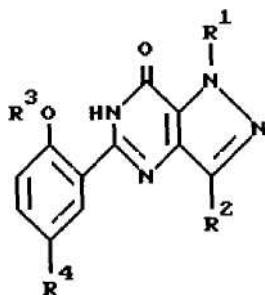


Палата по патентным спорам в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части 4 Гражданского кодекса Российской Федерации, введённой в действие с 01.01.2008 в соответствии с Федеральным законом от 18.12.2006 № 231-ФЗ (далее - Кодекс) и с Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее - Правила ППС), рассмотрела возражение ЗЕНТИВА а.с., Чехия (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее в палату по патентным спорам 25.09.2008, против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2130776, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации на изобретение № 2130776 выдан по заявке № 96100543/14 с приоритетами от 09.06.1993 по пунктам 1-8 формулы изобретения и от 13.05.1994 по пунктам 9-14 формулы изобретения на имя Пфайзер Айэленд Фармасьютикалз, ІЕ (далее – патентообладатель). Патент действует со следующей формулой изобретения:

«1. Применение соединения формулы I:



где R^1 представляет собой H, C₁ - C₃алкил, C₃ - C₅перфторалкил или C₃ - C₅циклоалкил;

R^2 представляет собой H, C, - C₃алкил, необязательно замещенный C₃ - C₆циклоалкилом, C, -C₃перфторалкил или C₃ - C₆циклоалкил;

R^3 представляет собой C, - C₆алкил, необязательно замещенный C₃ - C₆циклоалкилом, C,-C₃перфторалкил или C₃ - C₅циклоалкил, C₃ - C₆алкенил или C₃ - C₆алкинил;

R^4 представляет собой C₁ - C₄алкил, необязательно замещенный OH, NR⁵R⁶, CN, CONR⁵R⁶ или CO₂R⁷, C₂ - C₄алкенил, необязательно замещенный CN, CONR⁵R⁶ или CO₂R⁷, C₂ - C₄алканоил, необязательно замещенный NR⁵R⁶, (гидрокси)C₂ - C₄алкил, необязательно замещенный NR⁵R⁶, (C₂ -C₃алкокси)C₁ - C₂алкил, необязательно замещенный OH или NR⁵R⁶, CONR⁵R⁶, CO₂R⁷, галоген, NR⁵R⁶, NHSO₂NR⁵R⁶, NHSO₂R⁸, SO₂NR⁹R¹⁰ или фенил, пиридил, пиримидинил, имидазолил, оксазолил, тиазолил, тиенил или триазолил, любой из которых необязательно замещен метилом;

R^5 и R^6 представляют собой каждый независимо H или C₁ - C₄алкил, или вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пирролидинильную, пиперидиновую, морфолиновую, 4-(N(R) - пиперазинильную или имидазолильную группу, где упомянутая группа необязательно замещена метилом или OH;

R^7 представляет собой H или C, - C₄алкил;

R^8 представляет собой C, - C₃алкил, необязательно замещенный NR⁵R⁶;

R^9 и R^{10} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пирролидинильную, пиперидиновую, морфолиновую или 4-1Ч¹²)-пиперазинильную группу, где указанная группа необязательно замещена C₁ - C₄алкилом, C₁ - C₃алкокси, NR¹³R¹⁴ или CONR¹³R¹⁴;

R^{11} представляет собой H, C_1 - C_3 алкил, необязательно замещенный фенилом, (гидрокси) C_2 - C_3 алкил или C_1 - C_4 алканоил;

R^{12} представляет собой H, C, - C_6 алкил, (C_1 - C_3 алкокси) C_2 - C_6 алкил, (гидрокси) C_2 - C_6 алкил, ($R^{13}R^{14}N$) C_2 - C_6 алкил, ($R^{13}R^{14}NOC$) C_1 - C_6 алкил, $CONR^{13}R^{14}$, $CSNR^{13}R^{14}$ или $C(NH)NR^{13}R^{14}$;

R^{13} и R^{14} представляют собой каждый независимо H, C, - C_4 алкил, (C_1 - C_3 алкокси) C_2 - C_4 алкил или (гидрокси) C_2 - C_4 алкил; или их фармацевтически приемлемой соли, или фармацевтической композиции, содержащей это соединение для лечения или профилактики дисфункции эрекции у животного-самца, включая человека.

2. Применение соединения по п.1, отличающееся тем, что в соединении формулы I, где R^1 представляет собой H, метил или этил, R^2 представляет собой C, - C_3 алкил, R^3 представляет собой C_2 - C_3 алкил или аллил, R^4 представляет собой C_1 - C_2 алкил, необязательно замещенный OH, NR^5R^6 , CN, $CONR^5R^6$ или CO_2R^7 , ацетил, необязательно замещенный NR^5R^6 , гидроксиэтил, необязательно замещенный NR^5R^6 , этоксиметил, необязательно замещенный OH или NR^5R^6 , $CH = CHCN$, $CH = CHCONR^5R^6$, $CH = CHCO_2R^7$, $CONR^5R^6$, CO_2H , Bг, NR^5R^6 , $NHSO_2NR^5R^6$, $NHSO_2R^8$, $SO_2NR^9R^{10}$, или пиридил или имидазолил, любой из которых необязательно замещен метилом, R^5 и R^6 представляют собой каждый независимо H, метил или этил, или вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую, морфолиновую, 4-(1¹¹)-пиперазинильную или имидазолильную группу, где указанная группа необязательно замещена метилом или OH, R^7 представляет собой H или трет-бутил, R^8 представляет собой метил или $CH_2-CH_2-CH_2NR^5R^6$, R^9 и R^{10} вместе

с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую или 4-1\\(P¹²)-пиперазинильную группу, где указанная группа обязательно замещена NR¹³R¹⁴ или CONR¹³R¹⁴; R¹¹ представляет собой H, метил, бензил, 2-гидроксиэтил или ацетил, R¹² представляет собой H, C, - C₃алкил, (гидрокси)C₂ - C₃алкил, CSNR¹³R¹⁴ или C-(NH)NR¹³R¹⁴, R¹³ и R¹⁴ представляют собой каждый независимо H или метил.

