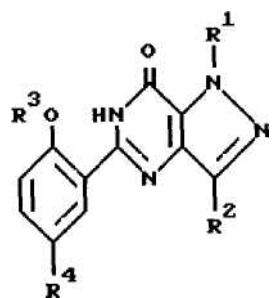


Палата по патентным спорам в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части 4 Гражданского кодекса Российской Федерации, введённой в действие с 01.01.2008 в соответствии с Федеральным законом от 18.12.2006 № 231-ФЗ (далее - Кодекс), и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате 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 Ратиофарм ГмбХ, Германия (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее в палату по патентным спорам 22.12.2008, против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2130776, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2130776 на группу изобретений 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 на имя Пфайзер Айэлэнд Фармасьютикалз, ИЕ (далее – патентообладатель).

Формула изобретения по патенту № 2130776:

«1. Применение соединения формулы I:



где R<sup>1</sup> представляет собой H, C, - C<sub>3</sub>алкил, C, - C<sub>3</sub>перфторалкил или C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> циклоалкил;

$R^2$  представляет собой H, C, -C<sub>3</sub>алкил, необязательно замещенный C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>циклоалкилом, C, -C<sub>3</sub>перфторалкил или C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>циклоалкил;

$R^3$  представляет собой C, -C<sub>6</sub>алкил, необязательно замещенный C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>циклоалкилом, C,-Cсперфторалкил или C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub>циклоалкил, C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>алкенил или C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>алкинил;

$R^4$  представляет собой C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>алкил, необязательно замещенный OH, NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CN, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> или CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>алкенил, необязательно замещенный CN, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> или CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>алканоил, необязательно замещенный NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, (гидрокси)C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>алкил, необязательно замещенный NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, (C<sub>2</sub> -C<sub>3</sub>алкокси)C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>алкил, необязательно замещенный OH или NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, галоген, NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, NSO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, NSO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup> или фенил, пиридинил, 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<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>алкил, или вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пирролидинильную, пиперидиновую, морфолиновую, 4-(N(R)-пiperазинильную или имидазолильную группу, где упомянутая группа необязательно замещена метилом или OH;

$R^7$  представляет собой H или C, -C<sub>4</sub>алкил;

$R^8$  представляет собой C, -C<sub>3</sub>алкил, необязательно замещенный NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>;

$R^9$  и  $R^{10}$  вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пирролидинильную, пиперидиновую, морфолиновую или 4-1Ч<sup>12</sup>)-пiperазинильную группу, где указанная группа необязательно замещена C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>алкилом, C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>алкокси, NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> или CONR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>;

$R^{11}$  представляет собой H, C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>алкил, необязательно замещенный фенилом, (гидрокси)C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub>алкил или C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>алканоил;

$R^{12}$  представляет собой H, C, - C<sub>6</sub>алкил, (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>алкокси) C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>алкил, (гидрокси)C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>алкил, ( $R^{13}R^{14}N$ )C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>алкил, ( $R^{13}R^{14}NOC$ )C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>алкил, CONR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, CSNR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> или C(NH)NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>;

$R^{13}$  и  $R^{14}$  представляют собой каждый независимо H, C, - C<sub>4</sub>алкил, (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>алкокси)C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>алкил или (гидрокси)C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>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<sub>3</sub>алкил,  $R^3$  представляет собой C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>алкил или аллил,  $R^4$  представляет собой C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>алкил, необязательно замещенный OH, NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CN, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> или CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, ацетил, необязательно замещенный NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, гидроксиэтил, необязательно замещенный NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, этоксиметил, необязательно замещенный OH или NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CH = CHCN, CH = CHCONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CH = CHCO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CO<sub>2</sub>H, Br, NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, NHSO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, NHSO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, или пиридин или имидазолил, любой из которых необязательно замещен метилом, R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> представляют собой каждый независимо H, метил или этил, или вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую, морфолиновую, 4-1\1<sup>11</sup>)-пиперазинильную или имидазолильную группу, где указанная группа необязательно замещена метилом или OH, R<sup>7</sup> представляет собой H или трет-бутил, R<sup>8</sup> представляет собой метил или CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, R<sup>9</sup> и R<sup>10</sup> вместе

с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую или 4-1\|(P<sup>12</sup>)-пiperазинильную группу, где указанная группа необязательно замещена NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> или CONR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>; R<sup>11</sup> представляет собой H, метил, бензил, 2-гидроксиэтил или ацетил, R<sup>12</sup> представляет собой H, C, - C<sub>3</sub>алкил, (гидрокси)C<sub>2</sub> - C<sub>3</sub>алкил, CSNR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> или C-(NH)NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, R<sup>13</sup> и R<sup>14</sup> представляют собой каждый независимо H или метил.

