



Завод за
интелектуалну својину
Републике Србије

Састављање патентне пријаве са примерима из области

Завод за интелектуалну својину
Кнегиње Љубице 5
11000 Београд
www.zis.gov.rs

Ивана Крџић, патентни испитивач
ikrdzic@zis.gov.rs

27. октобар 2016.

Делови патентне пријаве

- I. Опис
- II. Патентни захтеви
- III. Апстракт
- IV. Нацрт



The Intellectual
Property Office of the
Republic of Serbia

I. Опис

Проналазак мора бити описан **потпуно** и **јасно**, тако да га стручњак из дате области може извести.

Делови описа:

1. Назив проналаска
2. Област технике
3. Технички проблем
4. Стање технике
5. Излагање суштине проналаска
6. Кратак опис слика нацрта
7. Детаљан опис проналаска са примерима извођења
8. Индустриска примена



1. Назив проналаска

Назив проналаска мора **јасно** и **сажето** да изрази техничку суштину проналаска.

Забрањено:

- Комерцијални називи или жигови
- Имена
- Шифре
- Скраћенице

Пример:

Anodni materijal visoke gustine i postupak njegovog dobijanja

EP2722914



2. Област технике

Дефинише се област технике којој припада проналазак.

Пример:

Oblast tehnike

Predmetni pronalazak se odnosi na aktivni materijal za anodu koji sadrži čestice litijum metal oksida visoke gustine, sekundarnu litijum bateriju koja sadrži pomenuti materijal i postupak dobijanja aktivnog materijala za anodu.



3. Технички проблем

Дефинише се технички проблем за чије се техничко решење тражи заштита патентом.

Пример:

Tehnički problem

U slučaju kada je prosečni prečnik čestica litijum metal oksida manji od 5 μm , količina vezivnog sredstva potrebna da bi se dobila željena adhezija raste zbog porasta specifične površine anodnog materijala što za posledicu ima smanjenje provodljivosti elektrode. U slučaju kada je prosečni prečnik čestica litijum metal oksida veći od 12 μm , sposobnost baterije da se brzo puni opada.

Prema tome, potrebno je obezbediti čestice litijum metal oksida koje imaju prosečan prečnik između 5 μm i 12 μm , koje su visoke gustine tako da se smanji količina vezivnog sredstva potrebna da se dobije željena adhezija na anodu i omogući direktna reakcija sa jonima litijuma kako bi se poboljšale osobine brzog punjenja baterije.



4. Стање технике

- Наводи се **преглед и анализа** познатих решења истог техничког проблема који су познати подносиоцу пријаве уз навођење референце патентног / непатентног документа;
- Наводе се **недостаци ранијих решења** и наглашава се **предност проналаска** у односу на познато стање технике.



4a. Стање технике - пример

Пример:

Stanje tehnike

Litijum titanijum oksidi su materijali kod kojih su strukturne promene tokom punjenja i pražnjenja sekundarnih baterija ekstremno male, osobine tokom veka trajanja su odlične, može se dobiti relativno veliki opseg napona i ne dolazi do pojave dendrita. Usled toga, litijum titanijum oksidi su poznati kao materijali koji imaju odlične osobine bezbednosti i stabilnosti. Međutim, kako električna provodljivost litijum titanijum oksida može biti niža u poređenju sa ugljeničnim materijalima kao što je grafit, potrebno je izvršiti atomizaciju kako bi se poboljšala brzina punjenja i potrebna je velika količina vezivnog sredstva da bi se formirala elektroda, usled čega postoji ograničenje u upotrebi ovih materijala.

Prema pronalasku, čestice litijum metal oksida su visoke gustine tako da je adhezija na anodu značajno poboljšana a količina vezivnog sredstva koja je potrebna da se dobije ista jačina adhezije na elektrodu je značajno smanjena u poređenju sa uobičajenim anodnim materijalima uobičajene gustine. Na ovaj način, upotrebom čestica visoke gustine, omogućeno je korišćenje čestica manjeg prosečnog prečnika što rezultuje boljim karakteristikama sekundarnih baterija.



5. Суштина проналаска

- Описује се **решење техничког проблема**;
- Решење мора бити потпуно одређено и дефинисано **тако да га стручњак из дате области може извести** уз навођење новости проналаска у односу на познато стање технике.

