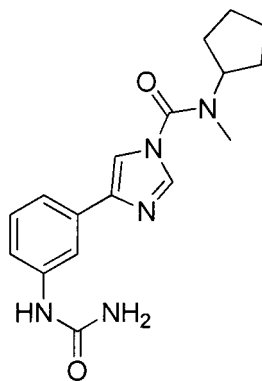


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии палаты по патентным спорам
по результатам рассмотрения ☒ возражения ☐ заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01.01.2008 Федеральным законом от 18.12.2006 № 231-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации и отдельные законодательные акты Российской Федерации» и 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 поступившее 15.07.2021 от БИАЛ - ПОРТЕЛА ЭНД Ка, С.А., Португалия (далее – заявитель) возражение на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее Роспатент) от 16.12.2020 об отказе в выдаче патента Российской Федерации на изобретение по заявке № 2016133457, при этом установлено следующее.

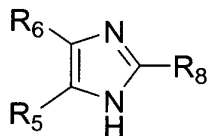
Заявлена группа изобретений «Способ синтеза замещенных соединений мочевины», которая охарактеризована в формуле изобретения, представленной в корреспонденции, поступившей 22.10.2020, в следующей редакции:

«1. Способ получения соединения формулы А:



Формула А

или его фармацевтически приемлемой соли,
включающий взаимодействие имидазолильного промежуточного соединения формулы IIa'



Формула IIa'

с карбамоилгалогенидом формулы: R₁R₂NC(=O)Hal, где Hal представляет собой Cl, F, I или Br,

где промежуточное соединение формулы IIa' получают путем окисления производного R₅ и R₆, R₆-C(=O)CH₂R₅ с получением промежуточного соединения глиоксаля R₆-C(=O)(C=O)R₅, которое подвергают обработке гидроксидом аммония и альдегидом R₈CHO с получением промежуточного соединения формулы IIa';

где R₆ представляет собой NH₂CONH-фенил или нитрофенильный, аминифенильный или амино-защищенный аминифенильный предшественник этой группы, который может быть подвергнут превращению в NH₂CONH-фенильную группу после образования мочевины, R₅ представляет собой H, R₈ представляет собой H, R₁ представляет собой метил и R₂ представляет собой цикlopентил,

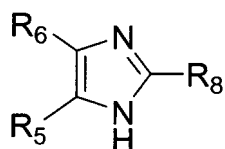
где при окислении производного R₅ и R₆ используют неорганическую кислоту, и, когда R₆ представляет собой нитрофенил, указанный нитрофенил превращают в аминифенил и полученный аминифенил затем превращают в NH₂CONH-фенильную группу, и, когда R₆ представляет собой аминифенил, указанный аминифенил превращают в NH₂CONH-фенильную группу.

2. Способ по п. 1, где неорганическая кислота представляет собой HX, где X представляет собой атом галогена.

3. Способ по п. 2, где неорганическая кислота представляет собой HCl или HBr.

4. Способ по любому из пп. 1-3, где ДМСО (диметилсульфоксид) используют в качестве растворителя и окисляющего агента при окислении производного R₅ и R₆.

5. Способ получения имидазолильного промежуточного соединения формулы IIa':



Формула IIa'

или его фармацевтически приемлемой соли, включающий окисление производного R5 и R6, R6-C(=O)CH₂R5, с получением промежуточного соединения глиоксаля R6-C(=O)(C=O)R5, которое подвергают обработке гидроксидом аммония и альдегидом R8CHO с получением промежуточного соединения формулы IIa',

где R5, R6 и R8 являются такими, как определено в п. 1,

и где промежуточное соединение формулы IIa' выделяют из реакционной смеси с использованием растворителя, содержащего бутанол.

6. Соединение, имеющее формулу R6(C=O)(C=O)R5, где R5 представляет собой H и R6 представляет собой мета-NH₂CONH-фенил или мета-аминофенил.

