

# Vývoj léčiva

FarmChem 07

## Ochrana duševního vlastnictví

Patenty a patentování

Užitné vzory

Ochranné známky

## Vyhledávání patentových informací

Praktické ukázky hledání patentů na Internetu

## Zdroje informací o léčivech

# Patentová ochrana vynálezů

**Vlastník platného patentu má výlučné právo vynález využívat, poskytnout souhlas k jeho využívání nebo patentová práva převést na někoho jiného**

**Patent zajišťuje vlastníkovi po zákonem stanovenou dobu monopol na výrobek, výrobní postup nebo použití. Bez souhlasu (licence) majitele patentu nesmí nikdo patentovaný výrobek vyrábět, prodávat ani využívat nebo nesmí postupovat podle patentovaného postupu.**

**Vlastnická práva majitele patentu se vztahují pouze na země, v nichž byl patent udělen**

**Původce (vynálezce) nemusí být vlastníkem!**

**Podmínky udělení patentu a rozsah patentových práv jsou určeny zákony (v ČR zákon č. 527/1990 Sb., novela v souvislosti s novým zákonem o léčivech č. 378/2007 Sb.)**

# Sjednocení hlavních zásad patentové ochrany

členské země WTO - dohoda TRIPs

## Doba patentové ochrany

Standardní doba - 20 let od data priority

Specifikum léčiv - možnost prodloužení patentové ochrany  
dodatkovým ochranným osvědčením (SPC) o 5 let

Patentovat nelze vynálezy , jejichž využití by se  
příčilo veřejnému pořádku nebo dobrým mravům

### Co lze patentovat:

- výrobky
- výrobní procesy
- složení látky nebo přípravku
- použití látky nebo přípravku  
(v USA včetně použití v terapii  
a diagnostice)

### Co nelze patentovat (EU):

- objevy
- vědecké teorie
- matematické metody
- estetické výtvořy
- způsoby terapie a diagnostiky
- plány, pravidla a způsoby  
vykonávání duševní činnosti,  
her a obchodní činnosti
- počítačové programy a  
podávání informací

**Patent může být udělen na vynálezy, které jsou nové, jsou výsledkem vynálezecké činnosti a jsou průmyslově využitelné**

## **Novost**

**předmět vynálezu není součástí stavu techniky**

= nebyl před datem priority veřejně znám nebo nebyl předmětem jiné přihlášky vynálezu se starším datem priority

USA - First to invent, Evropa: First to file

**Vynálezecká činnost (vynálezecký krok, nezřejmost, inventivnost)**

**předmět vynálezu nesmí pro odborníka vyplynout**

**zřejmým způsobem z dosavadního stavu techniky**

**Průmyslová využitelnost**

**předmět vynálezu může být opakovaně vyráběn nebo jinak využíván v průmyslu, zemědělství nebo jiných oblastech hospodářství**

# Patenty mohou být na vynálezy uděleny na základě přihlášky vynálezu

- Podáním přihlášky vzniká právo přednosti - priorita
- Přihláška musí obsahovat předepsané údaje předtištěný formulář
- Přihláška se může týkat pouze jednoho vynálezu nebo skupiny vynálezů, které spojuje jednotící technický vztah
- Přihláška má mít předepsanou strukturu a má vynález objasnit jasně a úplně, aby jej mohl odborník uskutečnit
  - Nadpis
  - Oblast techniky
  - Dosavadní stav techniky
  - Podstata vynálezu (stručný popis, podrobný popis)
  - (Popis obrázků)
  - Příklady provedení
  - Patentové nároky
  - Abstrakt
  - Rešeršní údaje
- Přijetí přihlášky je podmíněno úhradou správních poplatků

# Patentové řízení

- **Předběžný průzkum**
- **Úplný průzkum**  
na žádost přihlašovatele, po zaplacení poplatku  
posouzení novosti, inventivnosti a využitelnosti předmětu vynálezu  
změny nároků, popř. i popisu, posouzení změn
- **Udělení patentu**  
zveřejnění, námitky třetích stran  
udržovací poplatky
- **Zrušení patentu**  
pouze soudní cestou

## Mezinárodní přihlášky

### Světová patentová přihláška PCT (WIPO)

více než 100 zemí světa

do 1 roku po podání první národní přihlášky

mezinárodní fáze

národní fáze v designovaných zemích, národní patenty

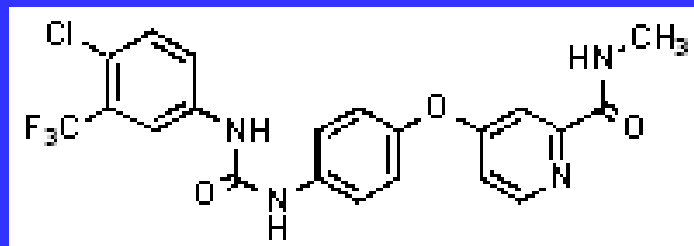
### Evropská patentová přihláška (EPO)

členské země Evropské patentové konvence

evropský patent

# Sorafenib – WO/2000/062763

## první nárok z 67 nároků patentové přihlášky



### 1. A compound of Formula I:

**A - D - B**

(I)

or a pharmaceutically acceptable salt thereof, wherein

**D** is -NH-C(O)-NH-,

**A** is a substituted moiety of up to 40 carbon atoms of the formula: -L-(M-L<sup>1</sup>)<sub>q</sub>,

where **L** is a 5 or 6 membered cyclic structure bound directly to D, **L<sup>1</sup>** comprises a substituted cyclic moiety having at least 5 members, **M** is a bridging group having at least one atom, **q** is an integer of from 1-3; and each cyclic structure of **L** and **L<sup>1</sup>** contains 0-4 (0+1) members of the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur, and

**B** is a substituted or unsubstituted, up to tricyclic aryl or heteroaryl moiety of up to 30 carbon atoms with at least one 6-member cyclic structure bound directly to D containing 0-4 members of the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur,

wherein **L<sup>1</sup>** is substituted by at least one substituent selected from the group consisting of -SO<sub>2</sub>R<sub>x</sub>, -C(O)R<sub>x</sub> and -C(NR<sub>y</sub>)R<sub>z</sub>,

R<sub>y</sub> is hydrogen or a carbon based moiety of up to 24 carbon atoms optionally containing heteroatoms selected from N, S and O and optionally halosubstituted, up to per halo,

R<sub>z</sub> is hydrogen or a carbon based moiety of up to 30 carbon atoms optionally containing heteroatoms selected from N, S and O and optionally substituted by halogen, hydroxy and carbon based substituents of up to 24 carbon atoms, which optionally contain heteroatoms selected from N, S and O and are optionally substituted by halogen;

R<sub>x</sub> is R<sub>z</sub> or NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>, where R<sub>a</sub> and R<sub>b</sub> are

a) independently hydrogen,

a carbon based moiety of up to 30 carbon atoms optionally containing heteroatoms selected from N, S and O and optionally substituted by halogen, hydroxy and carbon based substituents of up to 24 carbon atoms, which optionally contain heteroatoms selected from N, S and O and are optionally substituted by halogen, or -OSi(R<sup>f</sup>)<sub>3</sub> where R<sup>f</sup> is hydrogen or a carbon based moiety of up to 24 carbon atoms optionally containing heteroatoms selected from N, S and O and optionally substituted by halogen, hydroxy and carbon based substituents of up to 24 carbon atoms, which optionally contain heteroatoms selected from N, S and O and are optionally substituted by halogen; or

b) R<sub>a</sub> and R<sub>b</sub> together form a 5-7 member heterocyclic structure of 1-3 heteroatoms selected from N, S and O, or a substituted 5-7 member heterocyclic structure of 1-3 heteroatoms selected from N, S and O substituted by halogen, hydroxy or carbon based substituents of up to 24 carbon atoms, which optionally contain heteroatoms selected from N, S and O and are optionally substituted by halogen; or

c) one of R<sub>a</sub> or R<sub>b</sub> is -C(O)-, a C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> divalent alkylene group or a substituted C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> divalent alkylene group bound to the moiety L to form a cyclic structure with at least 5 members, wherein the substituents of the substituted C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> divalent alkylene group are selected from the group consisting of halogen, hydroxy, and carbon based substituents of up to 24 carbon atoms, which optionally contain heteroatoms selected from N, S and O and are optionally substituted by halogen;

where B is substituted, L is substituted or L<sup>1</sup> is additionally substituted, the substituents are selected from the group consisting of halogen, up to per-halo, and W<sub>n</sub>, where n is 0-3;

wherein each W is independently selected from the group consisting of -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>7</sup>, -C(O)-R<sup>7</sup>, -NO<sub>2</sub>, -OR<sup>7</sup>, -SR<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>R<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>C(O)OR<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>C(O)R<sup>7</sup>, -Q-Ar, and carbon based moieties of up to 24 carbon atoms, optionally containing heteroatoms selected from N, S and O and optionally substituted by one or more substituents independently selected from the group consisting of -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>7</sup>, -C(O)-R<sup>7</sup>, -NO<sub>2</sub>, -OR<sup>7</sup>, -SR<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>R<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>C(O)OR<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>C(O)R<sup>7</sup>, and halogen up to per-halo; with each R<sup>7</sup> independently selected from H or a carbon based moiety of up to 24 carbon atoms, optionally containing heteroatoms selected from N, S and O and optionally substituted by halogen,

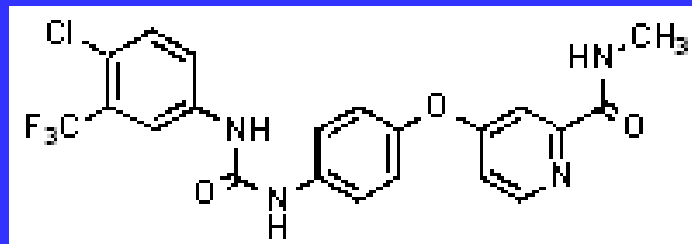
wherein Q is -O-, -S-, -N(R<sup>7</sup>)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, -C(O)-, -CH(OH)-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>O-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>S-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>N(R<sup>7</sup>)-, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-CHX<sup>a</sup>-, -CX<sup>a</sup><sub>2</sub>-, -S-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>- and -N(R<sup>7</sup>)(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-, where m= 1-3, and X<sup>a</sup> is halogen; and

Ar is a 5- or 6-member aromatic structure containing 0-2 members selected from the group consisting of nitrogen, oxygen and sulfur, which is optionally substituted by halogen, up to per-halo, and optionally substituted by Z<sub>n1</sub>, wherein n1 is 0 to 3 and each Z is independently selected from the group consisting of -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -C(O)R<sup>7</sup>, -C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>7</sup>, -NO<sub>2</sub>, -OR<sup>7</sup>, -SR<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>R<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>C(O)OR<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>C(O)R<sup>7</sup>, and a carbon based moiety of up to 24 carbon atoms, optionally containing heteroatoms selected from N, S and O and optionally substituted by one or more substituents selected from the group consisting of -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -C(O)NR<sup>7</sup>R<sup>7</sup>, -C(O)-R<sup>7</sup>, -NO<sub>2</sub>, -OR<sup>7</sup>, -SR<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>R<sup>7</sup>, -NR<sup>7</sup>C(O)OR<sup>7</sup>, and -NR<sup>7</sup>C(O)R<sup>7</sup>, with R<sup>7</sup> as defined above.