Suština pronalaska

Prema predmetnom pronalasku opisan je **materijal za anodu** koji se sastoji od čestica litijum metal oksida sa internom poroznošću od 3% do 8% i prosečnim prečnikom čestica od 5 μm i 12 μm .

Prema drugom aspektu pronalaska, opisan je **postupak** dobijanja čestica litijum metal oksida sa internom poroznošću od 3% do 8% i prosečnim prečnikom čestica od 5 μm i 12 μm , kao i dobijanje prelaznog rastvora dodavanjem litijumove soli i metalnog oksida u isparivi rastvarač uz mešanje, sušenje tako dobijenog rastvora raspršavanjem u komori sa raspršivačem.

Prema sledećem aspektu pronalaska, opisana je **anoda** sa dobijenim materijalom.

Dalje je opisana **sekundarna baterija** koja sadrži predmetnu anodu.

6. Кратак опис слика проналаска

Потребно је укратко описати све слике нацрта и дефинисати на шта се односе.

Пример:

Kratak opis slika

Slika 1. predstavlja mikrograf skenirajućeg elektronskog mikroskopa (SEM) dobijen za $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$ prema komparativnom primeru 3; i

Slika 2. predstavlja SEM mikrograf za $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$ visoke gustine iz primera 1 dobijen prema pronalasku.

7. Детаљан опис проналаска

- Потребно је навести **све битне карактеристике** које дефинишу проналазак са довољно детаља како би се проналазак могао **успешно извести**;
- Искључити произвољности и претпоставке;
- Објаснити **повољне ефекте** проналаска;
- **Примери** су обавезан део детаљног описа:
 - Представљају **илустрацију начина реализације** и **потврду ефекта** проналаска;
 - Најчешће је потребно навести **више примера** нарочито ако патентни захтеви обухватају ширу област.

7а. Детаљан опис проналаска

- Ако се проналазак односи на **производ**:
 - у облику **конструкције**, а приказује се на нацрту, после детаљног објашњења конструкционог решења са позивом на ознаке елемената проналаска са нацрта, као доказ изводљивости описује се и начин функционисања битних елемената и конструкције у целини;
 - у облику **супстанце, композиције** или **биолошког материјала**, у опису се морају навести њихова физичко-хемијска или биолошка својства односно све битне карактеристике проналаска које се **доказују примерима извођења**.

76. Детаљан опис проналаска

- Ако се проналазак односи на **поступак**:
 - Морају се навести све његове битне **фазе и карактеристике**, тако да се изводљивост поступка може сагледати у целини;
 - Могу се користити опсежи притиска, температуре, концентрације итд. али у реалним оквирима;
 - **Доказује се примерима извођења.**



7в. Примери као део детаљног описа:

Primer 1 - Dobijanje $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$ sa prosečnim prečnikom čestica od 5.4 μm i internom poroznošću od 3.5%

$\text{LiOH} \cdot \text{H}_2\text{O}$ i TiO_2 su izmešani u molarnom odnosu 4:5. Smeša je rastvorena u čistoj vodi i rastvor je izmešan. Odnos ukupne čvrste materije je definisan kao sadržaj čvrstih materija u rastvoru i prelazni rastvor je pripremljen podešavanjem sadržaja čvrstih materija na 30%. Prelazni rastvor je stavljen u komoru za sušenje sa raspršivačem (EIN SYSTEMS) gde je osušen na temperaturi od 130°C, pritisku -20 mbar sa brzinom napajanja od 30 ml/min, i na taj način je dobijen anodni materijal $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$ sa prosečnim prečnikom čestica od 5.4 μm i internom poroznošću od 3.5% sinterovanjem prekursora na 800°C.

Eksperimentalni primer 1

Anodni materijali litijum metal oksida dobijeni prema Komparativnom primeru 3 i Primeru 1 su identifikovani na mikrogramu skenirajućeg elektronskog mikroskopa (SEM) i rezultati su prikazani na Slikama 1. i 2.

Slika 1. predstavlja SEM mikrogram za $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$ sa prosečnim prečnikom čestica 6.5 μm i sa internom poroznošću od 15%, gde je potvrđeno da je $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$ sastavljen od poroznih sekundarnih čestica gde su pore formirane na površini i unutar sekundarnih čestica usled aglomeracije primarnih čestica.