3. Применение соединения по п.2, отличающееся тем, что в соединении формулы I R¹ представляет собой метил или этил, R² представляет собой C₁ - C₃алкил, R³ представляет собой этил, H-пропил или аллил, R⁴ представляет собой CH₂NR⁵R⁶, COCH₂NR⁵R⁶, CH(OH)-CH₂NR⁵R⁶, CH₂OCH₂CH₃, CH₂-осн₂CH₂ОН, CH₂OCH₂CH₂NR⁵R⁶, CH=CHCON(CH₃)₂, CH=CHCO₂R⁷, CONR⁵R⁶, CO₂H, Br, NHSO₂NR⁵R⁶, NHSO₂-CH₂CH₂-CH₂NR⁵R⁶, SO₂NR⁹R¹⁰, 2-пиридил, 1-имидазолил или 1-метил-2-имидазозолил, R⁵ и R⁶ вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую, 4-гидроксипиперидиновую, морфолиновую, 4-1\\1(P¹¹)-пиперазинильную или 2-метил-1-имидазолильную группу, R⁷ представляет собой H или трет-бутил, R⁹ и R¹⁰ вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-карбамоилпиперидиновую или 4-1Ч(P¹²)-пиперазинильную группу; R¹¹ представляет собой H, метил, бензил, 2-гидроксиэтил или ацетил; и R¹² представляет собой H, 2-гидроксиэтил, C₁ - C₃алкил или CSNH₂.

4. Применение соединения по п. 3, отличающееся тем, что в соединении формулы I R¹ представляет собой метил или этил; R² представляет собой п-пропил, R³ представляет собой этил, н-пропил или аллил, R⁴ представляет собой COCH₂NR⁵R⁶, CONR⁵R⁶ или SO₂NR⁵R⁶ или 1-

метил-2-имидазолил, R^5 и R^6 вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют морфолиновую или 4-N(R^{11})-пиперазинильную группу, R^9 и R^{10} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-N(R^{12})-пиперазинильную группу, R^{11} представляет собой метил или ацетил, R^{12} представляет собой H, метил, 2-пропил или 2-гидроксиэтил.

5. Применение соединения по п.4, отличающееся тем, что соединение формулы I выбирают из:

5-(2-этоксифенил)-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1]пиримидин-7она;

5-(5-морфолинацетил-2-н-пропоксифенил)-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1] пиримидин-7она;

5-[2-этоксифенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол [4,3-с1]пиримидин-7она;

5-[2-аллилокси-5-(4-метил-1-пиперазинилсульфонил)фенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1]пиримидин-7она;

5-{2-этоксифенил}-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1]пиримидин-7она;

5-{2-этоксифенил}-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1]пиримидин-7она;

5-{5-[4-(2-гидроксиэтил)-1-пиперазинилсульфонил]-2-н-пропоксифенил}-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1]пиримидин-7она;

5-[2-этоксифенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол [4,3-с1]пиримидин-7она;

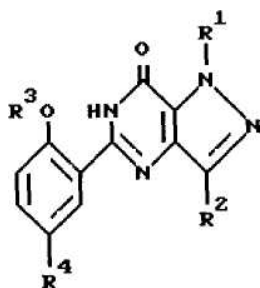
5-[2-этокси-5-(1-метил-2-имидазолил)фенил] -1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1] пиримидин-7она.

6. Способ лечения или предотвращения дисфункции эрекции животного самца, включая человека, включающий введение указанному самцу 5 - 75 мг до трех раз в день соединения формулы I по любому из пп. 1 - 5, или его фармацевтически приемлемой соли, или фармацевтической композиции, содержащей это вещество.

7. Способ орального лечения или предотвращения дисфункции эрекции у человека, который включает оральное введение до трех раз в день 5 - 75 мг ингибитора цГМФ ФДЭ или его фармацевтически приемлемой соли.

8. Способ по п.7, отличающийся тем, что ингибитором является цГМФ ФДЭ ингибитор.

9. Применение соединения формулы I



где R^1 представляет собой H, C₁ - C₃алкил, C₁ - C₃перфторалкил или C₃ - C₅циклоалкил;

R^2 представляет собой H, C₁ - C₆алкил, необязательно замещенный C₃ - C₆циклоалкилом, C₁ - C₃перфторалкил, или C₃ - C₆циклоалкил;

R представляет собой C₁ - C₆алкил, необязательно замещенный C₃ - C₆циклоалкилом, C₁ - C₆перфторалкил, или C₃ - C₅циклоалкил, C₃ - C₆алкенил, или C₃ - C₆алкинил;

R^4 представляет собой C, - C₄алкил, необязательно замещенный OH, NR^5R^6 , CN, $CONR^5R^6$ или CO_2R^7 , C₂ - C₄алкенил, необязательно замещенный CN, $CONR^5R^6$ или CO_2R^7 , C₂ - C.алканоил, необязательно замещенный NR^5R^6 , (гидрокси)C₂ - C₄алкил, необязательно замещенный NR^5R^6 , (C₂ - C₃алкокси)C₁ - C₂алкил, необязательно замещенный OH или NR^5R^6 , $CONR^5R^6$, CO_2R^7 , галоген, NR^5R^6 , $NHSO_2NR^5R^6$, $NHSO_2R^8$, $SO_2NR^9R^{10}$ или фенил, пиридил, пиримидинил, имидазолил, оксазолил, тиазолил, тиенил или триазолил, любой из которых необязательно замещен метилом;

R^5 и R^6 представляют собой каждый независимо H или C, - C₄алкил, или вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пирролидинильную, пиперидиновую, морфолиновую, 4-(N(R^{11}))-пиперазинильную или имидазолильную группу, где упомянутая группа необязательно замещена метилом или OH;

R^7 представляет собой H или C, - C₄алкил;

R^8 представляет собой C, - C₃алкил, необязательно замещенный NR^5R^6 ;

R^9 и R^{10} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пирролидинильную, пиперидиновую, морфолиновую или 4-M(P^{12})-пиперазинильную группу, где указанная группа необязательно замещена C, - C₄алкилом, C, - C₃алкокси, $NR^{13}R^{14}$ или $CONR^{13}R^{14}$;