# Sorafenib

vydaný evropský patent EP 1140840 B1

definitivní text prvního z 18 nároků



1. A compound selected from the group consisting of

the 4-chloro-(trifluoromethyl)phenyl ureas:

N-(4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(3-(2-carbamoyl-4-pyridyloxy)phenyl) urea,  
N-(4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(3-(2-(N-methylcarbamoyl)-4-pyridyloxy)phenyl) urea,  
N-(4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(4-(2-carbamoyl-4-pyridyloxy)phenyl) urea and  
**N-(4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(4-(2-(N-methylcarbamoyl)-4-pyridyloxy)phenyl) urea.**

the 4-bromo-3-(trifluoromethyl)phenyl ureas:

N-(4-bromo-3-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(3-(2-(N-methylcarbamoyl)-4-pyridyloxy)phenyl) urea,  
N-(4-bromo-3-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(4-(2-(N-methylcarbamoyl)-4-pyridyloxy)phenyl) urea,  
N-(4-bromo-3-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(3-(2-(N-methylcarbamoyl)-4-pyridylthio)phenyl) urea,  
N-(4-bromo-3-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(2-chloro-4-(2-(N-methylcarbamoyl)(4-pyridyloxy))phenyl) urea and  
N-(4-bromo-3-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(3-chloro-4-(2-(N-methylcarbamoyl)(4-pyridyloxy))phenyl) urea.

the 2-methoxy-4-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl ureas:

N-(2-methoxy-4-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(4-(2-(N-methylcarbamoyl)-4-pyridyloxy)phenyl) urea,  
N-(2-methoxy-4-chloro-5-(trifluoromethyl)phenyl)-N'-(2-chloro-4-(2-(N-methylcarbamoyl)(4-pyridyloxy))phenyl) urea

or a pharmaceutically acceptable salt thereof



# Užitný vzor („malý“ patent)

podmínky ochrany stanovuje zákon č. 478/1992 Sb.

- řešení problému, které je nové
- přesahuje rámec pouhé odborné dovednosti
- je průmyslově využitelné

**Ale:**

- nesplňuje podmínky pro udělení patentu

**Není totéž jako průmyslový vzor**

- průmyslový vzor je charakterizován specifickým vzhledem
- může být rovněž chráněn

## Ochranná známka

umožňuje odlišit stejné druhy výrobku podle původu

- název (např. specifický firemní název léčiva)
- grafický znak
- kombinace názvu a grafického znaku

# Vyhledávání patentových informací

vyhledávání podle čísla patentu/patentové přihláška, autora, vlastníka patentu (firmy), předmětu, patentové třídy

- **ČR**

databáze českých patentů, užitných vzorů a ochranných známek  
server Úřadu průmyslového vlastnictví: [www.upv.cz](http://www.upv.cz)

- **Evropský patentový úřad - EPO**

databáze evropských i světových patentů - nejrozsáhlejší patentová databáze  
server EPO esp@cenet: [ep.espacenet.com](http://ep.espacenet.com)  
EPOLINE (průběh a stav řízení): [my.epoline.org](http://my.epoline.org)

- **Světová organizace pro duševní vlastnictví - WIPO**

databáze světových patentových přihlášek PCT  
server WIPO: [www.wipo.int/ipdl/en](http://www.wipo.int/ipdl/en)

- **Úřad pro patenty a ochranné známky Spojených států**

databáze amerických patentů a patentových přihlášek  
server USPTO: [www.uspto.gov](http://www.uspto.gov)

# Patentové třídy

## System mezinárodního třídění (IPC)

70 tisíc tříd a podtříd

## Evropský systém (ECLA)

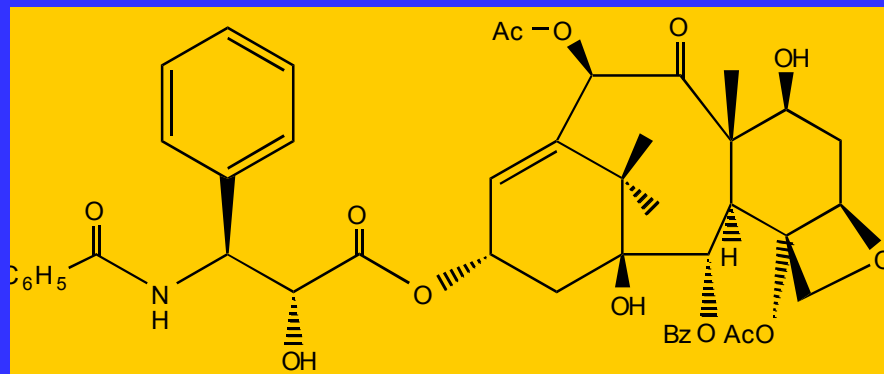
vychází z IPC

je podrobnější (130 tisíc tříd a podtříd)

**Třída A: lidské potřeby (včetně léčiv)**

**C: chemie a metalurgie**

**Paklitaxel:**



A61K31/33 - léčivé přípravky obsahující organické účinné látky - heterocyklické sloučeniny se čtyřčlenným kruhem

C07D305 - Heterocyklické sloučeniny s oxetanovým kruhem

# Vybrané zdroje informací o léčivech

## Léčiva registrovaná v ČR - databáze AISLP

přístup např. přes server Zdravotnických novin: [www.zdn.cz](http://www.zdn.cz)

**Zahraniční léčiva - databáze Rx List:** [www.rxlist.com](http://www.rxlist.com)

- **databáze Micromedex:** [www.micromedex.com](http://www.micromedex.com)

## Schválená a zkoušená léčiva, předpisy, dokumenty

ČR - SÚKL: [www.leky.sukl.cz](http://www.leky.sukl.cz), [www.sukl.cz](http://www.sukl.cz)

EU - EMEA: [www.emea.eu.int](http://www.emea.eu.int)

USA - FDA: [www.fda.gov](http://www.fda.gov)

## Abstrakta prací z lékařských časopisů - databáze MEDLINE:

přístup přes server Národní lékařské knihovny USA: [www.ncbi.nlm.nih.gov](http://www.ncbi.nlm.nih.gov)

přes portál Medscape: [www.medscape.com](http://www.medscape.com)


## Encyklopedické příručky (v papírové formě i jako CD-ROM):

Merck Index, 14. vydání (základní informace o substancích i různých chemikáliích)

A. Kleeman, J. Engel, Pharmaceutical Substances, 5. vydání, Georg Thieme Verlag, Frakfurt, New York, 2009 (1800 stran se schematicy hlavních postupů syntézy substancí s odkazy na patenty a další podklady, pravidelná aktualizace, pro předplatitele online přístup k aktualizacím)

Martindale. The Complete Drug Reference, 35. vydání, Pharmaceutical Press, London, 2006 – pravidelně aktualizované informace o hlavních a vedlejších účincích 5.500 léčivých látek obsažených ve 128 tis. přípravků vyráběných v 36 zemích s 40.700 citacemi (v papírové formě, na CD-ROM i online)

# ÚPV: <http://www.upv.cz/cs.html>



Úřad průmyslového vlastnictví

Cesky English

EU2009.CZ

ÚPV | Průmyslová práva | Služby úřadu | Právní předpisy | Informační zdroje | Publikace | Eurorubrika

### Vynálezy/Patenty

- Vynález a jeho ochrana
- Elektronické podávání a formuláře
- Poplatky

### Ochranné známky

- Ochranná známka a její ochrana
- Elektronické podávání a formuláře
- Poplatky

### Užitné vzory

- Užitný vzor a jeho ochrana
- Elektronické podávání a formuláře
- Poplatky

### Průmyslové vzory

- Průmyslový vzor a jeho ochrana
- Elektronické podávání a formuláře
- Poplatky

### Označení původu / Zeměpisná označení

- Označení původu a jeho ochrana
- Elektronické podávání a formuláře
- Poplatky

### Online databáze

- Databáze ÚPV
- EPO
- WIPO
- OHIM
- Systemy třídění

### Úřední deska

Aktuální informace pro veřejnost.

### Eurorubrika

Ochrana průmyslového vlastnictví v EU

### Mezinárodní konference

## Ochrana práv z duševního vlastnictví

21. - 22. května 2009

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION | Úřad průmyslového vlastnictví | EU | diplomati HOTEL \*\*\*\*\* PRAGUE

1 2 3 4

### Aktuality

09.04.2009  
Oznámení o nabídce na pracovní pozici v Evropském patentovém úřadě

27.03.2009 ÚPV | Praha  
Seminář: Ochrana průmyslového vlastnictví v Číně a čínské výrobky v ČR

30.03.2009 ÚPV | Praha  
Seminář: Řízení o mezinárodních přihláškách dle PCT - aktuální stav

24.03.2009 ÚPV | Praha  
Konference o vývoji v oblasti evropského patentu a patentu Společenství

23.03.2009 ÚPV | Praha  
Zapojte se do projektu IPDiagnosis

23.03.2009 ÚPV | Praha  
Evropský vynálezce roku: seznam nominací

### Kontakt

Úřad průmyslového vlastnictví  
Antonína Čermáka 2a  
160 68 Praha 6 - Bubeneč  
Tel/Fax: 220 383 111 / 224 324 718  
E-mail: [posta@upv.cz](mailto:posta@upv.cz)

**Helpdesk:**  
E-mail: [helpdesk@upv.cz](mailto:helpdesk@upv.cz)  
Nejčastější dotazy (FAQ)

ÚPV | Průmyslová práva | Služby úřadu | Právní předpisy | Informační zdroje | Publikace | Eurorubrika

Služby úřadu > Databáze On-Line

## Databáze On-Line

Úřad průmyslového vlastnictví vytvořil v rámci své internetové prezentace odkazy na národní a zahraniční databáze průmyslově právních informací, v nichž je možné bezplatně provádět informativní rešerše.

### Národní databáze:

- ➔ [Databáze patentů a užitných vzorů](#)

Tato databáze obsahuje přihlášky vynálezů zveřejněné od roku 1991, udělené patenty od č. 228531, evropské patenty platné na území ČR a zapsané užitné vzory.

- ➔ [Databáze průmyslových vzorů](#)

Tato databáze obsahuje pouze české zapsané průmyslové vzory, a to v rozsahu bibliografie a vyobrazení od č. zápisu 3500.

- ➔ [Databáze ochranných známek platných v České republice \(ÚPV, WIPO, OHIM\)](#)

Tato databáze obsahuje ochranné známky přihlášené v ÚPV, WIPO (s designací pro ČR a EU) a OHIM. Zejména data získávaná ze zahraničí mohou vykazovat jisté nepřesnosti, na jejichž odstraňování se průběžně pracuje.