Slika 2, predstavlja primarne čestice aglomerizovane tako da čine sekundarne čestice, i SEM mikrogram za $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$ sa prosečnim prečnikom čestica 5.4 μm i internom poroznošću od 3.5%.

Moguće je vizuelno potvrditi da je $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$ dobijen prema Primeru 1 veće gustine nego $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$ iz Komparativnog primera 3.

8. Индустриска примена

Потребно је укратко описати начин индустриске или друге примене, **ако није очигледан** из описа проналаска или природе проналаска.

Пример:

Industrijska primena

Kao što je opisano prema pronalasku, čestice litijum metal oksida su visoke gustine tako da je adhezija na anodu značajno poboljšana a kao rezultat moguće je koristiti manje količine vezivnog sredstva tokom pripremanja anodnog mulja što je velika prednost u masovnoj proizvodnji sekundarnih baterija. Takođe, usled smanjenja prosečnog prečnika čestica litijum metal oksida karakteristike sekundarne baterije koja sadrži tako dobijenu anodu su poboljšane.



II. Патентни захтеви

- Патентни захтеви одређују **предмет** и **обим** заштите док опис и цртежи служе за тумачење и боље разумевање захтева;
- Морају бити **јасни**, **сажети** и у потпуности **подржани** описом;
- Патентни захтеви дефинишу проналазак искључиво **техничким карактеристикама**;
- Захтеви могу бити **независни** и **зависни**.

Независни патентни захтеви

Патентни захтев се дефинише у **једној реченици** и састоји се од:

1. **Уводног дела** где се наводе техничке карактеристике проналаска које припадају **претходном стању технике**;
2. **Карактеристичног дела**, коме претходи израз **“назначен тиме”**, где се наводе **нове техничке карактеристике** за које се тражи заштита и које представљају **допринос стању технике**.

Зависни патентни захтеви

- Зависни патентни захтев **обухвата све карактеристике** неког другог зависног или независног захтева на који се позива;
- У уводном делу садржи **упућивање на захтев од кога зависи** након чега се дефинишу **специфичне карактеристике** проналаска.

Категорије патентних захтева

- **Производ** – хемијско једињење, смеша, композиција, уређај ...
- **Поступак**
- **Употреба**

Зависни захтев мора да буде исте категорије као и независни захтев!

Пример патентних захтева

Patentni zahtevi:

1. Materijal za anodu koji se sastoji od čestica litijum metal oksida naznačen time da je litijum metal oksid izabran iz grupe koja se sastoji od $\text{Li}_4\text{Ti}_5\text{O}_{12}$, LiTi_2O_4 , Li_2TiO_3 i $\text{Li}_2\text{Ti}_3\text{O}_7$ ili njihove smeše pri čemu je interna poroznost čestica litijum metal oksida u opsegu od 3% do 8% i prosečni prečnik čestica u opsegu od 5 μm i 12 μm ; pri čemu interna poroznost čestica predstavlja zapreminu pora po jedinici mase/(specifična zapremina + zapremina pora po jedinici mase); interna poroznost se meri korišćenjem apsorpcije gasa i BET instrumentom; prosečni prečnik čestica (D_{50}) se definiše kao prečnik čestice na 50% u kumulativnoj distribuciji prečnika čestica; prosečni prečnik čestica (D_{50}) se meri metodom laserske difrakcije.
2. Materijal za anodu prema zahtevu 1 gde je čestica litijum metal oksida sekundarna čestica u kojoj su aglomerisane dve ili više primarnih čestica.
3. Materijal za anodu prema zahtevu 2 gde je prosečni prečnik primarnih u opsegu 100 nm do 400 nm.
4. Materijal za anodu prema zahtevu 1 gde je specifična površina čestica litijum metal oksida u opsegu od $2\text{m}^2/\text{g}$ do $8\text{m}^2/\text{g}$.