R^{11} представляет собой H, C₁ - C₃алкил, необязательно замещенный фенилом, (гидрокси)C₂ - C₃алкил или C, - C₄алканоил;

R^{12} представляет собой H, C, - C₆алкил, (C₁ - C₃алкокси), C₂ - C₆алкил, (гидрокси)C₂ - C₆алкил, ($R^{13}R^{14}N$)C₂ - C₆алкил, ($R^{13}R^{14}NOC$)C₁

- C_6 алкил, $CONR^{13}R^{14}$, $CSNR^{13}R^{14}$ или $C(NH)NR^{13}R^{14}$; и R^{13} и R^{14} представляют собой каждый независимо H , C , - C_4 алкил; (C_1 - C_3 алкокси) C_2 - C_4 алкил; или (гидрокси) C_2 - C_4 алкил;

или их фармацевтически приемлемой соли, или фармацевтической композиции, содержащей это соединение для лечения или профилактики сексуальной дисфункции у женской особи.

10. Применение соединения по п.9, отличающееся тем, что в соединении формулы I R^1 представляет собой H , метил или этил; R^2 представляет собой C_1 - C_3 алкил; R^3 представляет собой C_2 - C_3 алкил или аллил; R^4 представляет собой C , - C_2 алкил, необязательно замещенный OH , NR^5R^6 , CN , $CONR^5R^6$ или CO_2R^7 , ацетил, необязательно замещенный NR^5R^6 , гидроксиэтил, необязательно замещенный NR^5R^6 , этоксиметил, необязательно замещенный OH или NR^5R^6 , $CH = CHCN$, $CH = CHCONR^5R^6$, $CH = CHCO_2R^7$, $CONR^5R^6$, CO_2H , Bg , NR^5R^6 , $NHSO_2NR^5R^6$, $NHSO_2R^8$, $SO_2NR^9R^{10}$, или пиридил или имидазолил, любой из которых необязательно замещен метилом; R^5 и R^6 представляют собой каждый независимо H , метил или этил, или вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую, морфолиновую, 4- $1\text{C}(P^{11})$ -пиперазинильную или имидазолильную группу, где указанная группа необязательно замещена метилом или OH ; R^7 представляет собой H или трет-бутил; R^8 представляет собой метил или $CH_2CH_2CH_2NR^5R^6$; R^9 и R^{10} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую или 4- $1\text{C}(P^{12})$ -пиперазинильную группу, где указанная группа необязательно замещена $NR^{13}R^{14}$ или $CONR^{13}R^{14}$; R^{11} представляет собой H , метил, бензил, 2-гидроксиэтил или ацетил, R^{12} представляет собой H , C , - C_3 алкил, (гидрокси) C_2 - C_3 алкил,

$\text{CSNR}^{13}\text{R}^{14}$ или $\text{C}-(\text{NH})\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$; R^{13} и R^{14} представляют собой каждый независимо H или метил.

11. Применение соединения по п.10, отличающееся тем, что в соединении формулы I R^1 представляет собой метил или этил, R^2 представляет собой C, - C_3 алкил, R^3 представляет собой этил, H-пропил или аллил, R^4 представляет собой $\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{COCH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{CH}(\text{OH})\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $\text{CH}_2\text{-осн}_2\text{CH}_2\text{OH}$, $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{CH}=\text{CHCON}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{R}^7$, CONR^5R^6 , CO_2H , Br, $\text{NHSO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, NHSO_2 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, $\text{SO}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$, 2-пиридил, 1-имидазолил или 1-метил-2-имидазозолил, R^5 и R^6 вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую, 4-гидроксипиперидиновую, морфолиновую, 4- CH^{11} -пиперазинильную или 2-метил-1-имидазолильную группу, R^7 представляет собой H или трет-бутил, R^9 и R^{10} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-карбамоилпиперидиновую или 4- $\text{M}(\text{P}^{12})$ -пиперазинильную группу; R^{11} представляет собой H, метил, бензил, 2-гидроксиэтил или ацетил; и R^{12} представляет собой H, 2-гидроксиэтил, C_1 - C_3 алкил или CSNH_2 .

12. Применение соединения по п.11, отличающееся тем, что в соединении формулы I R^1 представляет собой метил или этил; R^2 представляет собой п-пропил, R^3 представляет собой этил, н-пропил или аллил, R^4 представляет собой $\text{COCH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$, CONR^5R^6 или $\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ или 1-метил-2-имидазолил, R^5 и

R^6 вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют морфолиновую или 4- $\text{N}(\text{R}^{11})$ -пиперазинильную группу, R^9 и R^{10} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4- N^{12} -пиперазинильную группу, R^{11} представляет собой метил или ацетил, R^{12} представляет собой H, метил, 2-пропил или 2-гидроксиэтил.

13. Применение соединения по п.12, отличающееся тем, что соединение формулы I выбирают из

5-(2-этоксифенил)-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1]пиримидин-7она;

5-(5-морфолинацетил-2-н-пропoxифенил)-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1] пиримидин-7она;

5-[2-этоксифенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол [4,3-с)]пиримидин-7она;

5-[2-аллилокси-5-(4-метил-1-пиперазинилсульфонил)фенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1]пиримидин-7она;

5-{2-этоксифенил}-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с)]пиримидин-7она;

5-{2-этоксифенил}-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с^)]пиримидин-7она;

5-{5-[4-(2-гидроксиэтил)-1-пиперазинилсульфонил]-2-н-пропoxифенил}-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1]пиримидин-7она;

5-[2-этоксифенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол [4,3-с1]пиримидин-7она;

5-[2-этоксифенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол [4,3-с1] пиримидин-7она.

14. Способ лечения женской особи для лечения или предотвращения сексуальной дисфункции, который включает введение указанной самке до трех раз в день 5 - 75 мг соединения формулы I по любому из пп.9 - 13,

или его фармацевтически приемлемой соли, или фармацевтической композиции, содержащей это вещество.»

Против выдачи данного патента в Палату по патентным спорам в соответствии со статьей 1398 Кодекса было подано возражение, мотивированное несоответствием охраняемого изобретения условиям патентоспособности "промышленная применимость", "изобретательский уровень" и наличия в формуле изобретения признаков, отсутствовавших в первоначальных материалах заявки.