- ➔ [Databáze označení původu a zeměpisných označení \(ÚPV, WIPO\)](#)

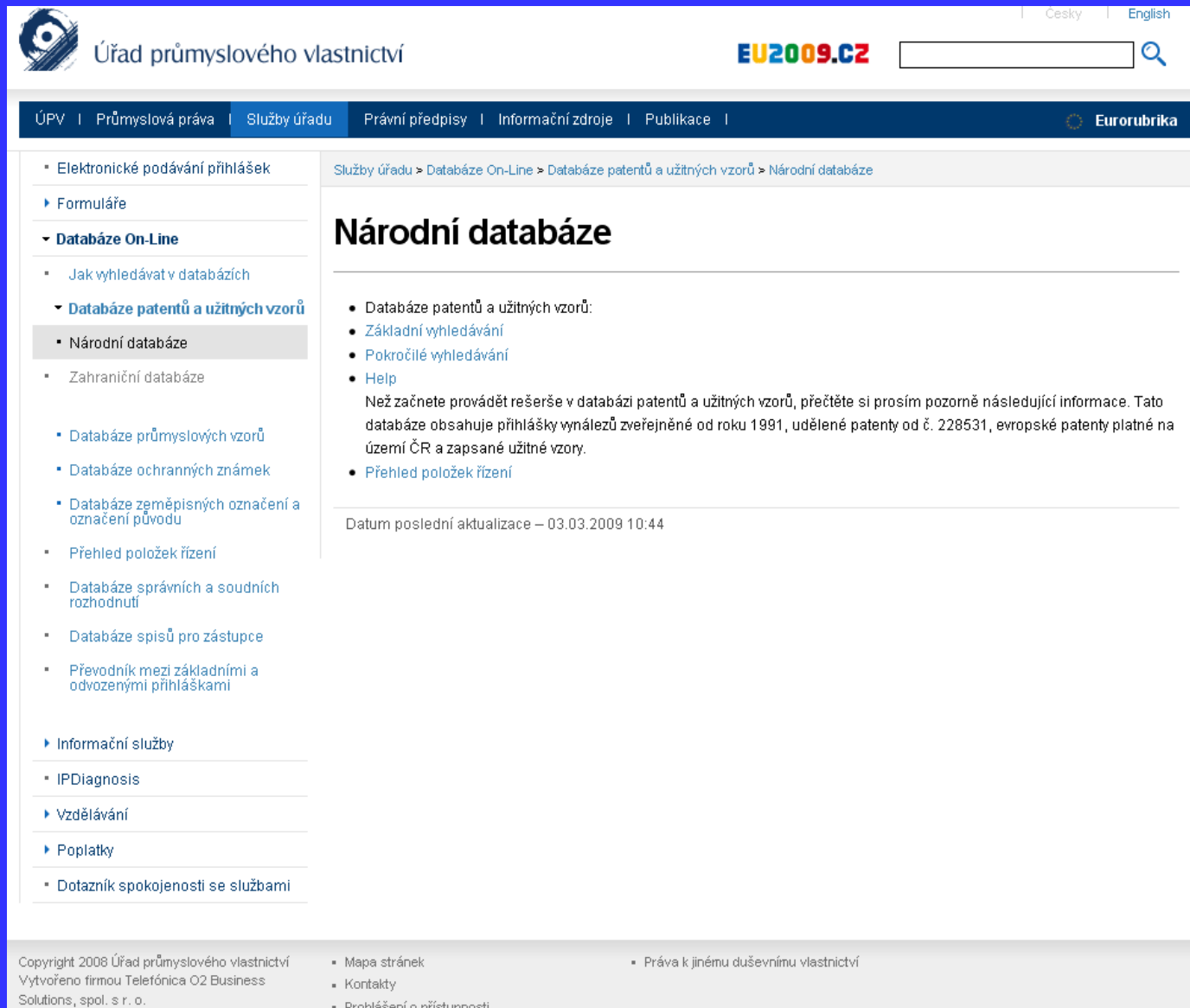
### Zahraníční databáze:

Odkazy na zahraniční databáze najdete v detailnějším přehledu databází k jednotlivým průmyslovým právům.

Datum poslední aktualizace – 31.03.2009 15:29

- Elektronické podávání přihlášek
- Formuláře
- Databáze On-Line**
  - Jak vyhledávat v databázích
    - Databáze patentů a užitných vzorů
    - Databáze průmyslových vzorů
    - Databáze ochranných známek
    - Databáze zeměpisných označení a označení původu
  - Přehled položek řízení
  - Databáze správních a soudních rozhodnutí
  - Databáze spisů pro zástupce
  - Převodník mezi základními a odvozenými přihláškami
- Informační služby
  - IPDiagnosis
  - Vzdělávání
  - Poplatky
- Dotazník spokojenosti se službami

<http://www.upv.cz/cs/sluzby-uradu/databaze-on-line/databaze-patentu-a-uzitnych-vzoru/narodni-databaze.html>



The screenshot shows the website of the Czech Industrial Property Office (Úřad průmyslového vlastnictví). The page is titled "Národní databáze" (National Database) and is part of the "Databáze patentů a užitných vzorů" (Patent and Utility Model Database) section. The page includes a navigation menu, a search bar, and a list of database services. The main content area contains a list of search options and a brief description of the database's scope.

Úřad průmyslového vlastnictví

Cesky English

EU2009.CZ

ÚPV | Průmyslová práva | Služby úřadu | Právní předpisy | Informační zdroje | Publikace | Eurorubrika

Služby úřadu > Databáze On-Line > Databáze patentů a užitných vzorů > Národní databáze

## Národní databáze

- Databáze patentů a užitných vzorů:
  - Základní vyhledávání
  - Pokročilé vyhledávání
  - Help

Než začnete provádět rešerše v databázi patentů a užitných vzorů, přečtěte si prosím pozorně následující informace. Tato databáze obsahuje přihlášky vynálezů zveřejněné od roku 1991, udělené patenty od č. 228531, evropské patenty platné na území ČR a zapsané užitné vzory.

- Přehled položek řízení

Datum poslední aktualizace – 03.03.2009 10:44

Copyright 2008 Úřad průmyslového vlastnictví  
Vytvořeno firmou Telefónica O2 Business Solutions, spol. s r. o.

- Mapa stránek
- Kontakty
- Prohlášení o přístupnosti
- Práva k jinému duševnímu vlastnictví

## Rešeršní databáze patentů a užitných vzorů

Úřad průmyslového vlastnictví

Data jsou aktuální ke dni: 09.04.2009 20:07

Databáze obsahuje české přihlášky vynálezů zveřejněné od roku 1991, patenty od č. 10, evropské patenty platné na území ČR a zapsané užitné vzory.

Titulní strany národních patentů můžete podle jejich čísla vyhledávat [zde](#)

Naskenované dokumenty podle jejich čísla nebo čísla přihlášky neleznete [zde](#).

### Zadejte podmínky pro výběr

(21) Číslo přihlášky	<input type="text"/>	např. 1988-535
(11) Číslo zápisu	= <input type="text"/>	např. 277680
(54) Název	<input type="checkbox"/> <sup>*)</sup> <input type="text"/>	např. %ventil%
(71/73) Přihlašovatel/Majitel	<input type="checkbox"/> <sup>*)</sup> <input type="text"/>	např. Škoda
(72/75) Původce	<input type="checkbox"/> <sup>*)</sup> <input type="text" value="%Dobrovolný%"/>	např. %Novák%
(22) Datum podání přihlášky	= <input type="text"/>	např.: 16.10.1966
(32) Datum práva přednosti	= <input type="text"/>	např. 12.4.1995
(40) Datum zveřejnění vynálezu	= <input type="text"/>	např. 04/1995
(47) Datum zápisu/publikace patentu	= <input type="text"/>	např. 12/1997
(51) MPT	<input type="text"/>	např. B 60 N 2 / 42
(57) Anotace	<input type="checkbox"/> <sup>*)</sup> <input type="text"/>	<sup>#)</sup> např. %ventil%

Hledej

Vyčisti

English

<sup>\*)</sup> Při zaškrtnutí prohledává data bez ohledu na diakritiku.

<sup>#)</sup> Spisy EP nelze hledat pomocí slov obsažených v anotaci.

Pozn: Pokud má výsledek dotazu obsahovat hledaný výraz slovním textem jen v podobě, ve které byl zadán a nikoliv jako kombinaci všech možností bez ohledu na pozici jednotlivých slov v textu, uzavřete hledaný výraz do uvozovek - např.:

Přihlašovatel/Majitel = "Josef Novák"



# Rešeršní databáze patentů a užitných vzorů

## Úřad průmyslového vlastnictví























Data jsou aktuální ke dni: 09.04.2009 20:07

Databáze obsahuje české přihlášky vynálezů zveřejněné od roku 1991, patenty od č. 10, evropské patenty platné na území ČR a zapsané užitné vzory.

Titulní strany národních patentů můžete podle jejich čísla vyhledávat [zde](#)

Naskenované dokumenty podle jejich čísla nebo čísla přihlášky neleznete [zde](#).

Podmínky dotazu (72/75)-%Dobrovolný%  
Zadaným podmínkám vyhovuje 83 záznamů.  
Zobrazeny záznamy 1 až 50

Číslo přihlášky	Číslo ochranného dokumentu	Název	
<a href="#">P 1955-1332</a>	86489	Zařízení k měření rotačních součástí	
<a href="#">P 1956-2629</a>	90414	Přístroj na měření rovnoběžnosti zubů ozubených kol	
<a href="#">P 1960-4355</a>	100328	Zdroj stabilizovaného a nastavitelného stejnosměrného napětí	
<a href="#">P 1960-4881</a>	104334	Forma pro výrobu filtračních článků	
<a href="#">P 1960-5251</a>	107194	Způsob výroby nasávaných celulosových článků	
<a href="#">P 1964-1411</a>	119833	Zariadenie na odsemeňovanie uhoriek	
<a href="#">P 1965-1418</a>	122046	Absorpční těleso pro absorbování vysokofrekvenční energie	
<a href="#">P 1965-2093</a>	120010	Způsob přípravy spřádatelného viskózního roztoku	
<a href="#">P 1966-6964</a>	126176	Způsob přípravy rozpustných barviv	
<a href="#">P 1967-3387</a>	130411	Zapojení pro stabilizaci rezonančního kmitočtu	
<a href="#">P 1967-5266</a>	132038	Zařízení pro současné sdružování vysokofrekvenčních výkonů	
<a href="#">P 1967-8092</a>	138940	Způsob výroby nerozpustných solí azobarviv	
<a href="#">P 1968-1734</a>	134179	Filtr k potlačení harmonických frekvencí pro radiotechnická zařízení	
<a href="#">P 1968-5547</a>	139979	Vysokofrekvenční zatěžovací odpor s vnitřním vodivým a vnějším ztrátovým vodičem	
<a href="#">P 1969-3851</a>	145241	Způsob výroby pigmentových azobarviv	
<a href="#">P 1969-6331</a>	145575	Způsob přípravy lakovaných monoazobarviv	
<a href="#">P 1970-3134</a>	147169	Způsob úpravy červených azopigmentů-laků	
<a href="#">P 1971-1001</a>	159378	Logická síť pro automatické ovládání zařízení pro pneumatickou dopravu a odběr okamžitého nebo průměrného vzorku práškových a zrnitých materiálů	
<a href="#">P 1972-4342</a>	155039	Způsob přípravy lakovaných monoazobarviv	
<a href="#">P 1972-4923</a>	156941	Způsob přípravy 2-tosylamino-4-chlor-5-nitrotoluenu	
<a href="#">P 1972-5113</a>	155791	Způsob přípravy monoazopigmentů se selektivně lakovanými solubilizačními skupinami	
<a href="#">P 1972-5159</a>	161336	Způsob přípravy nerozpustných monoazobarviv	