Пример патентних захтева

5. Postupak dobijanja materijala za anodu koji se sastoji od čestica litijum metal oksida definisanih u 1 zahtevu pri čemu se postupak sastoji od sledećih faza:
 - pripremanje prelaznog rastvora dodavanjem soli litijuma i oksida metala u isparivi rastvarač i mešanje;
 - stavljanje prelaznog rastvora u komoru za sušenje sa raspršivačem;
 - raspršavanje prelaznog rastvora u komori i sušenje.
6. Postupak prema zahtevu 5, gde je litijum so izabrana iz grupe koja se sastoji od litijum hidroksida, litijum oksida, litijum karbonata ili smeše dve ili više navedenih jedinjenja.
7. Postupak prema zahtevu 5, gde je oksid metala titanijum oksid.
8. Postupak prema zahtevu 5, gde je isparivi rastvarač voda, alkohol ili aceton.
9. Postupak prema zahtevu 5, gde je gde je brzina napajanja prelaznog rastvora u komoru za sušenje u opsegu od 10ml/min do 1000 ml/min.
10. Postupak prema zahtevu 5, gde se sušenje odvija na temperaturi od 20°C do 300°C.
11. Anoda koja sadrži anodni materijal definisan u zahtevu 1.
12. Sekundarna baterija koja sadrži anodu definisanu u zahtevu 11.



III. Апстракт

- Апстракт представља **кратак садржај суштине проналаска** који је приказан у опису, патентним захтевима и нацрту;
- Садржи највише **150 речи**.

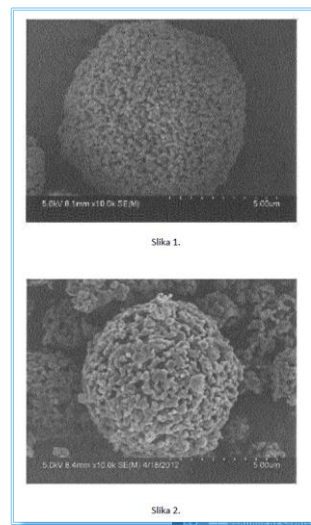
Апстракт

Pronalazak se odnosi na materijal za anodu koji se sastoji od čestica litijum metal oksida sa internom poroznošću od 3% do 8% i prosečnim prečnikom čestica (D_{50}) od 5 μm i 12 μm . Prema pronalasku, čestice litijum metal oksida su visoke gustine tako da je adhezija na anodu značajno poboljšana čak i kada se koriste iste ili manje količine vezivnog sredstva tokom pripremanja anodnog mulja. Karakteristike sekundarne baterije koja sadrži tako dobijenu anodu su poboljšane usled smanjenja prosečnog prečnika čestica litijum metal oksida.



IV. Нацрт

- **Нацрт** је **скуп свих слика** (графикони, дијаграми ...);
- Сlike не садрже текст, само редни број слике, објашњење слике се наводи у делу описа проналаска са поднасловом „кратак опис слика нацрта“.



Мали патент

- Предмет проналаска који се штити малим патентом може бити само решење које се односи на **конструкцију неког производа** или **распоред** његових саставних делова;
- Пријава малог патента може да садржи **један независан** патентни захтев и највише **четири зависна захтева**;
- Пријавом малог патента **не може** се добити заштита за **јединство проналаска** (производ + поступак + примена);
- Пријава малог патента се **може претворити у пријаву патента**, и обрнуто, до доношења решења о признању или закључка о одбацивању малог патента;
- Претворена пријава **задржава датум подношења** пријаве малог патента.



The Intellectual
Property Office of the
Republic of Serbia



Завод за
интелектуалну својину
Републике Србије

Хвала на пажњи!

Завод за интелектуалну својину
Кнегиње Љубице 5
11000 Београд

www.zis.gov.rs

Ивана Крџић, патентни испитивач
ikrdzic@zis.gov.rs

27. октобар 2016.



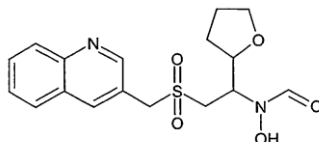
Састављање патентне пријаве - 2. пример - EP1448552



The Intellectual
Property Office of the
Republic of Serbia

Тим научника је дошао до открића:

- Пронађено је **једињење** које је инхибитор производње хуманог протеина CD23, корисно у лечењу алергија и аутоимуних болести:



- Развијен је **поступак** синтезе једињења
- Урађена су лабораторијска **испитивања** инхибиторске активности

Потребно је саставити патентну пријаву!