В возражении указаны следующие источники информации:

- патент EP № 463756 (далее- [D1]);
- патент EP № 526004 (далее- [D2]);
- The New England Journal of Medicine, 09.01.1992, vol. 326, no 2, 90-94 (далее- [D3]);
- Drug News and Perspectives, апрель 1993, № 6, стр. 3, 150-156 (далее- [D4]);
- Journal of American Geriatrics Society? апрель 1993, стр. 41, 363-366 (далее- [D5]);
- Tips, январь, 1991, стр. 12, 19-27 (далее- [D6]);
- Д.А. Харкевич. Фармакология. Москва, «Медицина», 1987г. (далее- [D7]);
- The Journal of Urology, июнь 1992, стр. 147, 1650-1655 (далее- [D8]);
- British Journal of Disease of Chest, 1983, стр. 77-86 (далее- [D9]);
- Энциклопедический словарь медицинских терминов, том 2, М., «Советская энциклопедия», 1983, стр. 320. (далее- [D10]);
- The Journal of Urology, апрель 1993, стр. 149, № 4(далее- [D11]);
- Impotence, 15.02.1993г., стр. 65-72(далее- [D12]);
- Pharm. Ther. № 51, 1991г., стр. 13-33(далее- [D13]);

- С.Кратохвил. Терапия функциональных сексуальных расстройств. М., «Медицина», 1985, стр. 12-15 (далее- [D14]);
- К. Имелинский. Сексология и сексопатология. М., «медицина», 1986, стр. 234-261(далее- [D15]);
- Решение Европейского патентного ведомства от 11.10.2001 (далее- [D16]);

В возражении отмечено, что в первоначальных материалах заявки отсутствуют признаки, касающиеся режимов введения соединений « формулы (1)» по пункту 6 формулы изобретения по оспариваемому патенту и ингибитора цГМФ ФДЭ по пункту 7 данной формулы изобретения, а именно "до трех раз в день".

В отношении несоответствия условию патентоспособности "промышленная применимость" отмечено следующее:

- в описании изобретения по оспариваемому патенту отсутствуют сведения, подтверждающие возможность использования различных соединений с разными по химической природе радикалами по п.1 формулы изобретения по оспариваемому патенту для реализации указанного назначения;

- применение групп соединений, указанных в пп.2-5 формулы изобретения по оспариваемому патенту также не реализуется, поскольку в первоначальных материалах заявки, по которым был выдан отечественный патент № 2130776 отсутствуют сведения, подтверждающие использование всех указанных соединений;

- не реализуется назначение по пунктам формулы 6, 7 и 8 формулы изобретения по оспариваемому патенту, поскольку патентообладателем не подтверждено использование именно любых соединений и ингибиторов цГМФ ФДЭ с различной химической структурой;

- не реализуется назначение по пунктам 9-14, поскольку в первичных материалах заявки отсутствуют сведения, объясняющие влияние соединений «формулы (1)» на этиопатогенез сексуальной дисфункции у женщин, в связи с чем, возможность применения этих соединений для лечения или профилактики женской сексуальной дисфункции по пп. 9-14 формулы изобретения по оспариваемому патенту не подтверждена.

В отношении несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности "изобретательский уровень" в возражении отмечено следующее.

В возражении отмечено, что изобретение по п. 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту основано на применении известного вещества (соединений «формулы (1)» по новому назначению - для лечения или профилактики эректильной дисфункции), которое обусловлено его известными свойствами (селективного ингибирования цГМФ ФДЭ) и известно, что именно такие свойства необходимы для реализации указанного назначения. Об этом, по мнению лица, подавшего возражение, свидетельствуют следующие данные:

- из источников Д1, Д2 известно пероральное применение соединений «формулы (1)» для лечения "...ряда заболеваний, включая стабильную и нестабильную стенокардию, гипертонию, застойную сердечную недостаточность, атеросклероз, состояния пониженной пропускной способности кровеносных сосудов, например постподкожную транслуминальную коронарную ангиопластику, заболевания периферийных сосудов, удар, бронхиты, хроническую астму, аллергическую астму, аллергические риниты, глаукому и те заболевания, которые характеризуются расстройствами подвижности кишечника, например, синдром кишечного раздражения" однократно

или многократно в течение дня в виде единичной дозы или нескольких дробных доз. Отличием изобретения по п.1 формулы оспариваемого патента от Д1 или Д2 является применение указанных соединений для лечения или профилактики дисфункции эрекции у животного-самца, включая человека.

- из источников Д3, Д4, Д8 известен селективный ингибитор цГМФ ФДЭ (запринаст), обеспечивающий эректильную функцию.

- из источников Д11 известно применение селективных ингибиторов ФДЭ для лечения эректильной дисфункции;

На основании вышесказанного лицом, подавшим возражение, сделан вывод о несоответствии изобретения по п.1 формулы изобретения по оспариваемому патенту оспариваемого патента условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В отношении несоответствия условию патентоспособности изобретения по п. 6 формулы изобретения по оспариваемому патенту в возражении отмечено следующее:

- из источников Д5, Д12 известен способ лечения сексуальной дисфункции пентоксифиллином, представляющим собой неселективный ингибитор ФДЭ с режимом дозирования 3 раза в день по 400 мг;

- отличительным признаком изобретения по оспариваемому патенту является использование селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ и дозировка (5-75 мг), которые, в свою очередь, известны из источников Д1- Д4, Д8, Д11.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, изобретение по п.6 формулы изобретения по оспариваемому патенту не соответствует условию патентоспособности "изобретательский уровень", поскольку оно основано на замене известного средства известной частью, присоединенной к нему по известным правилам для достижения

технического результата, в отношении которого установлено влияние именно такой замены.