P	<a href="#">1987-8828</a>	263750	Elektrohydraulické řídicí zařízení hydrogenerátoru	
P	<a href="#">1987-10165</a>	269949	Zapojení pro automatické řízení ústrojí pro odběr vzorků	
P	<a href="#">1988-1258</a>	266083	Způsob přípravy dikarboxydisazobarviv	
P	<a href="#">1988-2681</a>	268149	Šroubový mechanismus stavění	
P	<a href="#">1988-3302</a>	271124	Ochrana ložiskových prostorů	
P	<a href="#">1988-3508</a>	266632	Způsob zpracování amorfní formy disazopigmentů	
P	<a href="#">1988-8223</a>	275283	Systém automatického ovládání odběrového a dopravního zařízení	
P	<a href="#">1989-2496</a>		Mechanismus mikrometrického měřidla	
P	<a href="#">1989-6620</a>	274531	Způsob přípravy červených azopigmentů-laků	
P	<a href="#">1990-3965</a>		Způsob neutralizace reakčního chlorovodíku	
P	<a href="#">1990-4589</a>	279847	Způsob přípravy azokondenzačních pigmentů	
P	<a href="#">1993-525</a>		Zařízení na výrobu zpevňovačů do betonu	
UV	<a href="#">1993-572</a>	410	Zařízení na výrobu zpevňovačů do betonu	
UV	<a href="#">1993-1551</a>	2101	Rychloupínací náboj jízdního kola	
P	<a href="#">1994-160</a>	285926	Způsob přípravy žlutého disazopigmentu	
P	<a href="#">1994-161</a>		Způsob přípravy žlutého azokondenzačního pigmentu	
UV	<a href="#">1994-2366</a>	2278	Zařízení k čištění a broušení zpevněných ploch, zejména komunikací	
UV	<a href="#">1995-3421</a>	3165	Potrubní průchodka	
UV	<a href="#">1997-6187</a>	5780	Hydraulická ochrana proti odcizení vozidla	
P	<a href="#">2000-1848</a>	288713	Způsob přípravy isoindolinových pigmentů	
P	<a href="#">2003-2304</a>	298934	Způsob výroby 7-ethyl-10-hydroxykamptothecinu	
P	<a href="#">2003-2305</a>	299329	Způsob výroby 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]karbonyloxykamptothecinu	
P	<a href="#">2003-3442</a>	299593	Způsob výroby 7-ethyl-10-hydroxykamptothecinu	
P	<a href="#">2004-1259</a>		Motorová nástavba na cyklistické kolo	
UV	<a href="#">2004-16153</a>	15139	Motorová nástavba na jízdní kolo	
UV	<a href="#">2006-17471</a>	16471	Distanční rámeček pro izolační dvojskla	
UV	<a href="#">2006-17472</a>	16472	Izolační dvojsklo s tepelnou fólií	
UV	<a href="#">2007-18903</a>	17694	Izolační dvojsklo	

<<

[Nový dotaz](#)

Vyvinul [DELTA Systems a.s.](#)



# Rešeršní databáze patentů a užitných vzorů

Úřad průmyslového vlastnictví

Data jsou aktuální ke dni: 09.04.2009 20:07

Databáze obsahuje české přihlášky vynálezů zveřejněné od roku 1991, patenty od č. 10, evropské patenty platné na území ČR a zapsané užitné vzory.

Titulní strany národních patentů můžete podle jejich čísla vyhledávat [zde](#)

Naskenované dokumenty podle jejich čísla nebo čísla přihlášky neleznete [zde](#).

<i>(21) Číslo přihlášky:</i>	<b>2003-2305</b>
<i>(11) Číslo ochranného dokumentu:</i>	<b>299329</b>
<i>(22) Datum podání přihlášky:</i>	26.08.2003
<i>(54) Název:</i>	<b>Způsob výroby 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]karbonyloxykamptothecinu</b>
<i>(71/73) Přihlašovatel/Majitel:</i>	PLIVA-LACHEMA A.S., Brno, CZ
<i>(74) Zástupce:</i>	Ing. Jan Kubát, Přístavní 24, Praha 7, 17000
<i>(51) MPT:</i>	C 07 D 491/22, C 07 D 471/04, C 07 D 401/04, C 07 D 211/06, C 07 D 295/16, A 61 K 31/4453, A 61 K 31/47, A 61 K 31/4738, A 61 P 35/00, A 61 P 35/04
<i>(40) Datum zveřejnění:</i>	13.04.2005
<i>(47) Datum publikace patentu:</i>	18.06.2008
<i>Stav:</i>	Platný dokument
<i>(57) Anotace:</i>	Způsob výroby 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]-karbonyloxykamptothecinu kodenzací 7-ethyl-10-hydroxykamptothecinu s 1-chlorkarbonyl-4-piperidinopiperidin-hydrochloridem v polárním aprotickém rozpouštědle v přítomnosti 4-dimethylaminopyridinu.

[Přehled položek řízení](#) - [Naskenovaný dokument](#)

## UPOZORNĚNÍ

Tento výpis má pouze informativní charakter a údaje pro jeho vytvoření byly získány na síti Internet.

Domníváte-li se, že obsahuje chyby, obraťte se prosím na Úřad průmyslového vlastnictví.

Údaje byly získány na <http://www.upv.cz> dne 9.4.2009 20:44

[Nápověda při problémech tisku češtiny](#)

# PATENTOVÝ SPIS

(19)  
ČESKÁ  
REPUBLIKA



ÚŘAD  
PRŮMYSL OVĚHO  
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **2003-2305**  
(22) Přihlášeno: **26.08.2003**  
(40) Zveřejněno: **13.04.2005**  
(Věstník č. 4/2005)  
(47) Uděleno: **09.05.2008**  
(24) Ozámení v udělení ve Věstníku: **18.06.2008**  
(Věstník č. 25/2008)

(11) Číslo dokumentu:

## 299 329

(13) Druh dokumentu: **B6**

(51) Int. Cl.:

*C07D 491/22* (2006.01)  
*C07D 471/04* (2006.01)  
*C07D 401/04* (2006.01)  
*C07D 211/06* (2006.01)  
*C07D 295/16* (2006.01)  
*A61K 31/4453* (2006.01)  
*A61K 31/47* (2006.01)  
*A61K 31/4738* (2006.01)  
*A61P 35/00* (2006.01)  
*A61P 35/04* (2006.01)

(56) Relevantní dokumenty:

US 4 604 463; JP 61 050 985; CZ 2002-2250.

(73) Majitel patenu:

PLIVA-LACHEMA A.S., Brno, CZ

(72) Původce:

Dobrovolný Petr Ing., Brno, CZ

(74) Zástupce:

Ing. Jan Kubát, Přístavní 24, Praha 7, 17000

(54) Název vynálezu:

**Způsob výroby 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]karbonyloxykamptothecinu**

(57) Anotace:

Způsob výroby 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]-karbonyloxykamptothecinu kodenzací 7-ethyl-10-hydroxykamptothecinu s 1-chlorokarbonyl-4-piperidinopiperidin-hydrochloridem v polárním aprotickém rozpouštědle v přítomnosti 4-dimethylaminopyridinu.

**CZ 299329 B6**

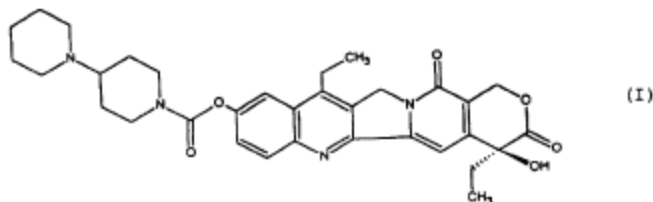
## Příklady provedení vynálezu

## Příklad 1

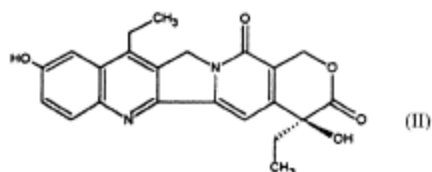
Do kádinky umístěné v ultrazvukové lázni se předloží 10 g (0,0247 mol) 7-ethyl-10-hydroxykamptothecinu a 99 ml acetonitrilu. Suspenze se míchá v ultrazvukové lázni dokud není zhomogenizována. Potom se suspenze kvantitativně převede do tříhrdlé Kellerovy baňky opatřené mechanickým míchadlem, teploměrem a zpětným chladičem. Do prázdné kádinky se opětovně předloží 6,2 g krystalického 4-dimethylaminopyridinu (0,0502 mol) a 40 ml acetonitrilu. Směs se míchá až do okamžiku, kdy dojde k rozpuštění krystalického podílu. Potom se získaný roztok kvantitativně přidá k suspenzi 7-ethyl-10-hydroxykamptothecinu. Do prázdné kádinky se potom předloží 13,6 g (0,0434 mol) 1-chlorokarbonyl-4-piperidinopiperidin-hydrochloridem (0,0434 mol) a 40 ml acetonitrilu. Suspenze se míchá v ultrazvukové lázni dokud nedojde k její homogenizaci. Tato suspenze se kvantitativně převede do tříhrdlé Kellerovy baňky obsahující 7-ethyl-10-hydroxykamptothecin a 4-dimethylaminopyridin v acetonitrilu a do baňky se přidá ještě 382 ml acetonitrilu. Získaná reakční suspenze se v Kellerově baňce míchá po dobu 5 hodin při teplotě 75 °C. Po dvou hodinách světle žlutá suspenze ještě více zhoustne a přechází na kávové bílou suspenzi, což je ukazatelem správného průběhu reakce. Po 5 hodinách reakce se suspenze ochladí na teplotu 18 až 20 °C a zfiltruje a filtrační koláč se promyje 300 ml acetonitrilu. Po odsátí acetonitrilu se 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]karboxyloxykamptothecin převede do sušárny, kde se suší při teplotě 60 až 65 °C do konstantní hmotnosti. Získá se 14,1 g 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]karboxyloxykamptothecinu (výtěžek 94,3 %). Obsah 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]karboxyloxykamptothecinu v získaném produktu, stanovený vysokovýkonnou kapalinovou chromatografií, činí 98,9 %.

## PATENTOVÉ NÁROKY

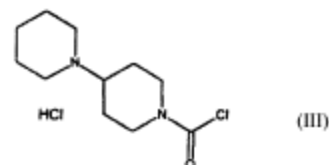
1. Způsob výroby 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]karboxyloxykamptothecinu vzorce I



vyznačený tím, že se 7-ethyl-10-hydroxykamptothecin vzorce II



kondenzuje s 1-chlorokarbonyl-4-piperidinopiperidin-hydrochloridem vzorce III



v polárním aprotickém rozpouštědle, například v acetonitrilu, v přítomnosti 4-dimethylaminopyridinu.

2. Způsob podle nároku 1, vyznačený tím, že se 1-chlorokarbonyl-4-piperidino-piperidin-hydrochlorid použije v množství 1,3 až 3 mol, výhodně v množství 1,6 až 1,9 mol, na 1 mol 7-ethyl-10-hydroxykamptothecinu.

3. Způsob podle některého z předcházejících nároků, vyznačený tím, že se 4-dimethylaminopyridin použije v množství 1,5 až 4 mol, výhodně v množství 1,8 až 2,2 mol, na 1 mol 7-ethyl-10-hydroxykamptothecinu.