3. Применение соединения по п.2, отличающееся тем, что в соединении формулы I R<sup>1</sup> представляет собой метил или этил, R<sup>2</sup> представляет собой C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>алкил, R<sup>3</sup> представляет собой этил, H-пропил или аллил, R<sup>4</sup> представляет собой CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, COCH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CH(OH)-CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>- осн<sub>2</sub>сн<sub>2</sub>он, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CH=CHCON(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH=CHCO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CO<sub>2</sub>H, Br, NHSO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, NHSO<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, 2-пиридинил, 1-имидазолил или 1-метил-2-имидазолил, R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую, 4-гидроксипиперидиновую, морфолиновую, 4-1\|1(P<sup>11</sup>)-пiperазинильную или 2-метил-1-имидазолильную группу, R<sup>7</sup> представляет собой H или трет-бутил, R<sup>9</sup> и R<sup>10</sup> вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-карбамоилпиперидиновую или 4-1Ч(P<sup>12</sup>)-пiperазинильную группу; R<sup>11</sup> представляет собой H, метил, бензил, 2-гидроксиэтил или ацетил; и R<sup>12</sup> представляет собой H, 2-гидроксиэтил, C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>алкил или CSNH<sub>2</sub>.

4. Применение соединения по п. 3, отличающееся тем, что в соединении формулы I R<sup>1</sup> представляет собой метил или этил; R<sup>2</sup> представляет собой п-пропил, R<sup>3</sup> представляет собой этил, н-пропил или аллил, R<sup>4</sup> представляет собой COCH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CONR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> или 1-

метил-2-имидаэолил, R<sup>5</sup> и R<sup>6</sup> вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют морфолиновую или 4-N(R<sup>11</sup>)-пiperазинильную группу, R<sup>9</sup> и R<sup>10</sup> вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-N<sup>12</sup>-пiperазинильную группу, R<sup>11</sup> представляет собой метил или ацетил, R<sup>12</sup> 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-этокси-5-морфолинацетилфенил)-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-этокси-5-(4-метил-1-пiperазинилсульфонил)фенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол [4,3-с1]пиримидин-7она;

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

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

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

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

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

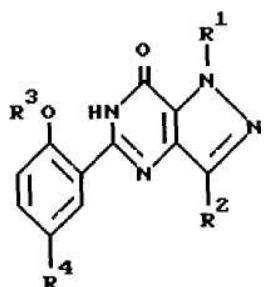
5-[2-этокси-5-(1-метил-2-имидазолил)фенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол[4,3-с1] пиrimидин-7она.

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<sup>1</sup> представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>перфоралкил или C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>циклоалкил;

R<sup>2</sup> представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил, необязательно замещенный C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>перфторалкил, или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил;

R представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил, необязательно замещенный C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>перфторалкил, или C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>циклоалкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкенил, или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкинил;

$R^4$  представляет собой С, -  $C_4$ алкил, необязательно замещенный OH,  $NR^5R^6$ , CN,  $CONR^5R^6$  или  $CO_2R^7$ ,  $C_2$  -  $C_4$ алкенил, необязательно замещенный CN,  $CONR^5R^6$  или  $CO_2R^7$ ,  $C_2$  - С.алканоил, необязательно замещенный  $NR^5R^6$ , (гидрокси) $C_2$  -  $C_4$ алкил, необязательно замещенный  $NR^5R^6$ , ( $C_2$  - $C_3$ алкокси) $C_1$  -  $C_2$ алкил, 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, пиридинил, пиrimидинил, имидазолил, оксазолил, тиазолил, тиенил или триазолил, любой из которых необязательно замещен метилом;

$R^5$  и  $R^6$  представляют собой каждый независимо H или С, -  $C_4$ алкил, или вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пирролидинильную, пиперидиновую, морфолинову, 4-( $N(R^{11})$ -пiperазинильную или имидазолильную группу, где упомянутая группа необязательно замещена метилом или OH;

$R^7$  представляет собой H или С, -  $C_4$ алкил;

$R^8$  представляет собой С, -  $C_3$ алкил, 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( $P^{12}$ )-пiperазинильную группу, где указанная группа необязательно замещена С, -  $C_4$ алкилом, С, -  $C_3$ алкокси,  $NR^{13}R^{14}$  или  $CONR^{13}R^{14}$ ;

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

$R^{12}$  представляет собой H, С, -  $C_6$ 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, ( $R^{13}R^{14}NO$ ) $C_1$

