rendgenski difraktogram praškastog uzorka s pikovima na $2\theta = 5.6, 7.9, 9.3, 11.7, 12.9 \text{ i } 16.7$, koja je poželjno slobodna od Forme I CEM-101, poželjnije, gdje su jedan ili više pikova na $2\theta = 6.2 \text{ i/ili } 8.8$ odsutni, gdje je svaki od navedenih pikova detektiran od upadnog snopa Cu K α zračenja, i je $60.2 \text{ } 2\theta$.
4. Forma prema zahtjevu 1, **naznačena time** da je čista Forma I CEM-101.
- 20 5. Forma prema zahtjevu 1, **naznačena time** da je čista Forma II CEM-101.
6. Forma prema zahtjevu 1, **naznačena time** da je Forma I CEM-101 koja ima rendgenski difraktogram praškastog uzorka detektiran od upadnog snopa Cu K α zračenja isti kao na SL. 1.
7. Forma prema zahtjevu 1, **naznačena time** da je Forma II CEM-101 koja ima rendgenski difraktogram praškastog uzorka detektiran od upadnog snopa Cu K α zračenja isti kao na SL. 2.
- 25 8. Farmaceutski pripravak koji sadrži CEM-101 kristalne forme kao što je opisano u bilo kojem od zahtjeva 1-7 i nadalje sadrži najmanje jedan farmaceutski prihvatljiv nosač ili pomoćno sredstvo.
9. Farmaceutski pripravak koji sadrži CEM-101 kristalne forme kao što je opisano u bilo kojem od zahtjeva 1-7 za uporabu u tretiranju bakterijske infekcije, protozoalne infekcije, ili poremećaja povezanog s bakterijskom infekcijom ili protozoalnom infekcijom.
- 30 10. Uporaba CEM-101 kristalne forme kao što je opisano u bilo kojem od zahtjeva 1-7 ili farmaceutskog pripravka prema zahtjevu 8 za proizvodnju lijeka za tretiranje bakterijske infekcije, protozoalne infekcije, ili poremećaja povezanog s bakterijskom infekcijom ili protozoalnom infekcijom.
11. Uporaba prema bilo kojem od zahtjeva 9 i 10, **naznačeno time** da je subjekt sisavac, riba, ptica ili reptil, poželjno čovjek.
- 35 12. Postupak za dobivanje Forme I CEM-101 prema zahtjevu 1, **naznačeno time** da postupak obuhvaća korak dodavanja otopine CEM-101 u s vodom miješljivim, polarnim organskim otapalom u vodu pri temperaturi ispod $50 \text{ } ^\circ\text{C}$, poželjno pri čemu je forma I CEM-101 slobodna od drugih fizičkih formi.
13. Proces prema zahtjevu 12 nadalje sadrži jedan ili više slijedećih koraka:
zagrijavanje otopine CEM-101;
40 filtriranje otopine CEM-101;
reduciranje volumena otopine CEM-101 evaporacijom; i
miješanje vode tijekom dodavanja otopine CEM-101.
14. Proces prema zahtjevu 13, **naznačen time** da je otapalo aceton, metanol ili etanol, ili njihova kombinacija, najpoželjnije gdje je otapalo aceton.
- 45 15. Proces prema zahtjevu 14, **naznačen time** da se otopina dodaje u vodu pri temperaturi od $10 \text{ } ^\circ\text{C}$ do $30 \text{ } ^\circ\text{C}$.
16. Proces za pripremu Forme II CEM-101 prema zahtjevu 1, poželjno slobodne od drugih fizičkih formi, **naznačeno time** da proces sadrži korak dodavanja vode otopini CEM-101 u s vodom miješljivim, polarnim organskim otapalom.
17. Proces prema zahtjevu 16 nadalje sadrži jedan ili više od slijedećih koraka:
50 filtriranje otopine CEM-101;
reduciranje volumena otopine CEM-101 evaporacijom; i
miješanje otopine CEM-101 tijekom dodavanja vode, poželjno gdje je otapalo aceton, acetonitril, 1,4-dioksan,

metanol ili etanol, ili njihova kombinacija, poželjnije gdje je otopina CEM-101 na temperaturi iznad ambijentalne.

18. Postupak za pročišćavanje CEM-101 koji obuhvaća pretvaranje jedne ili više formi ili mješavina formi CEM-101 u Formu I ili Formu II, svaki prema zahtjevu 1, postupak obuhvaća korak dodavanja otopine CEM-101 u s vodom miješljivim, polarnim organskim otapalom u vodu pri temperaturi ispod 50 C; ili postupak sadrži korak dodavanja vode u otopinu CEM-101 u s vodom miješljivim, polarnim organskim otapalom.

5