4. Způsob podle některého z předcházejících nároků, vyznačený tím, že se polární aprotické rozpouštědlo použije v množství 400 až 600 ml, výhodně v množství 430 až 460 ml, na 1 mol 7-ethyl-10-hydroxykamptothecinu.

5. Způsob podle některého z předcházejících nároků, vyznačený tím, že se kondenzace provádí při teplotě 70 až 80 °C, výhodně při teplotě 73 až 77 °C.

Konec dokumentu

# EPO: <http://ep.espacenet.com/>

**European Patent Office**

Home | Contact    English    Deutsch    Français    Help index ?

**esp@cenet**  
1998-2008

### Quick Search

Search with keywords, or for persons or organisations

### Advanced Search

Search using any of the available fields

### Number Search

Search using publication, application, priority or NPL reference number

### Classification Search

Browse or search the Classification System of the European Patent Office

**esp@cenet - NEWS,**

[esp@cenetユーザーの皆様、esp@cenet assistant 日本語版 \(36本の短編eラーニングモジュールを通じてesp@cenetの使い方が学べます\)](#)

**SmartSearch [BETA]:**

**Example: Siemens EP 2007**

Explanation: Smart Search will look for Siemens as being the inventor/applicant (first letter in uppercase), for all EP, i.e., European patent applications (2 letters in uppercase for the country code) and 2007 as publication date (4 digits for the year of publication).

**Answers to the March quiz**

The first question was easy and almost all of you answered it correctly: the European Space Agency is responsible for the launch of the GOCE satellite. But the second question was more complicated.

[Read more](#)

**April quiz - deadline 30 April**

The Food and Agriculture Organization (FAO) has declared 2009 to be the International Year of Natural Fibres in an effort to promote the use of vegetable and animal fibres as a sustainable material. Many natural fibres also have industrial applications...

[Read more](#)

**Interested in our first series of quizzes?**

[Here](#) you can download the collection of the esp@cenet quizzes 2008 (pdf file).

**News from the world of esp@cenet**

[Release notes and known issues.](#)  
[Worldwide patent data coverage information](#)  
[Some basic things you should know about esp@cenet](#)  
[Some basic things you should know about searching.](#)  
[Terms and conditions of use for esp@cenet](#)  
[Fair use charter for esp@cenet and OPS](#)  
[The Patent Information Tour](#)

### News Flashes

**Scheduled maintenance**

Please be advised that esp@cenet may have a short outage at 19:00 CET on the 8th of April. Additionally some maintenance is being performed in the weekend of the 11th of April 2009 that can impact esp@cenet.

[read more...](#)

**Newsflash**

[Re-key of Brazilian data - update](#)

[read more...](#)

### Latest Updates

- [FR2921789](#) - 20090403
- [FR2915533](#) - 20090403
- [DE112007001537](#) - 20090402
- [DE112004001599](#) - 20090402
- [DE102005051909](#) - 20090402
- [DE602006000869T](#) - 20090402
- [US2009089901](#) - 20090402
- [US2009089907P](#) - 20090402
- [CZ20080035](#) - 20090401
- [CZ300266](#) - 20090401

[read more...](#)

### Local coverage:

- [EP2043421 \(A2\)](#) - 20090401

# Hledání v databázi EPO podle čísla patentu



European  
Patent Office

esp@cenet  
1998-2008

[Home](#) | [Contact](#)

[English](#)

[Deutsch](#)

[Français](#)

[Help index](#) ?

[Learn more about searching](#) [Get assistance](#) ↗

[Quick Search](#)

[Advanced Search](#)

**[Number Search](#)**

[Last result list](#)

[My patents list](#)

13

[Classification Search](#)

[Get assistance](#) ↗

## Quick Help

- » What does each database contain?
- » What are publication, application, priority and NPL reference numbers?
- » How do I enter publication, application, priority and NPL reference numbers?
- » Can I search for more than one number at a time?

## Number Search

### 1. Database

Select patent database:

Worldwide

### 2. Enter Number

Enter either application, publication or priority number with or without country code prefix, or NPL reference number

Number:

CZ299329

WO2008014520

SEARCH

CLEAR



Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list

13

Classification Search

Get assistance ↗

#### Quick Help

- » Why is the list limited to 500 results?
- » Why is the number of results sometimes approximate?
- » Why could it be that a certain patent document is not displayed in the result list?
- » Why do I sometimes get results having a title which is not in English?
- » Why do I sometimes get results which may not match my query?
- » Why is there a number in brackets?
- » Why should I tick the "in my patents list" box?
- » What is an XP document?

Compact | Print | Export

Refine search

#### RESULT LIST

1 result found in the Worldwide database for:

**CZ299329** as the publication, application, priority or NPL reference number

(Results are sorted by date of upload in database)

The result is not what you expected? Get [assistance](#) ↗

1	<b>Process for preparing 7-ethyl-10-[ 4-(1-piperidino)-1-piperidino]-carbonyloxy camptothecin</b>	in my patents list <input type="checkbox"/>
	<b>Inventor:</b> DOBROVOLNY PETR [CZ]	<b>Applicant:</b> PLIVA LACHEMA AS [CZ]
	<b>EC:</b> C07D491/22	<b>IPC:</b> C07D491/22; C07D491/00; (IPC1-7): C07D491/22
	<b>Publication info:</b> CZ20032305 (A3) — 2005-04-13	

Data supplied from the **esp@cenet** database — Worldwide





Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list

13

Classification Search

Get assistance ↗

#### Quick Help

- » Why is the list limited to 500 results?
- » Why is the number of results sometimes approximate?
- » Why could it be that a certain patent document is not displayed in the result list?
- » Why do I sometimes get results having a title which is not in English?
- » Why do I sometimes get results which may not match my query?
- » Why is there a number in brackets?
- » Why should I tick the "in my patents list" box?
- » What is an XP document?

Compact | Print | Export

Refine search

#### RESULT LIST

1 result found in the Worldwide database for:

**CZ299329** as the publication, application, priority or NPL reference number

(Results are sorted by date of upload in database)

The result is not what you expected? Get [assistance](#) ↗

1	<b>Process for preparing 7-ethyl-10-[ 4-(1-piperidino)-1-piperidino]-carbonyloxy camptothecin</b>	in my patents list <input type="checkbox"/>
	<b>Inventor:</b> DOBROVOLNY PETR [CZ]	<b>Applicant:</b> PLIVA LACHEMA AS [CZ]
	<b>EC:</b> C07D491/22	<b>IPC:</b> C07D491/22; C07D491/00; (IPC1-7): C07D491/22
	<b>Publication info:</b> CZ20032305 (A3) — 2005-04-13	

Data supplied from the **esp@cenet** database — Worldwide



Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list

13

Classification Search

Get assistance ↻

#### Quick Help

- » Why is the list limited to 500 results?
- » Why is the number of results sometimes approximate?
- » Why could it be that a certain patent document is not displayed in the result list?
- » Why do I sometimes get results having a title which is not in English?
- » Why do I sometimes get results which may not match my query?
- » Why is there a number in brackets?
- » Why should I tick the "in my patents list" box?
- » What is an XP document?

Compact | Print | Export

Return to CZ20032305 (A3)

#### Family list

6 application(s) for: CZ20032305 (A3)

- |   |                                                                                                         |                                                                |
|---|---------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------|
| 1 | <b>Method of manufacturing of 7-ethyl-10-(4-(1-piperidino)--1-piperidino)- carbonyloxy camptothecin</b> | in my patents list <input type="checkbox"/>                    |
|   | <b>Inventor:</b> DOBROVOLNY PETR                                                                        | <b>Applicant:</b> PLIVA LACHEMA AS                             |
|   | <b>EC:</b> C07D491/22                                                                                   | <b>IPC:</b> C07D491/22; C07D491/00                             |
|   | <b>Publication info:</b> AU2004266752 (A1) — 2005-03-03                                                 |                                                                |
| 2 | <b>Process for preparing 7-ethyl-10-[ 4-(1-piperidino)-1-piperidino]- carbonyloxy camptothecin</b>      | in my patents list <input type="checkbox"/>                    |
|   | <b>Inventor:</b> DOBROVOLNY PETR [CZ]                                                                   | <b>Applicant:</b> PLIVA LACHEMA AS [CZ]                        |
|   | <b>EC:</b> C07D491/22                                                                                   | <b>IPC:</b> C07D491/22; C07D491/00; (IPC1-7): C07D491/22       |
|   | <b>Publication info:</b> CZ20032305 (A3) — 2005-04-13<br>CZ299329 (B6) — 2008-06-18                     |                                                                |
| 3 | <b>METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]-CARBONYLOXYCAMPTOTHECIN</b>    | in my patents list <input type="checkbox"/>                    |
|   | <b>Inventor:</b> DOBROVOLNY PETR [CZ]                                                                   | <b>Applicant:</b> PLIVA LACHEMA AS [CZ]                        |
|   | <b>EC:</b> C07D491/22                                                                                   | <b>IPC:</b> C07D491/22; C07D491/00; (IPC1-7): C07D491/22       |
|   | <b>Publication info:</b> EP1664054 (A1) — 2006-06-07                                                    |                                                                |
| 4 | <b>METHOD OF PRODUCTION OF 7-ETHYL-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO] CARBONYLOXYCAMPTOTHECIN</b>          | in my patents list <input type="checkbox"/>                    |
|   | <b>Inventor:</b> DOBROVOLNY PETR [CZ]                                                                   | <b>Applicant:</b> PLIVA LACHEMA A S [CZ]                       |
|   | <b>EC:</b> C07D491/22                                                                                   | <b>IPC:</b> C07D491/22; C07D491/00                             |
|   | <b>Publication info:</b> RU2006109481 (A) — 2006-07-27<br>RU2334748 (C2) — 2008-09-27                   |                                                                |
| 5 | <b>Method of manufacturing of 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]- carbonyloxy- camptothecin</b> | in my patents list <input type="checkbox"/>                    |
|   | <b>Inventor:</b> DOBROVOLNY PETR [CZ]                                                                   | <b>Applicant:</b> PLIVA-LACHEMA A.S                            |
|   | <b>EC:</b> C07D491/22                                                                                   | <b>IPC:</b> C07D491/14; C07D491/22; C07D491/00                 |
|   | <b>Publication info:</b> US2006199961 (A1) — 2006-09-07<br>US7507825 (B2) — 2009-03-24                  |                                                                |
| 6 | <b>METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]- CARBONYLOXYCAMPTOTHECIN</b>   | in my patents list <input type="checkbox"/>                    |
|   | <b>Inventor:</b> DOBROVOLNY PETR [CZ]                                                                   | <b>Applicant:</b> PLIVA LACHEMA AS [CZ] ; DOBROVOLNY PETR [CZ] |
|   | <b>EC:</b> C07D491/22                                                                                   | <b>IPC:</b> C07D491/22; C07D491/00; (IPC1-7): C07D491/22       |
|   | <b>Publication info:</b> WO2005019223 (A1) — 2005-03-03                                                 |                                                                |



Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list

13

Classification Search

Get assistance

Quick Help

- » How can I maximise the page view?
- » How can I print?
- » How can I save a document?

