



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20140421 T1

HR P20140421 T1

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

(51) MKP:

C12P 33/00 (2006.01)

C07J 5/00 (2006.01)

A61K 31/573 (2006.01)

A61P 5/28 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 06.06.2014.

(21) Broj predmeta: P20140421T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 09.05.2014.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2008059702
Datum podnošenja međunarodne prijave: 24.07.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08775319.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 24.07.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2009019138
Datum međunarodne objave: 12.02.2009.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2173891 A2
Datum objave europske prijave patenta: 14.04.2010.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2173891 B1
Datum objave europskog patenta: 12.02.2014.

(31) Broj prve prijave: MI20071616 (32) Datum podnošenja prve prijave: 03.08.2007. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: IT

(73) Nositelj patenta:

Cosmo Dermatos SRL, Via C. Colombo, 1, 20020 Lainate (MI), IT

(72) Izumitelji:

Mauro Ajani, Via C. Colombo 1, 20020 Lainate, IT

Luigi Moro, Via C. Colombo 1, 20020 Lainate, IT

(74) Zastupnik:

Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

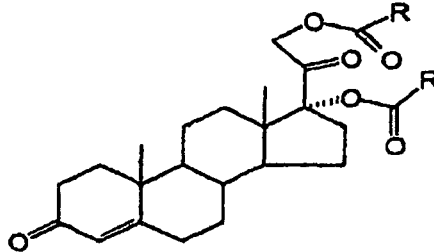
**ENZIMSKI POSTUPAK DOBIVANJA KORTERKSOLON-17 α -PROPIONATA, U KRISTALNOM
OBLIKU III**

HR P20140421 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

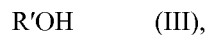
5

1. Postupak dobivanja korteksolon-17 α -propionata u kristalnom obliku III, gdje je navedeni kristalni oblik III **naznačen time** što ima DRX spektar, kao što je prikazan na Slici 7 ili 10 ili 13, što ima DSC spektar, kao što je prikazan na Slici 8 ili 11 ili 14, te što ima IR spektar, kao što je prikazan na Slici 9 ili 12 ili 15, gdje se navedeni postupak sastoji u reakciji spoja formule II



10

u organskom otapalu sa spojem formule III



15

u prisutnosti lipaze iz kvasca *Candida*, gdje R je CH₃-CH₂, a R' je nerazgranati alifatski lanac, koji sadrži 1-10 atoma ugljika, kako bi se dobilo korteksolon-17 α -propionat, te kristaliziranju navedenog korteksolon-17 α -propionata iz smjese diklormetan/*n*-heksan, ili smjese aceton/*n*-heksan ili smjese etanol/voda, kako bi se dobilo korteksolon-17 α -propionat u kristalnom obliku III.

20

2. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je navedena smjesa diklormetan/*n*-heksan u omjeru od otprilike 1:30, navedena smjesa aceton/*n*-heksan je u omjeru od otprilike 1:8, ili navedena smjesa etanol/voda je u omjeru od otprilike 1:2.
3. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je R' alifatski lanac, koji sadrži 1-8 atoma ugljika.
4. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je navedeno organsko otapalo neprotonsko.
- 25 5. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što se navedeno organsko neprotonsko otapalo bira između toluena, acetonitrila, tetrahidrofurana, diklormetan i/ili kloroforma.
6. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što navedeni spoj formule II dolazi u rasponu količina od otprilike 0,01 do 0,15 mol, po mogućnosti od 0,025 mol.
7. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što se navedeni spoj formule III bira između metanola, etanola, butanola i/ili oktanola.
- 30 8. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što navedeni spoj formule III dolazi u rasponu količina od otprilike 0,5 do otprilike 50 mol/mol spoja formule II.
9. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što navedeni spoj formule III dolazi u količini od 5 mol/mol spoja formule II.
- 35 10. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je navedena lipaza iz kvasca *Candida* lipaza iz kvasca *Candida cylindracea* (CCL) ili *Candida antartica* tip B (CALB).
11. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što navedena lipaza iz kvasca *Candida* dolazi u rasponu količina od otprilike 100 do 1.000.000 U/mmol.
12. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačen time** što navedena lipaza iz kvasca *Candida* dolazi u rasponu količina od otprilike 1.000 do 1.000.000 U/mmol za kvasac *Candida cylindracea* (CCL), te u rasponu od otprilike 100 do 100.000 U/mmol za kvasac *Candida antartica* tip B (CALB).
- 40 13. Postupak u skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što se reakciju spoja formule II sa spojem formule III provodi u rasponu temperatura od 10 do 48 °C.
14. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 13, **naznačen time** što temperatura je u rasponu od 20 do 32 °C.
- 45 15. Korteksolon-17 α -propionat u kristalnom obliku III **naznačen time** što ima DRX spektar, kao što je prikazan na Slici 7 ili 10 ili 13, što ima DSC spektar, kao što je prikazan na Slici 8 ili 11 ili 14, te što ima IR spektar, kao što je prikazan na Slici 9 ili 12 ili 15.
16. Korteksolon-17 α -propionat u kristalnom obliku III u skladu s patentnim zahtjevom 15, **naznačen time** što ima DRX spektar, kao što je prikazan na Slici 7 i DSC spektar, kao što je prikazan na Slici 8, te što ima IR spektar, kao što je prikazan na Slici 9.
- 50 17. Korteksolon-17 α -propionat u kristalnom obliku III u skladu s patentnim zahtjevom 15, **naznačen time** što ima DRX spektar, kao što je prikazan na Slici 10 i DSC spektar, kao što je prikazan na Slici 11, te što ima IR spektar, kao što je prikazan na Slici 12.

18. Korteksolon-17 α -propionat u kristalnom obliku III u skladu s patentnim zahtjevom 15, **naznačen time** što ima DRX spektar, kao što je prikazan na Slici 13 i DSC spektar, kao što je prikazan na Slici 14, te što ima IR spektar, kao što je prikazan na Slici 15.
- 5 19. Farmaceutski pripravak koji sadrži korteksolon-17 α -propionat u kristalnom obliku III u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 15 do 18, **naznačen time** što je navedeni spoj u smjesi s najmanje jednom fiziološki prihvatljivom pomoćnom tvari.
20. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 19, **naznačen time** što je u čvrstom, polučvrstom ili pastoznom obliku.
- 10 21. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 19, **naznačen time** što je navedeni pripravak u obliku tablete, kapsule, praška, peleta, suspenzije, emulzije, kreme, gela, masti ili paste.
22. Korteksolon-17 α -propionat u kristalnom obliku III u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 15 do 18, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju patoloških pojava koje pogađaju urogenitalni sustav, endokrini sustav, kožu i/ili derivate kože.
- 15 23. Korteksolon-17 α -propionat u kristalnom obliku III u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 15 do 18, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju akni, seboreičnog dermatitisa, androgene alopecije, hirsutizna, dobroćudna hiperplazije prostate, raznih oblika raka prostate, kod muške kontracepcije, u liječenju sindroma policističnih jajnika, preranog puberteta, te u kontroli agresivnog ili anomalnog spolnog ponašanja.