В отношении изобретения по п. 7-8 формулы изобретения по оспариваемому патенту в возражении отмечено следующее:

- из источников Д5, Д12 известно оральное лечение импотенции неселективным ингибитором ФДЭ пентоксифиллина с режимом введения 3 раза в день по 400 мг. Признаками, которые отличают способ по п.7 от известного Д5, Д12 являются использование селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ или их фармацевтически приемлемых солей, известных из источников Д1, Д2, Д9. Что касается применения препаратов в дозировке "5-75 мг три раза в день", то, по мнению лица, подавшего возражение, патентообладателем не указан особый технический результат для данного количественного признака из известного из Д2 диапазона "2-400 мг несколько раз в день".

- из источников Д3, Д4, Д8, Д11 известно применение селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ для лечения и профилактики дисфункции эрекции.

Таким образом, лицо, подавшее возражение, считает, что изобретение по пп.7-8 формулы не соответствует условию патентоспособности "изобретательский уровень", поскольку оно основано на замене известного средства какой-либо известной частью, присоединенной к нему по известным правилам, для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно такой замены.

В отношении пп. 9-14 формулы изобретения по оспариваемому патенту в возражении отмечено следующее:

-учитывая известность из источника Д10 сходства физиологических процессов при эрекции мужских и женских половых органов, изобретения по пп. 9-14 с очевидностью вытекают из

источников Д1, Д2, поскольку они основаны на применении известного вещества - соединений «формулы (1)» по новому назначению, которое обусловлено его известными свойствами (селективного ингибирования цГМФ ФДЭ), и известно, что именно такие свойства необходимы для реализации этого назначения.

На основании изложенного лицо, подавшее возражение, просит признать патент Российской Федерации на изобретение № 2130776 недействительным полностью.

В адрес патентообладателя было направлено уведомление с приложением экземпляра вышеупомянутого возражения согласно пункту 3.1 Правил ППС.

От патентообладателя 06.04.2009 поступил отзыв на возражение, содержащий уточненную формулу изобретения в следующей редакции:

"Применение 5-[2-этокси-5-(4-метил-1-пиперазинилсульфонил)-фенил-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7н-пиразоло[4,3-d]пиримидин-7-она или его фармацевтически приемлемой соли для орального лечения эректильной дисфункции у мужчин."

По мнению патентообладателя, данная формула соответствует условиям патентоспособности "промышленная применимость" и "изобретательский уровень".

По мнению патентообладателя, в первоначальных материалах заявки, по которой был выдан оспариваемый патент представлены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в уточненной формуле изобретения, в связи с чем, изобретение соответствует условию патентоспособности "промышленная применимость".

В отзыве представлен анализ документов предшествующего уровня техники, приведенных в возражении. При этом, отмечено следующее:

- из источников Д1 и Д2 известны производные пиразолпиримидинона, однако их применение для лечения эректильной дисфункции не раскрыто, а связь между лечением заболеваний, указанных в данных источниках и лечением эректильной дисфункции в возражении не показана;

- в источниках Д3, Д4 отсутствуют сведения о том, что специфический ингибитор ФДЭ используют для лечения эректильной дисфункции, поскольку описанные в нем эксперименты проводились на ткани *in vitro*;

- в источниках Д5, Д6, Д12 упоминается о лечении половой дисфункции сосудистого генеза у мужчин с сосудистой недостаточностью полового члена пентоксифиллином, который является неселективным ингибитором ФДЭ, однако сведения о том, что пентоксифиллин является эффективным для лечения эректильной дисфункции посредством ингибирования ФДЭ отсутствуют;

- источники Д7, Д10, Д14, Д15 не имеют отношения к измененной формуле изобретения;

- в источнике Д8, отсутствуют сведения о введении ингибитора цГМФ ФДЭ орально;

- в источнике Д9 говорится об эффективности перорального введения запринаста при лечении астмы;

- источник Д11 описывает эксперименты *in vitro* при этом, не отмечено пероральное применение конкретного соединения селективных ингибиторов ФДЭ;

- в источнике Д13 отсутствует информация о применении селективного ингибитора ФДЭ при пероральном лечении эректильной дисфункции.

По мнению патентообладателя, в противопоставленных источниках отсутствуют обоснованные доказательства,

подтверждающие возможность оценки воздействия перорального ингибитора ФДЭ на сложные взаимодействия, ведущие к эрекции человека, методом экспериментального тестирования *in vitro*.

Далее по тексту в отзыве следует краткое изложение физиологии эрекции у мужчин, которая представляет собой сложное нейрососудистое явление с недостаточно изученным механизмом на дату приоритета оспариваемого патента, в связи с чем, как отмечено в отзыве "...лечение импотенции на дату приоритета оспариваемого патента было основано на различных концепциях, включая психосексологическую терапию, гормональную терапию, инъекцию в пещеристые тела средств, расслабляющих гладкие мышцы, или агенты, блокирующие альфа-норадренергические рецепторы, сосудистые вмешательства и другие."

В отзыве отмечено, что основой изобретения по оспариваемому патенту является NANC путь, при котором:

- в ответ на сексуальную стимуляцию генерируется оксид азота, с дальнейшим проникновением в клетки и активацией цитоплазматической гуанилат-циклазой, которая превышает ГТФ в цГМФ, вызывающей, в свою очередь, расслабление гладкомышечных клеток в пещеристых телах;

- расслабление гладкомышечных клеток в пещеристых телах вызывает наполнение пещеристых тел кровью, создавая эрекцию полового члена.

В отзыве отмечено, что до даты приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту из уровня техники не было известно, что селективный ингибитор ФДЭ будет эффективным в лечении эректильной дисфункции у мужчин. Изучение биологических процессов, ведущих к эрекции позволило патентообладателю сделать вывод о том, что для нормальной эректильной функции требуется

точный баланс между сокращением и расслаблением гладких мышц пещеристых тел. При этом, неожиданным для специалистов в данной области явилось то, что селективный ингибитор ФДЭ можно применять для лечения эректильной дисфункции, что и положено в основу изобретения по оспариваемому патенту. Кроме того, до даты приоритета оспариваемого патента для лечения импотенции использовали только инъекционные и психотерапевтические методы, что также было учтено при разработке данного изобретения.

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения возражения, Палата по патентным установила следующее.

С учетом даты приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту правовая база для оценки патентоспособности включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 №3517-1 (далее – Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, зарегистрированные в Минюсте РФ 21 января 1993 года, рег. № 121, утвержденные Роспатентом 20 сентября 1993 года (далее Правила ИЗ) и Правила ППС.