-  $C_6\text{алкил}$ ,  $\text{CONR}^{13}\text{R}^{14}$ ,  $\text{CSNR}^{13}\text{R}^{14}$  или  $\text{C}(\text{NH})\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ ; и  $\text{R}^{13}$  и  $\text{R}^{14}$  представляют собой каждый независимо  $\text{H}$ ,  $\text{C}$ , -  $\text{C}_4\text{алкил}$ ; ( $\text{C}_1$  -  $\text{C}_3\text{алкокси}$ ) $\text{C}_2$  -  $\text{C}_4\text{алкил}$ ; или (гидрокси) $\text{C}_2$  -  $\text{C}_4\text{алкил}$ ;

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  $\text{R}^1$  представляет собой  $\text{H}$ , метил или этил;  $\text{R}^2$  представляет собой  $\text{C}_1$  -  $\text{C}_3\text{алкил}$ ;  $\text{R}^3$  представляет собой  $\text{C}_2$  -  $\text{C}_3\text{алкил}$  или аллил;  $\text{R}^4$  представляет собой  $\text{C}$ , -  $\text{C}_2\text{алкил}$ , необязательно замещенный  $\text{OH}$ ,  $\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{CN}$ ,  $\text{CONR}^5\text{R}^6$  или  $\text{CO}_2\text{R}^7$ , ацетил, необязательно замещенный  $\text{NR}^5\text{R}^6$ , гидроксиэтил, необязательно замещенный  $\text{NR}^5\text{R}^6$ , этоксиметил, необязательно замещенный  $\text{OH}$  или  $\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{CH} = \text{CHCN}$ ,  $\text{CH} = \text{CHCONR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{CH} = \text{CHCO}_2\text{R}^7$ ,  $\text{CONR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{CO}_2\text{H}$ ,  $\text{Br}$ ,  $\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{NHSO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{NHSO}_2\text{R}^8$ ,  $\text{SO}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$ , или пиридинил или имидазолил, любой из которых необязательно замещен метилом;  $\text{R}^5$  и  $\text{R}^6$  представляют собой каждый независимо  $\text{H}$ , метил или этил, или вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую, морфолиновую, 4-1Ч( $\text{P}^{11}$ )-пiperазинильную или имидазолильную группу, где указанная группа необязательно замещена метилом или  $\text{OH}$ ;  $\text{R}^7$  представляет собой  $\text{H}$  или трет-бутил;  $\text{R}^8$  представляет собой метил или  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ;  $\text{R}^9$  и  $\text{R}^{10}$  вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую или 4-г\1( $\text{P}^{12}$ )-пiperазинильную группу, где указанная группа необязательно замещена  $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$  или  $\text{CONR}^{13}\text{R}^{14}$ ;  $\text{R}^{11}$  представляет собой  $\text{H}$ , метил, бензил, 2-гидроксиэтил или ацетил,  $\text{R}^{12}$  представляет собой  $\text{H}$ ,  $\text{C}$ , -  $\text{C}_3\text{алкил}$ , (гидрокси) $\text{C}_2$  -  $\text{C}_3\text{алкил}$ ,

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

11. Применение соединения по п.10, отличающееся тем, что в соединении формулы I  $\text{R}^1$  представляет собой метил или этил,  $\text{R}^2$  представляет собой С, - С<sub>3</sub>алкил,  $\text{R}^3$  представляет собой этил, Н-пропил или аллил,  $\text{R}^4$  представляет собой  $\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{COCH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ,  $\text{CH}_2-$  осн<sub>2</sub>сн<sub>2</sub>он,  $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{CH}=\text{CHCON}(\text{CH}_3)_2$ ,  $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{R}^7$ ,  $\text{CONR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{CO}_2\text{H}$ , Br,  $\text{NHSO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{NHSO}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{SO}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$ , 2-пиридинил, 1-имидаэолил или 1-метил-2-имидаэозолил,  $\text{R}^5$  и  $\text{R}^6$  вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют пиперидиновую, 4-гидроксипиперидиновую, морфолиновую, 4-1Ч<sup>11</sup>)-пиперазинильную или 2-метил-1-имидаэолильную группу,  $\text{R}^7$  представляет собой Н или трет-бутил,  $\text{R}^9$  и  $\text{R}^{10}$  вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 4-карбамоилпиперидиновую или 4-1М(Р<sup>12</sup>)-пиперазинильную группу;  $\text{R}^{11}$  представляет собой Н, метил, бензил, 2-гидроксиэтил или ацетил; и  $\text{R}^{12}$  представляет собой Н, 2-гидроксиэтил, С<sub>1</sub> - С<sub>3</sub>алкил или CSNH<sub>2</sub>.