The Intellectual
Property Office of the
Republic of Serbia

1. Назив проналаска

Derivati hinolina, postupak za njihovo dobijanje i upotreba u lečenju
bolesti posredovanih S-CD23

2. Област технике

Predmetni pronalazak se odnosi na nove inhibitore formiranja rastvorljivog humanog CD23 i njihove upotrebe u lečenju oboljenja vezanih za prekomernu proizvodnju rastvorljivog CD23 (s-CD23) kao što su autoimune bolesti i alergije.



The Intellectual
Property Office of the
Republic of Serbia

3. Технички проблем

CD23 je integralni protein tipa II molekulske mase 45 kDa, koji je eksprimiran na površini različitih ćelija kao što su B i T limfociti, makrofagi, prirodne ćelije ubice, monociti itd. Aktivnost CD23 se vezuje za regulaciju imunog odgovora.

Ćelijski vezanom humanom i-CD23 se pripisuje više aktivnosti za koje je pokazano da imaju ulogu u regulaciji IgE. Naročito ima ulogu u prezentaciji antigena, IgE posredovanoj eozinofilnoj citotoksičnosti i regulaciji sinteze IgE. Tri rastvorljiva fragmenta više molekulske mase (Mr 37, 33 i 29 kDa) imaju multifunkcionalna citokin svojstva za koja se smatra da igraju glavnu ulogu u proizvodnji IgE. Prema tome, uvećano formiranje s-CD23 je uočeno kod prekomerne proizvodnje IgE koje je glavna karakteristika alergijskih bolesti.

Druge biološke aktivnosti uzrokovane s-CD23 uključuju i stimulaciju rasta B ćelija i indukciju oslobađanja medijatora iz monocita. Prema tome, povišen nivo s-CD23 je uočen kod pacijenata koji imaju B-hroničnu limfocitnu leukemiju i kod pacijenata sa reumatoidnim artritisom. Takođe, uočena je uloga CD23 u brojnim inflamatornim oboljenjima što je dokumentovano iz različitih izvora.

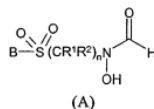
Usled velikog broja različitih svojstava CD23, jedinjenja koja inhibiraju formiranje s-CD23 bi trebalo da imaju dvostruku aktivnost: a) pojačavanje negativne povratne inhibicije sinteze IgE održavanjem nivoa i-CD23 na površini B ćelija i b) inhibiranje imunostimulativnih citokin aktivnosti rastvorljivih fragmenata s-CD23 više molekulske mase (Mr 37, 33 i 29 kDa). Dodatno, inhibicija odvajanja CD23 sa površine ćelija bi trebalo da umanj s-CD23 indukovanu aktivaciju monocita i formiranje medijatora usled čega bi se smanjio i inflamatorni odgovor.



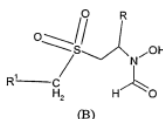
4. Стање технике

WO 99/06361 (Abbott) i WO 00/12478 (Zeneca Limited) opisuju veliki broj jedinjenja koja uključuju reverzna hidroksamat sulfonil i sulfonamid jedinjenja koja imaju aktivnost kao inhibitori metaloproteinaze.

WO 99/38843 (Darwin Discovery Limited) otkriva sledeća jedinjenja formule (A) korisna u lečenju, između ostalih, oboljenja posredovanih enzimima uključenim u otpuštanju CD23:

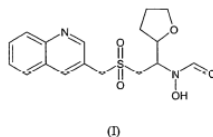


PCT EP01/05798 (SmithKline Beecham) otkriva jedinjenja formule (B) korisna u lečenju i profilaksi oboljenja posredovana enzimima uključenim u otpuštanju CD23:



5. Суштина проналаска

Predmetni pronalazak se odnosi na jedinjenja formule (I):



Jedinjenja formule (I) prema predmetnom pronalasku imaju upotrebu u lečenju bolesti kao što su alergija, alergijska astma, atopijski dermatitis i ostala atopijska oboljenja, inflamatornih poremećaja i autoimunih bolesti kod kojih se javlja povećana proizvodnja s-CD23.

Dalje, predmetni pronalazak se odnosi na farmaceutske kompozicije za lečenje bolesti kao što su alergija, alergijska astma, atopijski dermatitis i ostala atopijska oboljenja, inflamatornih poremećaja i autoimunih bolesti kod kojih se javlja povećana proizvodnja s-CD23 koji sadrži jedinjenje formule (I) i opcionalno prihvatljivi farmaceutski nosač. Inflamatorna oboljenja uključuju poremećaje CNS kao što su Alchajmerova bolest, multipla skleroza, multi-infarktna demencija, povrede glave.