Согласно пункта 1 статьи 4 Закона изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

Уровень техники включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Согласно пункту 2 статьи 21 Закона, если заявителем представлены дополнительные материалы по заявке, в процессе экспертизы проверяется, не изменяют ли они сущность заявленного изобретения.

Дополнительные материалы изменяют сущность заявленного изобретения, если они содержат подлежащие включению в формулу изобретения признаки, отсутствовавшие в первоначальных материалах

заявки.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.1 Правил ИЗ изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.1 Правил ИЗ при установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения.

Проверяется также, описаны ли в первичных материалах заявки средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в независимом пункте формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в материалах заявки допустимо, чтобы указанные средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения.

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.1 Правил ИЗ если установлено, что на дату приоритета изобретения соблюдены все указанные требования, изобретение, охарактеризованное в данном независимом пункте формулы, признается соответствующим условию промышленной применимости.

Согласно подпункта 1 пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

В соответствии с подпунктом 2 пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение признается не следующим для специалиста явным образом из уровня техники, в том случае, когда не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния

отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно подпункта 1 пункта 19.5.3 проверка изобретательского уровня проводится в отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте формулы, и включает:

- определение наиболее близкого аналога ;
- выявление признаков, которыми отличается заявленное изобретение от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);
- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения.

Согласно подпункта 2 пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение признается соответствующим условию изобретательского уровня, если не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.3 Правил ИЗ не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные, в частности:

- на дополнении известного средства какой-либо известной частью (частями), присоединяемой (присоединяемыми) к нему по известным правилам, для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно таких дополнений;
- на замене какой-либо части (частей) известного средства другой известной частью для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно такой замены;
- на выполнении известного средства или его части (частей) из известного материала для достижения технического результата,

обусловленного известными свойствами этого материала;

- на создании средства, состоящего из известных частей, выбор которых и связь между которыми осуществлены на основании известных правил, рекомендаций и достигаемый при этом технический результат обусловлен только известными свойствами частей этого средства и связей между ними;

- на применении известного устройства, способа, вещества, штамма по новому назначению, если новое назначение обусловлено его известными свойствами, структурой, выполнением и известно, что именно такие свойства, структура, выполнение необходимы для реализации этого назначения.

Согласно подпункту 5 пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение не рассматривается как не соответствующее изобретательскому уровню из-за его кажущейся простоты и раскрытия в материалах заявки механизма достижения технического результата, если такое раскрытие стало известно не из уровня техники, а только из материалов заявки.

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.4 Правил ИЗ, если заявлена группа изобретений, проверка патентоспособности проводится в отношении каждого из входящих в нее изобретений. Патентоспособность группы может быть констатирована только тогда, когда патентоспособны все изобретения группы.

Согласно пункту 4.9 Правил ППС, при рассмотрении возражения против выдачи патента на изобретение коллегия палаты по патентным спорам вправе предложить патентообладателю внести изменения в формулу изобретения, если без указанных изменений оспариваемый патент должен быть признан недействительным полностью, а при их внесении - может быть признан недействительным частично.

Указанные изменения должны соответствовать изменениям формулы изобретения, которые предусмотрены правилами составления,

подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, действовавшими на дату подачи заявки.

Группе изобретений по оспариваемому патенту представлена правовая охрана в объеме признаков, содержащихся в независимых пунктах 1, 6, 7, 9, 14 формулы изобретения, приведенной выше.

Рассмотрев доводы лица, подавшего возражение, касающиеся наличия в формуле изобретения признаков, отсутствовавших в первоначальных материалах заявки коллегия палаты по патентным спорам установила следующее.

В формуле изобретения по оспариваемому патенту указаны признаки «до трех раз в день» (пункт 6 формулы) и «введение до трех раз в день от 5 до 75 мг ингибитора цГМФФДЭ» (пункт 7 формулы), которые, по мнению лица, подавшего возражение, отсутствуют в первоначальных материалах заявки.

На страницах 15, 16, 18 описания первоначальных материалов заявки, по которым был выдан патент № 2130776, указано: «У человека определенные наиболее предпочтительные соединения проверялись orally как в единичной дозе, так и при многократных приемах добровольцами...» и «Предпочтительной схемой приема лекарственного средства для типичного человека является от 5 до 75 мг соединения, три раза ежедневно». При этом, следует отметить, что назначение препарата «...как в единичной дозе, так и при многократных приемах...» включает в себя вариант его приема до трех раз в день. Кроме того, патентообладатель предлагает лечить дисфункцию эрекции у человека «...орально эффективным количеством ингибитора цГМФФДЭ...» (см. стр. 18 описания первоначальных материалов заявки).

Таким образом, не представляется возможным согласиться с мнением лица, подавшего возражение, что признаки «до трех раз в

день» (пункт 6 формулы) и «введение до трех раз в день от 5 до 75 мг ингибитора цГМФ ФДЭ» (пункт 7 формулы) отсутствовали в первоначальных материалах заявки.

Рассмотрев доводы лица, подавшего возражение, касающиеся несоответствия условию патентоспособности "промышленная применимость" группы изобретений, охарактеризованных совокупностью существенных признаков независимых пунктов 1, 6, 7, 9, 14 формулы изобретения по оспариваемому патенту установлено следующее.

Описание и формула оспариваемого патента, так же как и первоначальные материалы заявки, содержат назначение изобретения, а именно, независимые пункты 1, 6, 7, 9, 14 формулы изобретения содержат родовое понятие, отражающее назначение - «применение соединения общей формулы 1 (указанной в пункте 1 формулы изобретения) для лечения или предотвращения эректильной и сексуальной дисфункции», т.е. указано утилитарное назначение лекарственного препарата. В описании к оспариваемому патенту и в первоначальных материалах заявки указана область применения, к которой относится изобретение, а именно, "изобретения предусмотрены...для лечения дисфункции эрекции или мужской сексуальной дисфункции, ... для лечения женской сексуальной дисфункции, включая дисфункцию оргазма, связанную с клиторальными расстройствами...», следовательно, изобретение может быть использовано в области здравоохранения.