12. Применение соединения по п.11, отличающееся тем, что в соединении

формулы I  $\text{R}^1$  представляет собой метил или этил;  $\text{R}^2$  представляет собой п-пропил,  $\text{R}^3$  представляет собой этил, н-пропил или аллил,  $\text{R}^4$  представляет собой  $\text{COCH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ,  $\text{CONR}^5\text{R}^6$  или  $\text{SO}_2\text{NR}^5\text{R}^6$  или 1-метил-2-имидаэолил,  $\text{R}^5$  и

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

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

5-(2-этокси-5-морфолинацетилфенил)-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-этокси-5-(4-метил-1-пiperазинилсульфонил)фенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразол [4,3-с)]пиримидин-7она;

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

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

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

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

5-[2-этокси-5-(4-метил-1-пiperазинилкарбонил)-фенил]-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.

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 пунктов 9,14 формулы изобретения по оспариваемому патенту условиям патентоспособности "промышленная применимость", пунктов 1,6,7 указанной формулы "изобретательский уровень", а также наличием в данной формуле изобретения признака, отсутствовавшего в первоначальных материалах заявки.

В возражении указаны следующие источники информации:

- патент ЕР № 463756 (далее- [D1]);
- патент ЕР № 526004 (далее- [D2]);
- Kenneth J. Murrau. Phosphodiesterase Va Inhibitors. DNGP 6(3), April, 1993(далее- [D3]);
- John E. Mrley. Management of impotence. Postgraduate Medicine. Impotence. Vol. 93, No 3, 65-72. February 15, 1993 (далее- [D4]);
- A. Taher, C. G. Stief, M.Raida, U. Jonas, W.G.Forssmann. Cyclic nucleotide phosphodiesterase activity in human cavernous smooth muscle and the effect of various selective inhibitors. Int. J.Impotence Res. 1992, № 4, Suppl. 2 (далее- [D5]);
- Trigo-Rocha, Flavio, William J. Aronson, Markus Hohenfellner, Louis J. Ignarro et all. Nitric oxide and cGMP: mediators of pelvic nervestimulated erection in dors, Am. J. Physiol. 264 (Heart Circ. Physiol. 33): H419-H422, 1993 (далее- [D6]);
- J. Cortijo, et.all. Investigation into the role of phosphodiesterase IV in bronchorelaxation, including studies with human bronchus. Br. J. Pharmacol. 1993, s. 108, 562 (далее- [D7]);

- копии с сайта Российского регистра лекарственных средств (далее-[D8]);
- Копии нормативных документов (далее- [D9]);

В возражении отмечено, что в первоначальных материалах заявки отсутствует признак, касающийся режима введения соединений « формулы (1)» по пункту 6 формулы изобретения по оспариваемому патенту и ингибитора цГМФ ФДЭ по пункту 7 данной формулы изобретения, а именно - "введение до трех раз в день 5-75 мг".

По мнению лица, подавшего возражение, в формуле изобретения по оспариваемому патенту присутствует признак «ингибитор цГМФ ФДЭ», который выражен чрезмерно широким понятием, поскольку включает в себя специфические и неспецифические ингибиторы ФДЭ, однако патентообладателем используются только специфические ингибиторы ФДЭ.

В возражении отмечено, что формула изобретения по оспариваемому патенту содержит соединения, которые не были известны на дату подачи заявки.

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

- в описании изобретения к указанному патенту отсутствуют сведения, подтверждающие реализацию указанного назначения каким-либо конкретным соединением;
- соединение «формулы 1» включает также соединения, получение которых не подтверждено экспериментальными данными;
- в описании к оспариваемому патенту отсутствуют сведения, подтверждающие возможность лечения или предотвращения дисфункции эрекции у человека;

- из описания к оспариваемому патенту не ясно, какое конкретное соединение использует патентообладатель для лечения эректильной дисфункции;
- в описании к оспариваемому патенту отсутствуют экспериментальные данные, подтверждающие возможность лечения женской особи по пунктам 9, 14 формулы по оспариваемому патенту;
- признак «сексуальная дисфункция» не обеспечивает возможности его идентификации;
- реализация назначения по пунктам 9, 14 указанной формулы не подтверждена соответствующими данными, охватывающими, например другие заболевания (не только эректильной дисфункции), поскольку термин «сексуальная дисфункция» охватывает различные заболевания (вагинизм, повышенное половое влечение, отсутствие оргазма);
- для известных ингибиторов цГМФ ФДЭ (используемых для лечения эректильной дисфункции) в Российском регистре лекарственных средств отмечены их противопоказания для женщин.
- в описании изобретения к оспариваемому патенту отсутствуют подтверждения о необходимости обязательного ежедневного приема лекарственного средства для лечения эректильной дисфункции.