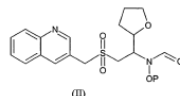
Pronalazači su došli do iznenađujućeg otkrića da je jedinjenje (I) veoma aktivno kao selektivni inhibitor proizvodnje CD23, sa smanjenom ili nikakvom aktivnošću kao inhibitor matričnih metaloproteaza.

Predmetni pronalazak takođe uključuje i prihvatljive farmaceutske soli, solvate i druge farmaceutski prihvatljive derivate jedinjenja formule (I). Soli jedinjenja formule (I) uključuju na primer kisele adicione soli izvedene iz neorganskih i organskih kiselina kao što su hidrohloridi, hidrobromidi, fosfati, sulfati, acetati, propanati, fumarati, citrati, maleati, malonati, sukcinati, laktati, oksalati, tartarati, benzoati.

Intellectual
Property Office of the
Republic of Serbia

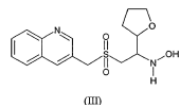
Predmetni pronalazak se takođe odnosi i na postupak dobijanja jedinjenja formule (I) koji se sastoji od:

a) skidanja zaštitne grupe sa jedinjenja formule (II):

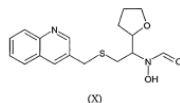


gde je P zaštitna grupa kao što je benzil, tetrahidropropanil ili p-metoksibenzil, ili

b) formilovanja jedinjenja formule (III):

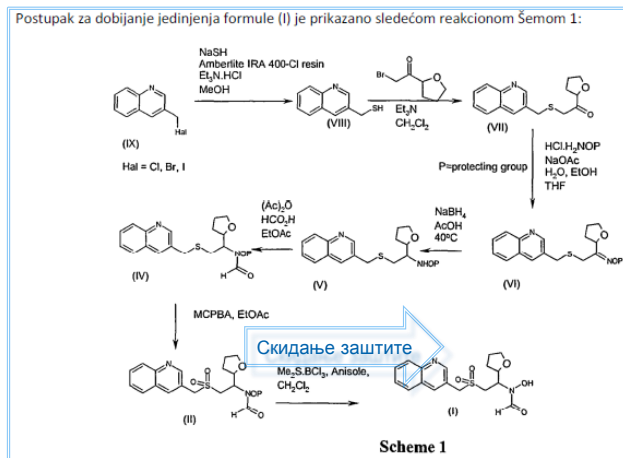


ili (c) oksidovanja jedinjenja formule (X):



The Intellectual
Property Office of the
Republic of Serbia

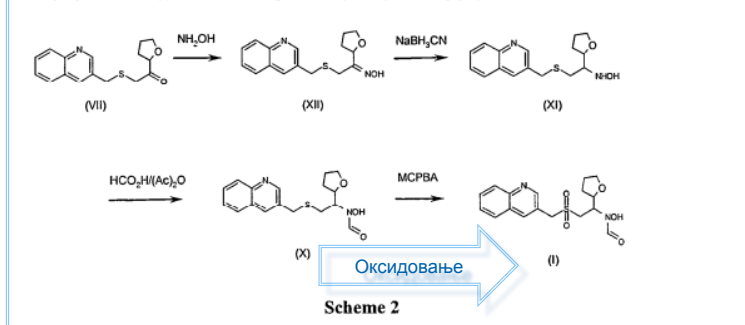
6a. Детаљан опис проналаска



* У тексту овог дела описа пријаве, реакциона Шема 1 је додатно објашњена уз навођење свих неопходних детаља поступка.



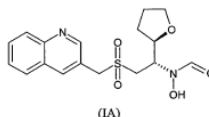
Jedinjenja formule (I) se takođe mogu dobiti postupkom koji je prikazan na Šemi 2:



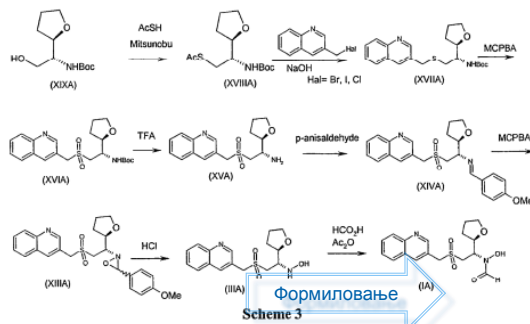
* У тексту овог дела описа пријаве, реакциона Шема 2 је додатно објашњена уз навођење свих неопходних детаља поступка.