7. Способ получения соединения формулы A, как определено в п. 1, или его фармацевтически приемлемой соли, включающий взаимодействие промежуточного соединения формулы IIa', как определено в п. 1, с карбамоилгалогенидом формулы R1R2NC(=O)Hal в растворителе, состоящем по существу из пиридина, где R6 представляет собой NH₂CONH-фенил или нитрофенильный, аминафенильный или амина-защищенный аминафенильный предшественник этой группы, который может быть подвергнут превращению в NH₂CONH-фенильную группу после образования мочевины, и R5 представляет собой H, R1 представляет собой метил и R2 представляет собой циклопентил, и где Hal представляет собой Cl, F, I или Br,

и дополнительно включающий обработку смеси продуктов водой после образования мочевины,

где при окислении производного R5 и R6 используют неорганическую кислоту, и, когда R6 представляет собой нитрофенил, указанный нитрофенил превращают в аминафенил и полученный аминафенил затем превращают в NH₂CONH-фенильную группу, и, когда R6 представляет собой аминафенил, указанный аминафенил превращают в NH₂CONH-фенильную группу.

8. Способ по п. 7, дополнительно включающий обработку смеси продуктов C₅₋₁₀ алканом или их смесями после образования мочевины.

9. Способ по п. 8, где C₅₋₁₀ алкан включает гептан.

10. Способ по любому из пп. 8-9, где карбамоилгалогенид представляет собой карбамоилхлорид».

По результатам проведения экспертизы по существу Роспатентом было принято решение об отказе в выдаче патента из-за несоответствия заявленной группы изобретений условию патентоспособности «промышленная применимость».

Данное решение мотивировано тем, что для группы изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1, 5 и 6 формулы (в части получения промежуточного соединения глиоксаля формулы R₆-C(=O)(C=O)R₅, а также его последующего использования в синтезе промежуточного соединения формулы (IIa') и целевого соединения формулы A), примеры осуществления не проиллюстрированы в материалах заявки соответствующим образом. Так, в решении Роспатента отмечено, что соединение глиоксаля является новым промежуточным соединением и для него не приведены сведения о его получении и переработке в конечный продукт.

В отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 7 формулы, раскрывающем способ получения соединения формулы A без использования в качестве промежуточного соединения упомянутого выше глиоксаля, в решении Роспатента сделан вывод о его соответствии всем условиям патентоспособности.

На решение об отказе в выдаче патента на изобретение в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса поступило возражение, в котором отмечено следующее.

Заявителем в ходе делопроизводства по заявке, в корреспонденциях от 11.03.2020 и 22.10.2020 были представлены пояснения, согласно которым схема реакции под заголовком «3. Синтез промежуточного соединения формулы IIa' из промежуточного соединения глиоксаля» на с. 29 описания раскрывает получение

соединения формулы Pa' через промежуточное соединение глиоксаля R6-(C=O)(C=O)R5 . При этом заявитель отмечает, что хотя в этом примере конкретно не описывается использование выделенного соединения формулы Pa' для получения соединения формулы A , другие примеры, представленные в описании, показывают превращение соединения формулы Pa' в соединение формулы A (см., в частности, общую схему синтеза 2 на с. 24 описания или раскрытие реакций после схемы, приведенной на с. 32 описания). Таким образом, по мнению заявителя, специалист в данной области техники сможет объединить раскрытие двух или более разных примеров для осуществления заявленного изобретения.

Заявитель делает вывод о том, что в описании изобретения приведено достаточно сведений, которые позволяют специалисту в данной области техники получить промежуточное соединение глиоксаля вышеуказанной формулы. Пути синтеза описаны в заявке, и специалисту понятно, что соединение по независимому пункту 6 формулы может быть продуктом, образующимся в ходе синтеза.

Для ускорения делопроизводства заявитель представил вместе с возражением скорректированную формулу, в которой пункты 1-6 предыдущей редакции формулы исключены, то есть предлагаемый объем правовой охраны, ограничен до изобретения по независимому пункту 7, которое, как отмечено в решении Роспатента, признано патентоспособным.

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения возражения, коллегия установила следующее.

С учетом даты подачи заявки (15.08.2016) правовая база включает Гражданский кодекс в редакции, действовавшей на дату подачи заявки (далее – Кодекс), Правила составления, подачи и рассмотрения документов, являющихся основанием для совершения юридически значимых действий по государственной регистрации изобретений, и их формы (далее – Правила ИЗ), утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 №42800, Требования к документам

заявки на выдачу патента на изобретение (далее – Требования ИЗ), утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 №42800 и Правила 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.

В соответствии с пунктом 1 статьи 1350 Кодекса изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

В соответствии с пунктом 4 статьи 1350 Кодекса изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении, других отраслях экономики или в социальной сфере.

В соответствии с пунктом 66 Правил ИЗ при проверке промышленной применимости изобретения устанавливается, может ли изобретение быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении, других отраслях экономики или в социальной сфере.