Далее в описании к патенту раскрыты средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения. А именно, в указанном

описании говорится о том, что соединения общей «формулы (1)», применяемой согласно независимому пункту 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту являются мощными селективными ингибиторами цГМФ ФДЭ. При этом, на стр. 4-6 описания первоначальных материалов заявки и оспариваемого патента указаны значения радикалов соединения (1), которые, как следует из данного описания были исследованы *in vitro*. В результате экспериментальных работ авторами изобретения по оспариваемому патенту было обнаружено, что предложенные соединения являются «мощными и селективными ингибиторами цГМФ – специфичной ФДЭ», а «расслабление ткани пещеристого тела и последующая эрекция пениса вызывается повышением уровней цГМФ в упомянутой ткани, на основании ингибирующей зависимости ФДЭ от соединений изобретения». В ходе исследования проверялось оральное применение указанных соединений. Кроме того, следует отметить, что все данные соединения по пунктам 1-5 формулы изобретения по оспариваемому патенту известны из уровня техники как обладающие одними и теми же свойствами – ингибированием цГМФ ФДЭ. Также показано в описании к оспариваемому патенту и первоначальных материалах заявки, что при помощи этого ингибирования возможно лечение эректильной дисфункции. При этом, в возражении не приведено данных, опровергающих возможность использования данных соединений для лечения дисфункции. В связи с изложенным, эффективность предложенных соединений при лечении эректильной дисфункции подтверждена.

О невозможности, по мнению лица, подавшего возражение, реализации назначения группы изобретений по пунктам 9-14 формулы, касающейся применения указанных соединений для лечения или

предотвращения сексуальной дисфункции у женщин, следует отметить, что в описании изобретения говорится о возможности их применения «...для лечения женской сексуальной дисфункции, включая дисфункцию оргазма, связанную с клиторными расстройствами». Кроме того, в результате переписки с экспертизой патентообладатель показал возможность использования соединения 5-[2 –этокси-5 (4-метил-1-пиперазинилсульфонил) - фенил-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразоло[4,3-d] пиримидин-7-она (силденафила) или его фармацевтически приемлемой соли у женщин, поскольку половая функция мужчин и женщин связана с одинаковыми лежащими в ее основе биохимическими процессами. А именно- сексуальное возбуждение у женщин, наряду с другими изменениями, вызывает кровенаполнение сосудов тазовой области, выделение влагалищной слизи, набухание наружных половых органов и эрекцию клитора. Те же самые эффекты оказывает силденафил на женщин.

Следовательно, соединения формулы, которые являются сильнодействующими и избирательными ингибиторами цГМФ ФДЭ, могут применяться в лечении сексуальной дисфункции как у мужчин, так и у женщин.

Таким образом, в соответствии с вышеизложенным, следует констатировать, что группа изобретений по независимым пунктам 1, 6, 7, 9, 14 формулы изобретения соответствуют условию патентоспособности "промышленная применимость".

Анализ доводов лица, подавшего возражение в отношении несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности "изобретательский уровень" показал следующее.

Техническим результатом изобретения по оспариваемому патенту является "расслабление ткани пещеристого тела и последующая эрекция

пениса за счет повышения уровней цГМФ в упомянутой ткани на основании ингибирующей зависимости ФДЭ соединений изобретения ".

В отношении изобретения по независимому пункту 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту анализ показал следующее.

Из уровня техники [D3] известно применение селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ для расслабления гладкой мускулатуры пещеристого тела с последующей эрекцией пениса.

Отличием изобретения по пункту 1 от [D3] является то, что для лечения или профилактики дисфункции эрекции у животного-самца, включая человека, применяют соединения «формулы (1)».

Из [D1], [D4], [D8] известны соединения общей «формулы (1)», представляющие собой селективные ингибиторы цГМФ ФДЭ, повышающие уровни цГМФ и применяемые для лечения состояния пониженной пропускной способности кровеносных сосудов.

Из [D11] известно существование ФДЭ в тканях пениса человека и воздействие различных ингибиторов ФДЭ на ее активность. Исследования, описанные в данном источнике подтверждают вовлеченность метаболизма циклических нуклеотидов в регуляцию тонуса гладкой мускулатуры пещеристого тела и применения этих ингибиторов для лечения эректильной дисфункции.

В данных источниках информации [D3], [D4], [D8], [D11] подтверждена возможность расслабления ткани пещеристого тела и последующей эрекции пениса за счет повышения уровней цГМФ в упомянутой ткани на основании ингибирующей зависимости ФДЭ соединений, т.е. возможность достижения технического результата, указанного в описании к оспариваемому патенту.

Таким образом, изобретение, охарактеризованное совокупностью существенных признаков пункта 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту основано на применении известного вещества (соединений «формулы (1)») для лечения или профилактики, которое обусловлено его известными свойствами (селективного ингибирования цГМФ ФДЭ). При этом, известно, что именно такие свойства необходимы для лечения эректильной дисфункции и возможности достижения того технического результата, на который претендует патентообладатель.

В связи с изложенным, можно согласиться с мнением лица, подавшего возражение о том, что изобретение по пункту 1 формулы оспариваемого патента не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», согласно подпункта 3 пункта 19.5.3 Правил ИЗ.

В отношении изобретения по независимому пункту 6 формулы изобретения по оспариваемому патенту анализ показал следующее.

Из уровня техники [D5] известен способ лечения и предотвращения сексуальной дисфункции при помощи использования пентоксифиллина, являющегося неселективным ингибитором ФДЭ 3 раза в день, который рассмотрен в качестве ближайшего аналога.

Отличием предложенного способа от известного заключается в использовании селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ (соединений общей формулы(1) или их фармацевтически приемлемой соли или композиции, содержащей это вещество, а также в размере дозы активного вещества (5-75 мг).

Из источников [D1], [D2] известны применения соединений формулы (1), их фармацевтически приемлемых солей и композиций

(селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ), содержащей это вещество в дозировке 2-400 мг для лечения и предотвращения сосудистых нарушений. Диапазон, указанный в изобретении оспариваемого патента входит в известный диапазон.