In my patents list | Print | Maximise | Save Full Document

[Return to EP1664054 \(A1\)](#)

# METHOD OF PRODUCTION OF 7-ETHYL-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO] CARBONYLOXYCAMPTOTHECIN

Bibliographic data | Description | Claims | Mosaics | **Original document** | INPADOC legal status

Zalozky

Stránky

Přílohy

Poznámky

Volby

50%

Print

PDF

ABC

Y/N

Abstract

Bibliographic data


Description

Claims

РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ

(19) **RU** <sup>(11)</sup> 2 334 748 <sup>(12)</sup> C2

(51) МПК  
C07D 491/22 (2005.01)



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,  
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

**(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ**

(21), (22) Заявка: 2005109481/04, 24.08.2004

(24) Дата начала оспаривания срока действия патента: 24.08.2004

(30) Конвенционный приоритет:  
26.08.2003 CZ PV 2003-2305

(43) Дата публикации заявки: 27.07.2006

(45) Опубликовано: 27.06.2006 Бюл. № 27

(56) Список документов, цитированных в отчете о поиске: SAWADA S. et al, CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN, PHARMACEUTICAL SOCIETY OF JAPAN, vol.39, no.6, 01.05.1991, US 6238907 B1, 22.05.2001, US 4604463 A, 05.08.1996, WO 96/31513 A1, 10.10.1996, RU 2200163 C2, 10.03.2003.

(85) Дата перевода заявки PCT на национальную фазу: 27.03.2006

(86) Заявка PCT:  
CZ 2004/000350 (24.08.2004)

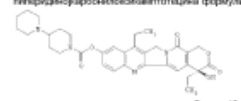
(87) Публикация PCT:  
WO 2005/019223 (05.03.2005)

Адрес для переписки:  
129610, Москва, ул. Б.Славянск, 25, стр.3,  
ООО "Юридическая фирма Гордеевой и  
Партнеры", пат. пов. Е.Е.Назеной, рег. № 517

(54) СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ 7-ЭТИЛ-10-[4-(1-ПИПЕРИДИНО)-1-ПИПЕРИДИНО] КАРБОНИЛОКСИКАМПОТЕЦИНА

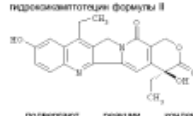
(57) Реферат:  
Настоящее изобретение относится к способу получения 7-этил-10-[4-(1-пиперидино)-1-пиперидино]карбонилэтоксикампотетина формулы I

RU 2 334 748 C2



отличающегося тем, что 7-этил-10-

гидроксиампотетина формулы II



подвержен реакции конденсации с гидроксидом 1-хлорэтил-4-пиперидинопиридина формулы III

Страница 1

1 z 7

Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list

13

Classification Search

Get assistance

**Quick Help**

- » How can I maximise the page view?
- » How can I print?
- » How can I save a document?

 In my patents list | Print | Maximise | Save Full Document

[Return to family list](#) | Previous in family list 3/6 Next in family list

## METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]-CARBOXYLOXYCAMPTOTHECIN

Bibliographic data

Description

Claims

Mosaics

Original document

INPADOC legal status

Volby

**Záložky**

- Abstract
- Bibliographic data
- Description
- Claims
- Search report

**Stránky**

Takes the place of EP1664054 A1 (art.153 of the EPC)

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization  
International Bureau

(43) International Publication Date  
3 March 2005 (03.03.2005)

PCT

(10) International Publication Number  
**WO 2005/019223 A1**

(51) International Patent Classification: **C07D 491/22**

(21) International Application Number: PCT/CZ2004/000050

(22) International Filing Date: 24 August 2004 (24.08.2004)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Date: 26 August 2003 (26.08.2003) CZ  
PV 2003-2305

(71) Applicant (for all designated States except US): PLEVA-LACHEMA A.S. (CZ/CZ); Katsík 1, 621 35 Brno (CZ)

(72) Inventor: *and*

(73) Inventor/Applicant (for US only): DOBROVOLNY, Petr (CZ/CZ); Racořevická 779/1, 674 01 Brno (CZ)

(74) Agent: KUBAT, Jan; Tuglova Hláz Kubat, Law and Patent Offices, PO Box 38, Přemysl 24, 170 00 Praha 7 (CZ)

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, FR, GB, GE, GH, GM, GR, HU, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, NA, NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TH, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, UZ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LI, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NI, SN, TD, TG).

**Declaration under Rule 4.17:**  
— of inventorship (Rule 4.17(a)) for US only

**Published:**  
— with international search report

*For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.*

(54) Title: **METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]-CARBOXYLOXY-CAMPTOTHECIN**

(57) Abstract: The invention relates to the method of manufacturing of 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy-camptothecin by condensation of 7-ethyl-10-hydroxycamptothecin with 1-(4-oxocyclohexyl)-4-piperidinopiperidine hydrochloride in a polar aprotic solvent in the presence of 4-dimethylaminopyridine.

Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list

13

Classification Search

Get assistance 

### Quick Help

- » How can I maximise the page view?
- » How can I print?
- » How can I save a document?

In my patents list | [Print](#) | [Maximise](#) | [Save Full Document](#)

[Return to family list](#) | [Previous in family list](#) **3 / 6** [Next in family list](#)

## METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]-CARBONYLOXYCAMPTOTHECIN

Bibliographic data

Description

Claims

Mosaics

**Original document**

INPADOC legal status



### INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/CZ2004/000050

#### A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D491/22

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

#### B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, MPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

#### C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	SAWADA S ET AL: "SYNTHESIS AND ANTITUMOR ACTIVITY OF 20(S)-CAMPTOTHECIN DERIVATIVES: CARBAMATE-LINKED, WATER-SOLUBLE DERIVATIVES OF 7-ETHYL-10-HYDROXYCAMPTOTHECIN" CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN, PHARMACEUTICAL SOCIETY OF JAPAN, TOKYO, JP, vol. 39, no. 6, 1 June 1991 (1991-06-01), pages 1446-1454, XP000653715 ISSN: 0009-2363 the whole document	1-5
X	US 6 235 907 B1 (HENEGAR KEVIN E ET AL) 22 May 2001 (2001-05-22) column 22, line 1 - column 23, line 32	1-5

-/--

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle of theory underlying the invention

"X" document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to

Stránky ZALOŽKY

Přílohy

námky



Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list 13

Classification Search

Get assistance →

#### Quick Help

- » Why is the description sometimes in French or German, or some other language?
- » How can I search in the text of the description?
- » Can I print and/or download the complete text?
- » How can I view the chemical structures in the full text?

In my patents list | Print

[Return to family list](#) | [Previous in family list](#) 3 /6 [Next in family list](#)

## METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]-CARBOXYLOXYCAMPTOTHECIN

Bibliographic data

**Description**

Claims

Mosaics

Original document

INPADOC legal status

The EPO does not accept any responsibility for the accuracy of data and information originating from other authorities than the EPO; in particular, the EPO does not guarantee that they are complete, up-to-date or fit for specific purposes.

Description of corresponding document: **WO 2005019223 (A1)**

[Translate this text](#)

<Desc/Clms Page number 1>

Method of Manufacturing of 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]- -carboxyloxy camptothecin Field of the Invention

This invention relates to a method of manufacturing of 7-ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin of formula I EMI1.1 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin, which is also known as irinotecan base, is used for manufacturing of the cytostatically active irinotecan hydrochloride trihydrate, a topoisomerase inhibitor which is used in treatment of lung and rectum cancer.

Background of the Invention 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin has been hitherto prepared by condensation of 7-ethyl-10-hydroxy camptothecin of formula EMI1.2

<Desc/Clms Page number 2>

with 1-chlorocarbonyl-4-piperidinopiperidine hydrochloride of formula EMI2.1 in pyridine at room temperature. This method of preparation has been described in US 4 604 463. However, this method of preparation of irinotecan base suffers from the fact that in the condensation coloured impurities are formed which have to be removed by adsorption on a silica gel column and subsequent recrystallization from ethanol. These purification steps are accompanied by substantial losses of the final product and its yields are only about 64 %.

Moreover, the method requires distillation of pyridine, extraction of a chloroform layer with sodium carbonate and sodium chloride solutions, and drying of the chloroform layer over magnesium sulfate. Therefore, a better method of preparation of irinotecan base was needed.

Such a goal has been achieved by the method according to the present invention.

Summary of the Invention The present invention relates to a method of manufacturing of 7-ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin of formula I, characterized in that 7-ethyl-10-hydroxy camptothecin of formula II EMI2.2



Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list 13

Classification Search

Get assistance →

#### Quick Help

- » Why is the description sometimes in French or German, or some other language?
- » How can I search in the text of the description?
- » Can I print and/or download the complete text?
- » How can I view the chemical structures in the full text?

In my patents list | Print

[Return to family list](#) | [Previous in family list](#) 3 / 6 [Next in family list](#)

## METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]-CARBOXYLOXYCAMPTOTHECIN

Bibliographic data

**Description**

Claims

Mosaics

Original document

INPADOC legal status

The EPO does not accept any responsibility for the accuracy of data and information originating from other authorities than the EPO; in particular, the EPO does not guarantee that they are complete, up-to-date or fit for specific purposes.

Description of corresponding document: **WO 2005019223 (A1)**

[Translate this text](#)

<Desc/Clms Page number 1>

Method of Manufacturing of 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]- -carboxyloxy camptothecin  
Field of the Invention  
This invention relates to a method of manufacturing of 7-ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin of formula I  
EMI1.1 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin, which is also known as irinotecan base, is used for manufacturing of the cytostatically active irinotecan hydrochloride trihydrate, a topoisomerase inhibitor which is used in treatment of lung and rectum cancer.

Background of the Invention 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin has been hitherto prepared by condensation of 7-ethyl-10-hydroxy camptothecin of formula EMI1.2

<Desc/Clms Page number 2>

with 1-chlorocarbonyl-4-piperidinopiperidine hydrochloride of formula EMI2.1 in pyridine at room temperature. This method of preparation has been described in US 4 604 463. However, this method of preparation of irinotecan base suffers from the fact that in the condensation coloured impurities are formed which have to be removed by adsorption on a silica gel column and subsequent recrystallization from ethanol. These purification steps are accompanied by substantial losses of the final product and its yields are only about 64 %.

Moreover, the method requires distillation of pyridine, extraction of a chloroform layer with sodium carbonate and sodium chloride solutions, and drying of the chloroform layer over magnesium sulfate. Therefore, a better method of preparation of irinotecan base was needed.

Such a goal has been achieved by the method according to the present invention.

Summary of the Invention The present invention relates to a method of manufacturing of 7-ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin of formula I, characterized in that 7-ethyl-10-hydroxy camptothecin of formula II EMI2.2



Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list **13**

Classification Search

Get assistance →

#### Quick Help

- » Why is the description sometimes in French or German, or some other language?
- » How can I search in the text of the description?
- » Can I print and/or download the complete text?
- » How can I view the chemical structures in the full text?

In my patents list | Print

[Return to family list](#) | [Previous in family list](#) 3 / 6 [Next in family list](#)

## METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]-CARBOXYLOXYCAMPTOTHECIN

Bibliographic data

**Description**

Claims

Mosaics

Original document

INPADOC legal status

The EPO does not accept any responsibility for the accuracy of data and information originating from other authorities than the EPO; in particular, the EPO does not guarantee that they are complete, up-to-date or fit for specific purposes.