В отношении несоответствия группы изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1,6,7 по оспариваемому патенту условию патентоспособности "изобретательский уровень" в возражении отмечено следующее:

- свойства соединений формулы (1) ингибировать цГМФ ФДЭ известны из патентных документов [D1] и [D2] и из источника [D3], в связи с чем, новое назначение указанных в независимом пункте 1 формулы соединений следует из его известных свойств;
- при известности из источника информации [D4] сведений о лечении или предотвращении дисфункции эрекции у человека путем

введения фармакологического средства, отличительные признаки изобретения по пункту 6 формулы к оспариваемому патенту известны из патентных документов [D1] и [D2] и из источника [D3];

- при известности из источника информации [D4] орального лечения или предотвращение дисфункции эрекции у человека путем введения ингибитора цГМФ ФДЭ три раза в день в дозе 400 мг, отличительные признаки изобретения по пункту 7 формулы к оспариваемому патенту известны из патентных документов [D1] и [D2] и из источника [D3], а поскольку технический результат не определен патентообладателем, необходимость подтверждения известности влияния отличительных признаков на технический результат не требуется.

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

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

"Применение 5-[2-этокси-5-(4-метил-1-пiperазинилсульфонил)-фенил-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7н-пиразоло[4,3-d[пиrimидин-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*, а 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;
- источник Д6 описывает возможность интракавернозных инъекций лекарственных средств;
- в источнике Д7 просто указывается то, что соединение пентоксифиллин является неселективным ингибитором ФДЭ.

По мнению патентообладателя, в противопоставленных источниках информации Д1-Д6 не представлено сведений, позволяющих предположить, что селективный ингибитор ФДЭ<sub>v</sub> будет эффективным в лечении эректильной дисфункции у мужчин.

В отзыве также описана физиология 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 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. Кроме того, до даты приоритета оспариваемого патента для лечения импотенции использовали только инъекционные и психотерапевтические методы, что было учтено при разработке изобретения по оспариваемому патенту.

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

С учетом даты подачи заявки, по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности группы изобретений по данному патенту 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) 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.

В соответствии с пунктом 5.1. Правил ППС решение о прекращении делопроизводства по возражению принимается палатой по патентным спорам в случае выявления при подготовке к рассмотрению возражения или при его рассмотрении обстоятельств, исключающих возможность принятия возражения к рассмотрению или принятия по нему решения.

В соответствии с пунктом 6.3. Правил ППС решение палаты по патентным спорам утверждается руководителем федерального органа

исполнительной власти по интеллектуальной собственности и вступает в силу с даты его утверждения.

Согласно пункта 3 статьи 1398 Кодекса патент на изобретение, полезную модель или промышленный образец признается недействительным полностью или частично на основании решения федерального органа исполнительной власти по интеллектуальной собственности, принятого в соответствии с пунктами 2 и 3 статьи 1248 Кодекса.

Согласно пункта 5 статьи 1398 Кодекса признание патента недействительным означает отмену решения федерального органа исполнительной власти по интеллектуальной собственности о выдаче патента на изобретение и аннулирование записи в соответствующем государственном реестре.

Анализ материалов возражения показал следующее.

На дату (22.01.2009) принятия возражения к рассмотрению, патент № 2130776 действовал с приведенной выше формулой изобретения.

Однако, до даты заседания коллегии (18.12.2009) по рассмотрению упомянутого возражения, Роспатентом 15.06.2009 было вынесено решение о признании патента № 2130776 недействительным частично, в связи с чем, по заявке № 96100543/14 был выдан новый патент № 2373938 с измененной формулой изобретения, публикация которого была произведена 27.11.2009.

В связи с вышеизложенным, лицу, подавшему возражение, было предложено до даты заседания коллегии представить уточненные доводы (в рамках первоначально поданного возражения), касающиеся оценки охранныспособности изобретения по скорректированной формуле, представленной во вновь выданном патенте (данная формула полностью

совпадает с приведенной выше скорректированной патентообладателем формулой).

На дату заседания коллегии, уточненные материалы возражения представлены не были. При этом на заседании коллегии лицо, подавшее возражение, отсутствовало.

Ввиду отмеченного выше, коллегия палаты по патентным спорам приняла решение о прекращении делопроизводства по возражению, поступившему 22.12.2008.

Учитывая изложенное, коллегия палаты по патентным спорам решила:

**прекратить делопроизводство по возражению, поступившему 22.12.2008, относящегося к заявке на изобретение № 96100543/14.**