При установлении возможности использования изобретения в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях экономики или в социальной сфере проверяется, возможна ли реализация назначения изобретения при его осуществлении по любому из пунктов формулы изобретения, в частности, не противоречит ли заявленное изобретение законам природы и знаниям современной науки о них.

В соответствии с пунктом 67 Правил ИЗ если установлено, что реализация указанного заявителем назначения изобретения при его осуществлении по любому из пунктов формулы изобретения возможна и не противоречит законам природы и знаниям современной науки о них, изобретение признается соответствующим условию промышленной применимости.

В соответствии с пунктом 68 Правил ИЗ в случае если изобретение не соответствует условию промышленной применимости, проверка новизны и изобретательского уровня не проводится.

В соответствии с подпунктом 1 пункта 47 Требований ИЗ для подтверждения возможности осуществления изобретения, относящегося к химическому соединению с установленной структурой, приводятся структурная формула, доказанная известными методами, физико-химические константы, описывается способ, которым соединение получено, и показывается возможность использования изобретения по указанному назначению.

В соответствии с подпунктом 7 пункта 47 Требований ИЗ если изобретение относится к промежуточному соединению, показывается также возможность его переработки в известный конечный продукт либо возможность получения из него нового конечного продукта с конкретным назначением или биологической активностью.

В соответствии с подпунктом 3 пункта 49 Требований ИЗ для подтверждения возможности осуществления изобретения, относящегося к способу при использовании в способе неизвестных веществ раскрывается способ их получения.

В соответствии с подпунктом 4 пункта 53 Требований ИЗ при составлении формулы изобретения признаки изобретения должны быть выражены в формуле изобретения таким образом, чтобы обеспечить возможность понимания их смыслового содержания на основании уровня техники специалистом в данной области техники.

Согласно пункту 39 Правил ППС в рамках рассмотрения возражения лицо, подавшее возражение, вправе ходатайствовать об изменении испрашиваемого объема правовой охраны изобретения, при условии, если испрашиваемые изменения могут устранить причины, препятствующие предоставлению правовой охраны заявленному объекту, либо в случае, если без внесения соответствующих изменений в предоставлении правовой охраны должно быть отказано в полном объеме, а при их внесении – частично.

Существо заявленной группы изобретений выражено в приведенной выше формуле.

Анализ доводов, содержащихся в возражении и решении Роспатента, с учетом материалов заявки, касающихся оценки соответствия заявленной группы изобретений по независимым пунктам 1, 5 и 6 формулы условию патентоспособности «промышленная применимость», показал следующее.

Заявленные способы по независимым пунктам 1 и 5 формулы включают в себя стадию получения промежуточного соединения глиоксаля формулы $R6-C(=O)(C=O)R5$. Изобретение по независимому пункту 6 относится к тому же промежуточному соединению глиоксаля формулы $R6-C(=O)(C=O)R5$. Указанное соединение, согласно описанию изобретения и доводам заявителя, изложенным в корреспонденциях от 11.03.2020 и 22.10.2020, представленным в ходе проведения экспертизы по существу, является новым промежуточным соединением.

Следует согласиться с мнением, изложенным в решении Роспатента о том, что в материалах заявки сведения, достаточные для подтверждения факта получения неизвестного средства, а именно соединения глиоксаля формулы $R6-C(=O)(C=O)R5$, и его переработки в конечный известный продукт, соответствующий соединению формулы А, отсутствуют.

В отношении доводов заявителя, изложенных в корреспонденции от 11.03.2020, которая упомянута в возражении, необходимо отметить, что на схеме на с.29 описания изобретения отсутствует указание на получение промежуточного глиоксаля формулы $R6-C(=O)(C=O)R5$. Кроме того, словесное описание схемы синтеза также не предполагает получение каких-либо промежуточных соединений.

Кроме того, на приведенных на с.24 и с.32 описания изобретения общих схемах отсутствует какое-либо упоминание о возможности получения в процессе синтеза промежуточного соединения глиоксаля формулы $R6-C(=O)(C=O)R5$, где R6 представляет собой NH_2CONH -фенил или нитрофенильный, аминифенильный или амино-защищенный аминифенильный предшественник этой группы, который может быть подвергнут превращению в NH_2CONH -фенильную группу после образования мочевины, и R5 представляет собой H.