Из источников [D3], [D4] [D8], [D11] известно, что селективные ингибиторы цГМФ ФДЭ используют для лечения и профилактики дисфункции эрекции за счет повышения уровней цГМФ в ткани пещеристого тела на основании ингибирующей зависимости ФДЭ соединений.

Таким образом, можно согласиться с мнением лица, подавшего возражение о том, что изобретение по пункту 6 формулы оспариваемого патента не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», согласно подпункта 3 пункта 19.5.3 Правил ИЗ.

В отношении изобретения по независимому пункту 7 формулы изобретения по оспариваемому патенту анализ показал следующее.

Из уровня техники [D12] известен способ орального лечения импотенции путем применения неселективного ингибитора ФДЭ пентоксифиллина 3 раза в день по 400 мг.

Отличием предложенного изобретения от известного является использование селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ или их фармацевтически приемлемых солей, а также доза активного вещества (5-75 мг).

Из [D1] и [D2] известно применение в дозировке 2-400 мг активного соединения селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ или их фармацевтически приемлемых солей для лечения и предотвращения сосудистых нарушений. Однако, в данных источниках не раскрыта

возможность лечения эректильной дисфункции. При этом, связь между лечением сосудистых заболеваний и лечением эректильной дисфункции не показана.

Из источников [D3], [D4], [D8] и [D11] известна возможность использования селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ для лечения и профилактики дисфункции эрекции. Однако, данные источники не раскрывают возможность перорального введения специфического ингибитора ФДЭ 5-[2 –этокси-5 (4-метил-1-пиперазинилсульфонил) - фенил-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразоло[4,3-d] пиримидин-7-она (силденафила) для лечения и предотвращения эректильной дисфункции.

Таким образом, представленные данные, касающиеся применения специфического ингибитора ФДЭ 5-[2 –этокси-5 (4-метил-1-пиперазинилсульфонил) - фенил-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразоло[4,3-d] пиримидин-7-она (силденафила) в пероральной форме для лечения эректильной дисфункции у мужчин из уровня техники не известны. В возражении не приведено данных, опровергающих возможность использования их перорально, а неожиданный результат связан именно с пероральной формой употребления.

В связи с чем, доводы лица, подавшего возражение в отношении несоответствия одной из альтернатив по пункту 7 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «изобретательский уровень» неубедительны.

В отношении изобретений по независимым пунктам 9-14 формулы изобретения по оспариваемому патенту анализ показал следующее.

Данная группа изобретений основана на применении соединения «формулы (1)» или его фармацевтически приемлемой соли, или фармацевтической композиции, содержащей это соединение для лечения или профилактики сексуальной дисфункции у женской особи,

Из источника [Д10] известно, что клитор, как и пенис содержит пещеристое тело – анатомическое образование, аналогичное пещеристому телу мужского полового члена, в связи с чем, стоит согласиться с лицом, подавшим возражение, что расслабляя гладкую мускулатуру пещеристого тела женских половых органов, соединения «формулы 1» усиливают его кровоснабжение и делают возможной его эрекцию.

Учитывая известность из указанных выше документов [Д1],[Д3], [Д4], [Д8], [Д11] применения селективных ингибиторов цГМФ ФДЭ для лечения или предотвращения эректильной дисфункции у мужчин, а также схожие механизмы нейрососудистых явлений, ведущие к эрекции как у мужчин, так и у женщин можно согласиться с доводами лица, подавшего возражение о несоответствии изобретений по пунктам 9-14 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «изобретательский уровень».

На заседании коллегии от 14.04.2009 патентообладателю было предложено представить уточненную формулу изобретения в соответствии с пунктом 4.9 Правил ППС.

Измененная формула была представлена в следующей редакции.
«Применение 5-[2 –этокси-5 (4-метил-1-пиперазинилсульфонил)-фенил-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразоло[4,3-d] пиримидин-7-она или его фармацевтически приемлемой соли для орального лечения эректильной дисфункции у мужчин.»

Поскольку представленная измененная формула изобретения, удовлетворяет требованиям пункта 2 статьи 21 Закона, коллегия палаты по патентным спорам сочла возможным принять ее к рассмотрению.

Анализ измененной формулы показал, что в источниках информации, представленных лицом, подавшим возражение, не содержится сведений об известности орального лечения эректильной дисфункции у мужчин путем применения указанным в представленной патентообладателем уточненной формуле соединения 5-[2 –этокси-5 (4-метил-1-пиперазинилсульфонил) - фенил-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразоло[4,3-d] пиримидин-7-она (силденафила) или его фармацевтически приемлемой соли.

При этом, поскольку корректировка формулы изобретения по оспариваемому патенту была произведена правообладателем путем исключения неохраноспособных пунктов формулы и неохраноспособных альтернативных групп признаков, проведение дополнительного информационного поиска не требуется.

В отношении доводов лица, подавшего возражение, представленных в особом мнении от 16.04.2009 и касающихся: отклонения коллегией палаты по патентным спорам ходатайства о переносе даты заседания; не предоставления возможности для выступления в отношении патентоспособности уточненной правообладателем формулы изобретения изобретения, а также вынесения заключения без дополнительного информационного поиска по измененной формуле изобретения необходимо отметить следующее.

Отзыв от патентообладателя был представлен в палату по патентным спорам и лицу, подавшему возражение, до заседания коллегии. При этом, учитывая то, что патентообладатель согласился практически со всеми с доводами возражения и представил уточненную формулу изобретения по оспариваемому патенту, коллегия палаты по патентным спорам сочла

целесообразным и возможным рассмотреть упомянутое возражение на данном заседании в назначенное время.

При рассмотрении по существу упомянутого возражения было предоставлено время для выступления как лицу, подавшему возражение, так и патентообладателю.

Что касается необходимости, по мнению лица, подавшего возражение, дополнительного информационного поиска по измененной формуле изобретения, то данный довод был рассмотрен выше.

Учитывая изложенное, Палата по патентным спорам решила:

удовлетворить возражение от 25.09.2008, патент Российской Федерации № 2130776 признать недействительным частично и выдать новый патент Российской Федерации с уточненной формулой изобретения.