Takođe, predmetni pronalazak se odnosi i na jedinjenje formule (IA):



Jedinjenje formule (I) se može dobiti u čistom hiralanom obliku postupkom koji je prikazan na Šemi 3:



The Intellectual Property Office of the Republic of Serbia

66. Детаљан опис проналаска

Jedinjenja koja imaju aktivnost kao inhibitori rastvorljivog humanog CD23 imaju značajnu primenu u medicini. Poželjno je da se aktivna supstanca primenjuje u obliku farmaceutske prihvatljive kompozicije. Poželjno je da farmaceutske kompozicije budu prilagođene za oralnu primenu. Međutim, one mogu biti prilagođene i za druge načine primene kao na primer u obliku spreja, aerosola ili drugog konvencionalnog postupka za inhalaciju za lečenje poremećaja respiratornog trakta; ili za parenteralnu primenu.

Farmaceutska kompozicija može biti u obliku tableta, kapsula, praška, granula, lozenga, supozitorija, ili tečnih preparata kao što su oralni ili sterilni rastvori ili suspenzije.

Kako bi se obezbedila konzistencija u primeni poželjno je da kompozicija prema predmetnom pronalasku bude u obliku jedinične doze.

* Даље се детаљно наводе фармацеутски облици (таблете, емулзије, сирупи, инјекције, аеросоли, раствори итд.) за композиције у чврстом, течном стању, за оралну, парентералну примену, за примену код обољења респираторног тракта и друго, затим њихов начин припреме, садржај активне супстанце и помоћних супстанци итд.

The Intellectual Property Office of the Republic of Serbia

8a. Примери поступака добијања у оквиру детаљног описа проналаска

Primer 1: (S)-N-[2-(3-hinolimmetansulfonil)-1-(R)-tetrahidrofuran-2-iletil]-N-hidroksiformamid

1. korak: 1-(3-hinolimmetansulfonil)-1-[(R)-tetrahidrofuran-2-il]-1-oksoetan - Rastvor 3-acetiltimetilhinolina (3.15g) u MeOH (50ml) je tretiran 1M rastvorom NaOH tokom 15 min nakon čega je dodan (R)-2-bromoacetiltetrahidrofuran (2.8g). Reakciona smeša je mešana na sobnoj temperaturi tokom noći. Smeša je uparena do manje zapremine, razblažena sa EtOAc (50ml), isprana sa zasićenim rastvorom natrijum hidrogen karbonata (30ml), vodom (2x30ml), rastvorom NaCl (30ml) i osušeno (MgSO₄). Ostatak je prečišćen brzom hromatografijom (silika gel, step gradient: 30-50% EtOAc/heksan) da bi se dobilo željeno jedinjenje (4.16g). MS APCI (+ jon) 288 (MH <+>); <1>H NMR δ(CDCI₃): 8.88 (1H, d, J=2Hz), 8.09(H, m), 7.76 (1H, d, J=8.3Hz), 7.70 (1H, t, J=8.3Hz), 7.54(1H, t, J=7Hz), 4.45 (1H, m), 4.20-3.60 (2H,m), 3.91 (2H, s), 3.30 (2H, s), 2.25-1.83 (4H,m).

...

6. korak: (S)- N-[2-(3- hinolimmetansulfonil)-1-(R)-tetrahidrofuran-2-iletil]- N-hidroksiformamid