При этом необходимо отметить, что в корреспонденции заявителя от 22.10.2020, которая упомянута в возражении, отсутствуют какие-либо доводы или пояснения технического характера в отношении промежуточного соединения глиоксаля формулы $R6-C(=O)(C=O)R5$, его получения и использования в синтезе целевого соединения А.

Таким образом, следует согласиться с мнением, изложенным в решении Роспатента, о том, что совокупность признаков, характеризующих изобретения по независимым пунктам 1, 5 и 6 формулы, раскрывающие промежуточное соединение глиоксаля формулы $R6-C(=O)(C=O)R5$, а также его последующее использование в синтезе промежуточного соединения формулы (Па') и целевого соединения формулы А, не описана в материалах заявки таким образом, чтобы позволить осуществить упомянутые изобретения и соответственно реализовать назначения данных изобретений.

В соответствии с изложенным необходимо констатировать, что решение Роспатента принято правомерно.

Что касается изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 7 формулы, то в отношении него в решении Роспатента указано, что данное изобретение соответствует всем условиям патентоспособности, предусмотренным пунктом 1 статьи 1350 Кодекса.

В подтверждении данного мнения, на заседании коллегии, состоявшемся 09.09.2021, представителем экспертного отдела был представлен отчет о проведении информационного поиска в отношении изобретения по независимому пункту 7 формулы. В пояснениях к поиску отмечено, что в уровне техники не было выявлено источников информации порочащих новизну и изобретательский уровень способа по независимому пункту 7 формулы. В соответствии с изложенным в пояснении повторно сделан вывод о том, что изобретение по независимому пункту 7 формулы соответствует условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень» (пункт 1 статьи 1350 Кодекса).

Таким образом, необходимо констатировать, что не выявлено препятствий для выдачи патента Российской Федерации на изобретение, охарактеризованное в представленной заявителем уточненной формуле, представленной 15.07.2021.

Учитывая вышеизложенное, коллегия пришла к выводу о наличии оснований для принятия Роспатентом следующего решения:

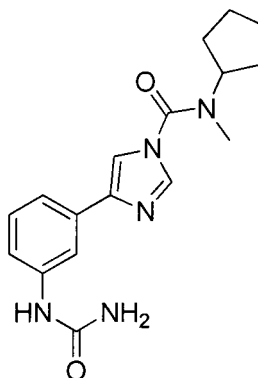
удовлетворить возражение, поступившее 15.07.2021, отменить решение Роспатента от 16.12.2020 и выдать новый патент Российской Федерации на изобретение с формулой, поступившей 15.07.2021.

(21) 2016133457

(51) МПК

C07D 233/61 (2006.01)

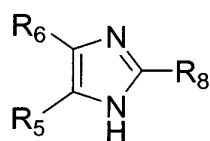
(57) «1. Способ получения соединения формулы А,



Формула А

или его фармацевтически приемлемой соли,

включающий взаимодействие промежуточного соединения формулы IIa',



Формула IIa'

с карбамоилгалогенидом формулы $R_1R_2NC(=O)Hal$ в растворителе, состоящем по существу из пиридина, где R_6 представляет собой NH_2CONH -фенил или нитрофенильный, аминфенильный или амино-защищенный аминфенильный предшественник этой группы, который может быть подвергнут превращению в NH_2CONH -фенильную группу после образования мочевины, и R_5 представляет собой H, R_1 представляет собой метил и R_2 представляет собой цикlopентил, и где Hal представляет собой Cl, F, I или Br,

и дополнительно включающий обработку смеси продуктов водой после образования мочевины,

где при окислении производного R5 и R6 используют неорганическую кислоту, и, когда R6 представляет собой нитрофенил, указанный нитрофенил превращают в аминифенил и полученный аминифенил затем превращают в NH₂CONH-фенильную группу, и, когда R6 представляет собой аминифенил, указанный аминифенил превращают в NH₂CONH-фенильную группу.

2. Способ по п. 1, дополнительно включающий обработку смеси продуктов C₅₋₁₀ алканом или их смесями после образования мочевины.

3. Способ по п. 2, где C₅₋₁₀ алкан включает гептан.

4. Способ по любому из пп. 2-3, где карбамоилгалогенид представляет собой карбамоилхлорид».

(56) US 4602927 A, 29.07.1986;

US 2010036121 A1, 11.02.2010;

US 4859691 A, 22.08.1989;

WO 2010074588 A2, 01.07.2010.