Description of corresponding document: **WO 2005019223 (A1)**

[Translate this text](#)

<Desc/Clms Page number 1>

Method of Manufacturing of 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]- -carboxyloxy camptothecin  
Field of the Invention  
This invention relates to a method of manufacturing of 7-ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin of formula I  
EMI1.1 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin, which is also known as irinotecan base, is used for manufacturing of the cytostatically active irinotecan hydrochloride trihydrate, a topoisomerase inhibitor which is used in treatment of lung and rectum cancer.

Background of the Invention 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin has been hitherto prepared by condensation of 7-ethyl-10-hydroxy camptothecin of formula EMI1.2

<Desc/Clms Page number 2>

with 1-chlorocarbonyl-4-piperidinopiperidine hydrochloride of formula EMI2.1 in pyridine at room temperature. This method of preparation has been described in US 4 604 463. However, this method of preparation of irinotecan base suffers from the fact that in the condensation coloured impurities are formed which have to be removed by adsorption on a silica gel column and subsequent recrystallization from ethanol. These purification steps are accompanied by substantial losses of the final product and its yields are only about 64 %.

Moreover, the method requires distillation of pyridine, extraction of a chloroform layer with sodium carbonate and sodium chloride solutions, and drying of the chloroform layer over magnesium sulfate. Therefore, a better method of preparation of irinotecan base was needed.

Such a goal has been achieved by the method according to the present invention.

Summary of the Invention The present invention relates to a method of manufacturing of 7-ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin of formula I, characterized in that 7-ethyl-10-hydroxy camptothecin of formula II EMI2.2





Quick Search

Advanced Search

Number Search

Last result list

My patents list 13

Classification Search

Get assistance →

#### Quick Help

- » Why is the description sometimes in French or German, or some other language?
- » How can I search in the text of the description?
- » Can I print and/or download the complete text?
- » How can I view the chemical structures in the full text?

In my patents list | Print

[Return to family list](#) | [Previous in family list](#) 3 /6 [Next in family list](#)

## METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]-CARBOXYLOXYCAMPTOTHECIN

Bibliographic data

**Description**

Claims

Mosaics

Original document

INPADOC legal status

The EPO does not accept any responsibility for the accuracy of data and information originating from other authorities than the EPO; in particular, the EPO does not guarantee that they are complete, up-to-date or fit for specific purposes.

Description of corresponding document: **WO 2005019223 (A1)**

[Translate this text](#)

<Desc/Clms Page number 1>

Method of Manufacturing of 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]- -carboxyloxy camptothecin  
Field of the Invention  
This invention relates to a method of manufacturing of 7-ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin of formula I  
EMI1.1 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin, which is also known as irinotecan base, is used for manufacturing of the cytostatically active irinotecan hydrochloride trihydrate, a topoisomerase inhibitor which is used in treatment of lung and rectum cancer.

Background of the Invention 7-Ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin has been hitherto prepared by condensation of 7-ethyl-10-hydroxy camptothecin of formula EMI1.2

<Desc/Clms Page number 2>

with 1-chlorocarbonyl-4-piperidinopiperidine hydrochloride of formula EMI2.1 in pyridine at room temperature. This method of preparation has been described in US 4 604 463. However, this method of preparation of irinotecan base suffers from the fact that in the condensation coloured impurities are formed which have to be removed by adsorption on a silica gel column and subsequent recrystallization from ethanol. These purification steps are accompanied by substantial losses of the final product and its yields are only about 64 %.

Moreover, the method requires distillation of pyridine, extraction of a chloroform layer with sodium carbonate and sodium chloride solutions, and drying of the chloroform layer over magnesium sulfate. Therefore, a better method of preparation of irinotecan base was needed.

Such a goal has been achieved by the method according to the present invention.

Summary of the Invention The present invention relates to a method of manufacturing of 7-ethyl-10- [4- (1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy camptothecin of formula I, characterized in that 7-ethyl-10-hydroxy camptothecin of formula II EMI2.2

# USPTO: <http://www.uspto.gov/>



Welcome to the only official Website of the

For [Site Overview - New Users](#)

Go

Search

## UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

An Agency Of The United States Department Of Commerce

[Text Only](#) | [Site Index](#) | [FAQ](#) | [Glossary](#) | [How To Guides](#) | [eBusiness](#) | [eBiz Alerts](#) | [News](#) | [Help](#) | [How To Search](#) | [Resources](#)

About USPTO

Under Secretary & Director

Public Advisory Committees

Patents

Trademarks

Copyrights

Policy & Law

Products & Services

Strategic Planning

How To

Inventor Support

Emergency Notices

Contact Us

### TOP NEWS

#### National Trademark Expo Set for USPTO Campus May 8-9

The United States Patent and Trademark Office will present a National Trademark Expo May 8 and 9. A ribbon cutting ceremony at 10 a.m. will kick off the two day event. The Expo will be held on the agency's campus in Alexandria, Virginia, at 600 Dulany Street in the atrium of the Madison Building. Exhibit hours are from 10 a.m. to 6 p.m. on Friday, May 8 and from 10 a.m. to 4 p.m. on Saturday, May 9. The Expo is free, fun and informative for the whole family.



>> [Full Story](#)

>> [Trademark Expo Photo Gallery](#)

#### USPTO Seeks Nominees to Public Advisory Committees

*Deadline for Submissions May 15, 2009*

The United States Patent and Trademark Office is seeking nominations for the Patent Public Advisory Committee and the Trademark Public Advisory Committee. The committees advise the agency on a wide variety of policy and budgetary issues. Members are appointed by and serve at the pleasure of the Secretary of Commerce. Member's terms run for three years. Those appointed must have "substantial backgrounds and achievement in finance, management, labor relations, science, and technology and office automation." The deadline for nomination is May 15.

>> [Click here](#) for more information about the Advisory Committees and to make a nomination.



[2008 Performance and Accountability Report](#)





# UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

An Agency Of The United States Department Of Commerce

## Patent Full-Text and Full-Page Image Databases

### [PATFT: Issued Patents](#)

*Full-text since 1976; full-page images since 1790.*

[Quick Search](#)

[Advanced Search](#)

[Patent Number Search](#)

[View Patent Full-Page Images](#)

[Status and Event History](#)

[Database Contents](#)

[Help Files](#)

### [AppFT: Patent Applications](#)

*Published since March, 2001.*

[Quick Search](#)

[Advanced Search](#)

[Publication Number Search](#)

[View Publication Full-Page Images](#)

[Status and Event History](#)

[Help Files](#)

#### Information Applicable to Both Databases

[Important Notices and Policies -- Please Read!](#)

[How to Access and View Full-Page Images](#)

[Problems Using the Databases?](#)

[Report Errors in Data Content](#)

#### Related USPTO Resources

[Searching by Patent Classification](#)

[Patent Application Information Retrieval \(PAIR\)](#)

[Patent Assignment Database](#)

[Patent Attorneys and Agents](#)

[Published Sequence Listings](#)

## USPTO PATENT FULL-TEXT AND IMAGE DATABASE

[Home](#)[Quick](#)[Advanced](#)[Pat Num](#)[Help](#)[View Cart](#)

**Data current through February 17, 2009.**

Enter the patent numbers you are searching for in the box below.

Query [\[Help\]](#)

**All patent numbers must be seven characters in length, excluding commas, which are optional. Examples:**

Utility -- 5,146,634 6923014 0000001

Design -- D339,456 D321987 D000152

Plant -- PP08,901 PP07514 PP00003

Reissue -- RE35,312 RE12345 RE00007

Defensive Publication -- T109,201 T855019 T100001

Statutory Invention Registration -- H001,523 H001234 H000001

Re-examination -- RX12

Additional Improvement -- AI00,002 AI000318 AI00007

## USPTO PATENT FULL-TEXT AND IMAGE DATABASE

[Home](#)[Quick](#)[Advanced](#)[Pat Num](#)[Help](#)[Bottom](#)[View Cart](#)[Add to Cart](#)[Images](#)

(1 of 1)

**United States Patent**

**7,507,825**

**Dobrovlny**

**March 24, 2009**

**Method of manufacturing of 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1- piperidino]- carbonyloxy- camptothecin**

### **Abstract**

The invention relates to the method of manufacturing of 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]-carbonyloxycamptothecin by condensation of 7-ethyl-10-hydroxycamptothecin with 1-chlorocarbonyl-4-piperidinopiperidine hydrochloride in a polar aprotic solvent in the presence of 4-dimethylaminopyridine.

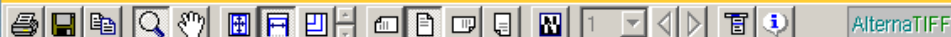
Inventors: **Dobrovlny; Petr** (Brno, CZ)  
Assignee: **Pliva-Lachema A.S.** (Brno, CZ)  
Appl. No.: **10/567,472**  
Filed: **August 24, 2004**  
PCT Filed: **August 24, 2004**  
PCT No.: **PCT/CZ2004/000050**  
371(c)(1),(2),(4) Date: **February 07, 2006**  
PCT Pub. No.: **WO2005/019223**  
PCT Pub. Date: **March 03, 2005**

**Foreign Application Priority Data**



Publication Number: 07507825 Section: Front Page 1 of 4 pages

Help



▲ Full Text  
? Help

Go to Page:

Go



Sections:

- Front Page
- Specifications
- Claims



US007507825B2

(12) **United States Patent**  
**Dobrovolny**

(10) **Patent No.:** **US 7,507,825 B2**  
(45) **Date of Patent:** **Mar. 24, 2009**

(54) **METHOD OF MANUFACTURING OF 7-ETHYL-10-[4-(1-PIPERIDINO)-1-PIPERIDINO]-CARBOXYLOXY-CAMPTOTHECIN**

6,794,370 B2	9/2004	Achternath
7,126,000 B2	10/2006	Ogawa et al.
7,151,179 B2	12/2006	Liu et al.
2004/0235878 A1	11/2004	Liu et al.
2005/0272757 A1	12/2005	Naidu
2006/0199961 A1	9/2006	Dobrovolny

(75) Inventor: **Petr Dobrovolny**, Brno (CZ)

(73) Assignee: **Pilva-Lachema A.S.**, Brno (CZ)

(\* ) Notice: Subject to any disclaimer, the term of this patent is extended or adjusted under 35 U.S.C. 154(b) by 240 days.

## FOREIGN PATENT DOCUMENTS

EP	74770	3/1983
EP	88642	9/1983
EP	51289	4/1986
EP	74256	11/1986
EP	154584	2/1988
EP	154583	9/1988
WO	WO96/31513	10/1996
WO	WO2004/100897	11/2004
WO	WO2005/019223	3/2005
WO	WO2005/058910	6/2005

(21) Appl. No.: **10/567,472**

(22) PCT Filed: **Aug. 24, 2004**

(86) PCT No.: **PCT/CZ2004/000050**

§ 371 (c)(1),  
(2), (4) Date: **Feb. 7, 2006**

(87) PCT Pub. No.: **WO2005/019223**

PCT Pub. Date: **Mar. 3, 2005**

## OTHER PUBLICATIONS

"Combination of Irinotecan (CPT-11) and 5-Fluorouracil with an analysis of cellular determinants of drug activity," Pevillard et al. *Biochemical Pharmacology*, vol. 56: 1315-1322, 1998.