N-[2-(3-hinolimmetansulfonil)-1-(R)-tetrahidrofuran-2-il]etilhidroksilamin (0.94g) je tretiran mravljom kiselinom (6ml) i acetalnim anhidridom (2ml) i ostavljen da miruje preko noći na sobnoj temperaturi. Reakciona smeša je uparena, ponovo rastvorena u metanolu i tretirana K₂CO₃ (1.9g). Nakon mešanja na sobnoj temperaturi tokom 30min smeša je uparena i ostatak je podeljen između MDC i vode a pH je podešen na 7 (2M HCl). MDC sloj je osušen (MgSO₄) i uparen da se dobije gruba smeša diastereomera koja je razdvojena na pojedinačne diastereomere pomoću hromatografije. (silika gel ispran kiselinom, step gradient: 0-3% MeOH u MDC.) Sporija komponenta je sakupljena i rekristalizovana kako bi se dobilo željeno jedinjenje (160mg). MS APCI (+ jon) 365 (MH <+>), <1>H NMR δ(DMSO-d₆) na 353K 9.756(1H,bs), 8.88 (1H, d,J=2Hz), 8.35 (1H, d,J=2Hz), 7.88-8.30 (3H, m), 7.78 (1H, t, J=7.2Hz), 7.66 (1H, t, J=7.2 Hz), 4.80-4.68 (2H, ABq,) 3.95(1H, m), 3.10-3.82 (3H, m),1.50-2.03 (4H, m).

Intellectual
Property Office of the
Republic of Serbia

8b. Примери биолошких тестова у оквиру детаљног описа проналаска

BIOLOŠKI TESTOVI

Procedura 1: Sposobnost testiranog jedinjenja da inhibira otpuštanje rastvorljivog CD23.

Rezultat

Jedinjenje iz Primera 1 je prema Proceduri 1 pokazalo vrednost IC₅₀ od 0.06uM.

Procedura 2: Sposobnost testiranog jedinjenja da inhibira matričnu metaloproteazu (MMP).

Rezultati

Jedinjenje iz Primera 1 je prema Proceduri 2 pokazalo vrednost IC₅₀ od 100uM.

Jedinjenje iz Primera 1 je prema Proceduri 2 pokazalo vrednost IC₅₀ od >100uM u odnosu MMP-3 i 6.0uM u odnosu na MMP-13.

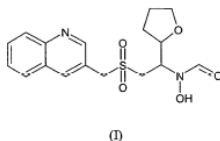
* Процедуре по којима су изведени биолошки тестови су детаљно објашњене у пријави. Овде се наводе само резултати.



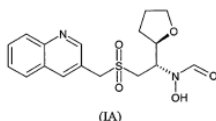
The Intellectual
Property Office of the
Republic of Serbia

9a. Патентни захтеви – производ и употреба

1. Jedinjenje formule (I):



2. Jedinjenje formule (IA):



Када се патентни захтев односи на једињење које је само по себи ново, није неопходно користити дводелну форму захтева.

3. Jedinjenje definisano prema bilo kom od prethodnih zahteva **za upotrebu** u lečenju oboljenja sa povećanom proizvodnjom s-CD23.

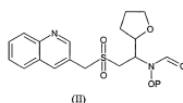
4. **Farmaceutska kompozicija** za lečenje oboljenja sa povećanom proizvodnjom s-CD23 koja sadrži jedinjenje definisano u 1. i 2. zahtevu i opciono farmaceutski prihvatljiv nosač.



9b. Патентни захтеви – поступак

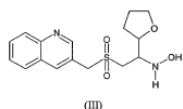
5. **Postupak** za dobijanje jedinjenja definisanih u 1. i 2. zahtevu koji se sastoji od:

a) skidanja zaštitne grupe sa jedinjenja formule (II):

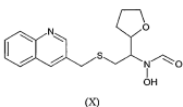


gde je P zaštitna grupa, ili

b) formilovanja jedinjenja formule (III):

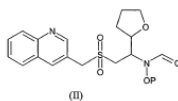


ili (c) oksidovanja jedinjenja formule (X):



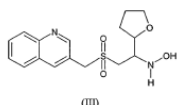
9в. Патентни захтеви – производ интермедијери

6. Jedinjenje formule (II):

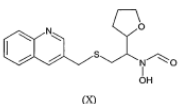


gde je P zaštitna grupa.

7. Jedinjenje formule (III):



8. Jedinjenje formule (X):



Овако дефинисани патентни захтеви испуњавају услов јединства проналаска!

The Intellectual Property Office of the Republic of Serbia



Завод за
интелектуалну својину
Републике Србије

Хвала на пажњи!

Завод за интелектуалну својину
Кнегиње Љубице 5
11000 Београд
www.zis.gov.rs

Ивана Крџић, патентни испитивач
ikrdzic@zis.gov.rs

27 октобар 2016