"Clinical advances with topoisomerase I inhibitors in gastrointestinal malignancies," Amund, Jean-Pierre et al. *Anti-Cancer Drugs* 10 (Suppl. 1): S5-S12 (1999).

"Phase III study of escalating dose of CPT-11 in combination with LV5FU2 ("De Gramont" regimen) every 2 weeks in the treatment of colorectal cancer (CRC) after 5-FU failure," Ducreux, M. et al. *Abstract 823, Proc. of Amer. Soc. Clin. Oncol.* 16:234a (1997).

"Phase I study of a weekly schedule of irinotecan (CPT-11), high-dose folinic acid (FA) and 5-fluorouracil (5-FU) as first line chemotherapy (CT) in metastatic colorectal cancer: Final results," Vanhoef, U. et al., *Abstract 779, Proc. of Amer. Soc. Clin. Oncol.* 17:202a (1998).

"Irinotecan (CPT-11) in the treatment of gastrointestinal cancers," Nishiyama, M. *Japanese J. Chemotherapy* 46(8):292-296 (1998).

(Continued)

Primary Examiner—Charanjit S. Anilakki  
(74) Attorney, Agent, or Firm—Foley & Lardner LLP

(57) **ABSTRACT**

The invention relates to the method of manufacturing of 7-ethyl-10-[4-(1-piperidino)-1-piperidino]-carboxyloxy-camptothecin by condensation of 7-ethyl-10-hydroxycamptothecin with 1-chlorocarbonyl-4-piperidino-piperidine hydrochloride in a polar aprotic solvent in the presence of 4-dimethylaminopyridine.

**10 Claims, No Drawings**

(56) **References Cited**  
U.S. PATENT DOCUMENTS

3,894,029 A	7/1975	Winterfeldt et al.	
4,031,098 A	6/1977	Sugasawa	
4,399,276 A	8/1983	Yokoyama et al.	
4,399,282 A	8/1983	Miyasaka et al.	
4,473,692 A	9/1984	Miyasaka et al.	
4,604,463 A	* 8/1986	Miyasaka et al.	
4,914,205 A	4/1990	Samada et al.	544,125
5,061,800 A	10/1991	Yaegashi et al.	
5,491,237 A	2/1996	Fang et al.	
5,602,141 A	2/1997	Bedeschi et al.	
5,734,056 A	3/1998	Burk et al.	
5,843,954 A	12/1998	Yaegashi et al.	
6,235,907 B1	5/2001	Henegar et al.	
6,310,210 B1	10/2001	Ogawa et al.	
6,403,569 B1	6/2002	Achternath	
6,444,820 B1	9/2002	Henegar et al.	
6,743,918 B2	6/2004	Yaegashi et al.	



Home > IP Services > PATENTSCOPE® > Patent Search



## Search International Patent Applications

This facility allows you to search 1,561,780 international patent applications and to view the latest [information and documents](#) available to the International Bureau.

Structured Search

> **Keywords**  =

=

=

=

=

=

=

=

=

=

=

=

### PATENTSCOPE®

- About Patents
- Patent Search
- Content
- Glossary
- National Office Databases
- Terms and Conditions
- Technology Focus
- PCT Resources
- Priority Documents
- Data Services
- Statistics
- Patent Law
- Life Sciences
- Meetings
- Contact

### RELATED LINKS

- International Patent Classification
- Natural Language IPC Search
- Standards & Documentation

### E-NEWSLETTERS

Subscribe to receive e-mails of news and updates on WIPO's activities regarding patents and the PCT

### SHORTCUTS

- Log in / Create account
- Search Help
- Sequence Listings
- Country/Office Codes [PDF]
- INID Codes [PDF]
- Kind Codes
- Data Formats
- Feedback

### PATENTSCOPE® Search Service - News:

- > [PATENTSCOPE® search service: Removal of address data](#) (Dec 15, 2008)
- > [PATENTSCOPE® search service: PCT file contents available soon](#) (Sep 30, 2008)
- > [2008 Changes in Publication Dates](#) (Sep 10, 2008)
- > [PATENTSCOPE® Data Products, Full-text search available in Japanese](#) (Jun 2, 2008)
- > [PATENTSCOPE® search service interface in Spanish](#) (May 21, 2008)

# Vyhledávání podle patentové třídy



European Patent Office



Home | Contact    English    Deutsch    Français    Help index ?

How do I use the Classification search? Get assistance ↗

## Search the European classification

**View Section**    **Find classification(s) for keywords**    **Find description for a symbol**

Index [A](#) [B](#) [C](#) [D](#) [E](#) [F](#) [G](#) [H](#) [Y](#)

Next page: [A](#)

- HUMAN NECESSITIES** [A](#)
- PERFORMING OPERATIONS; TRANSPORTING** [B](#)
- CHEMISTRY; METALLURGY** [C](#)
- TEXTILES; PAPER** [D](#)
- FIXED CONSTRUCTIONS** [E](#)
- MECHANICAL ENGINEERING; LIGHTING; HEATING; WEAPONS; BLASTING ENGINES OR PUMPS** [F](#)
- PHYSICS** [G](#)
- ELECTRICITY** [H](#)
- GENERAL TAGGING OF NEW TECHNOLOGICAL DEVELOPMENTS**[NO403] [Y](#)

show notes        Copy to searchform:

**Classification Search**

Get assistance ↗

### Quick Help

- » What is the ECLA classification system?
- » How do I enter a classification number?
- » Can I retrieve a classification using keywords?
- » Can I start a new search using the classifications listed?
- » Is the ECLA system updated?
- » How can I view the text of an ECLA class?



## Search the European classification

View Section

Index [A](#) [B](#) [C](#) [D](#) [E](#) [F](#) [G](#) [H](#) [Y](#)

Find classification(s) for keywords

Find description for a symbol

Next page: [A01](#)

### HUMAN NECESSITIES

[A](#)

AGRICULTURE; FORESTRY; ANIMAL HUSBANDRY; HUNTING; TRAPPING; FISHING

[A01](#)

BAKING; EDIBLE DOUGHS

[A21](#)

BUTCHERING; MEAT TREATMENT; PROCESSING POULTRY OR FISH

[A22](#)

FOODS OR FOODSTUFFS; THEIR TREATMENT, NOT COVERED BY OTHER CLASSES

[A23](#)

TOBACCO; CIGARS; CIGARETTES; SMOKERS' REQUISITES

[A24](#)

WEARING APPAREL

[A41](#)

HEADWEAR

[A42](#)

FOOTWEAR

[A43](#)

HABERDASHERY; JEWELLERY

[A44](#)

HAND OR TRAVELLING ARTICLES

[A45](#)

BRUSHWARE

[A46](#)

FURNITURE (arrangements of seats for, or adaptations of seats to, vehicles [B60N](#)); DOMESTIC ARTICLES OR APPLIANCES; COFFEE MILLS; SPICE MILLS; SUCTION CLEANERS IN GENERAL (ladders [E06C](#))

[A47](#)

MEDICAL OR VETERINARY SCIENCE; HYGIENE

[A61](#)

LIFE-SAVING; FIRE-FIGHTING (ladders [E06C](#))

[A62](#)

SPORTS; GAMES; AMUSEMENTS

[A63](#)

show notes

Copy to searchform:

## Search the European classification

View Section

[Index](#) [A](#) [B](#) [C](#) [D](#) [E](#) [F](#) [G](#) [H](#) [Y](#)

Find classification(s) for keywords

Find description for a symbol

Previous page: [A61J19/00](#) Next page: [A61K6/00](#)

### HUMAN NECESSITIES

[A](#)

### MEDICAL OR VETERINARY SCIENCE; HYGIENE

[A61](#)

### PREPARATIONS FOR MEDICAL, DENTAL, OR TOILET PURPOSES (bringing into special

[A61K](#)

physical form [A61J](#), [N: mechanical aspects]; chemical aspects of, or use of materials for deodorisation of air, for disinfection or sterilisation, or for bandages, dressings, absorbent pads or surgical articles [A61L](#); compounds per se [C01](#), [C07](#), [C08](#), [C12N](#); soap compositions [C11D](#); micro-organisms per se [C12N](#)) [[C0203](#)]

### Preparations for dentistry (teeth cleaning preparations [A61K7/16](#); dentistry [A61C](#))

[A61K6](#)

[N: IPC7] Cosmetics or similar toilet preparations (casings or accessories for storing or handling of solid or pasty toilet or cosmetic substances [A45D40/00](#))

[A61K7](#)

### Cosmetic or similar toilet preparations (casings or accessories for storing or handling of solid or pasty toilet or cosmetic substances [A45D40/00](#)) [[C0810](#)]

[A61K8](#)

**Medicinal preparations characterised by special physical form** (nuclear magnetic resonance contrast preparations or magnetic resonance imaging contrast preparations [A61K49/18](#); preparations containing radioactive substances [A61K51/12](#)) [Note: Between the one-dot groups of [A61K9/00](#), classification is not made in the last appropriate place. [A61K9/00](#) is subdivided according to the following concepts: the drug release technique ([A61K9/00L](#) and subgroups), the site of application ([A61K9/00M](#) and subgroups) and the physical form ([A61K9/00Z](#) to [A61K9/70E](#)). Where relevant, documents are classified in more than one of these subdivisions. The reformed ECLA approach is used, i.e. invention-like information is identified with classification symbols, and additional information with ICO-symbols. To cover all aspects of an invention, multiple classification with ICO-symbols, also within the subdivisions, is possible] [[C0605](#)]

[A61K9](#)

### Medicinal preparations containing organic active ingredients

[A61K31](#)

### Medicinal preparations containing inorganic active ingredients

[A61K33](#)

### Medicinal preparations containing material or reaction products thereof with undetermined constitution

[A61K35](#)

**Medicinal preparations of undetermined constitution containing material from algae, lichens, fungi or plants, or derivatives thereof, e.g. traditional herbal medicines** [N: antigens from pollen [A61K39/36](#)] [[N0604](#)] [N: Warning: group [A61K36/00](#) and subgroups are incomplete. See provisionally also [A61K35/78](#) to [A61K35/84](#)] [[C0703](#)]

[A61K36](#)

**Medicinal preparations containing peptides** (peptides containing beta-lactam rings [A61K31/00](#); cyclic dipeptides not having in their molecule any other peptide link than those which form their ring, e.g. piperazine-2,5-diones, [A61K31/00](#); ergot alkaloids of the cyclic peptide type [A61K31/48](#); containing macromolecular compounds having statistically distributed amino acid units [A61K31/74](#); medicinal preparations containing antigens or antibodies [A61K39/00](#); medicinal preparations characterised by the non-active ingredients, e.g. peptides as drug carriers, [A61K47/00](#)) [[N9412](#)]

[A61K38](#)

### Medicinal preparations containing antigens or antibodies (materials for immunoassay [G01N33/53](#)) [[C9805](#)]

[A61K39](#)

**Medicinal preparations obtained by treating materials with wave energy or particle radiation**; [N: Therapies using these preparations] ([A61K31/59](#) takes precedence; generation of ultrasonic waves [B06B](#); electric discharge tubes [H01J](#)) [[C9701](#)]

[A61K41](#)