

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 1 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 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» (далее – Кодекс), и Правила рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденные приказом Министерства Науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020, рег. № 59454, опубликованными на официальном интернет портале правовой информации www.pravo.gov.ru, 26.08.2020, № 0001202008260011, дата вступления в силу 06.09.2020 (далее – Правила ППС) рассмотрела поступившее 10.01.2022 возражение от Общества с ограниченной ответственностью "ПСК "Фарма" (далее – лицо, подавшее возражение), против действия на территории Российской Федерации евразийского патента на изобретение ЕА № 7251, при этом установлено следующее.

Евразийский патент ЕА № 7251 на изобретение «3 -{((3R,4R)-4-МЕТИЛ-3-[МЕТИЛ-(7Н-ПИРРОЛО[2,3-D] ПИРИМИДИН-4-ИЛ)-АМИНО] ПИПЕРИДИН-1-ИЛ}-3-ОКСОПРОПИОНИТРИЛ И ЕГО ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИ ПРИЕМЛЕМЫЕ СОЛИ» (далее – оспариваемый патент) выдан по заявке ЕА № 200301193, с датой подачи 29.05.2002 (номер и дата подачи международной заявки IB2002/001905 29.05.2002), с

конвенционными приоритетами от 31.05.2001 и 06.12.2001, установленными по дате подачи заявок US 60/294,775 и US 60/341,048 соответственно.

Действие оспариваемого патента продлено на территории Российской Федерации до 29.05.2027 (см. Бюллетень № 10 ЕАПВ «Изобретения (евразийские заявки и евразийские патенты)», опубликовано 30.10.2013.

Евразийский патент ЕА № 7251 выдан на имя компании «Пфайзер Продактс ИНК.», США (далее – патентообладатель) со следующей формулой изобретения:

«Соединение 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрил или его фармацевтически приемлемая соль».

Против действия на территории Российской Федерации евразийского патента ЕА № 7251 в соответствии с пунктом 1 статьи 13 Евразийской Патентной Конвенции от 09.09.1994, ратифицированной Российской Федерацией Федеральным законом от 01.06.1995 № 85-ФЗ и вступившей в силу для Российской Федерации с 27.09.1995 (далее – Конвенция), и пункта 1 Правила 54 Патентной инструкции к Евразийской патентной конвенции, утверждённой Административным советом Евразийской патентной организации на втором (первом очередном) заседании 01.12.1995 с изменениями и дополнениями, утвержденными на девятнадцатом (четырнадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 13-15 ноября 2007 г. двадцать первом (шестом внеочередном) заседании Административного совета ЕАПО 30-31 марта 2009 г., двадцать третьем (семнадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 8-10 ноября 2010 г., двадцать шестом (девятнадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 20-22 ноября 2012 г., двадцать седьмом (двадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 6-8 ноября 2013 г., двадцать восьмом (двадцать первом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 11-13 ноября 2014 г., тридцать втором (двадцать третьем очередном) заседании

Административного совета ЕАПО 1-3 ноября 2016 г., тридцать третьем (двадцать четвертом очередном) заседании 6-7 сентября 2017 г., тридцать четвертом (двадцать пятом очередном) заседании 22 – 23 октября 2018 г., тридцать шестом (двадцать седьмом очередном) заседании 10 – 11 сентября 2020 г. (далее – действующая Патентная инструкция), поступило возражение, мотивированное наличием в формуле изобретения оспариваемого патента признаков, отсутствующих в первоначальных материалах заявки, а также несоответствием изобретения по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень».

К возражению приложены следующие материалы (копии):

- Заявка на изобретение ЕА 200200506 А1, опубл. 26.12.2002 (далее – [1]);
- Заявка РСТ WO 99/65908 А1, опубл. 23.12.1999 (далее – [2]);
- Заявка на изобретение EP 0795556 А1, опубл. 17.09.1997 (далее – [3]);
- Заявка РСТ WO 98/23613 А1, опубл. 04.06.1998 (далее – [4]);
- Заявка на изобретение US 3,037,980 А, опубл. 05.06.1962 (далее – [5]);
- Заявка на изобретение GB 915,303 А, опубл. 09.01.1963; (далее – [6]);
- Заявка на изобретение EP 0514540 А1, опубл. 25.11.1992 (далее – [7]);
- Заявка РСТ WO 98/02438 А1, опубл. 22.01.1998 (далее – [8]);
- Johnston, J. A., Kawamura, M., Kirken, R. A., «Phosphorylation and activation of the Jak-3 Janus kinase in response to interleukin-2.» Nature, 1994, 370(6485): 151–153, с перев. на русс. язык (далее – [9]);
- Traxler, Peter M., et al. «4-(Phenylamino) pyrrolopyrimidines: potent and selective, ATP site directed inhibitors of the EGF-receptor protein tyrosine kinase» Journal of medicinal chemistry, 1996, 39(12): 2285-2292, с перев. на русс. яз. (далее – [10]);
- Заявка РСТ WO 98/41525 А1, опубл. 24.09.1998 (далее – [11]);
- Müller, Christa E., et al. «Chiral pyrrolo [2, 3-d] pyrimidine and pyrimido [4, 5-b]

indole derivatives: structure– activity relationships of potent, highly stereoselective A1-adenosine receptor antagonists.» Journal of medicinal chemistry, 1996, 39(13): 2482-2491, с переводом на русский язык (далее – [12]);

- В. М. Потапов, Стереохимия: Учебное пособие для вузов, 2-е изд., М.: Химия, 1988 (в качестве справочной литературы С1, далее – [13]);

- Э. Илиел и др., Основы органической стереохимии, М.: БИНОМ. Лаборатория знаний, 2007 (в качестве справочной литературы С2, далее – [14]);

- Беликов В.Г., «Фармацевтическая химия», в двух частях, часть I «общая фармацевтическая химия», 2-ое издание, М.: Высшая школа, 1993, 432 с. (в качестве справочной литературы С3, далее – [15]);

- Харкевич Д.А., «Фармакология», 4-е издание, М.: Медицина, 1993, 544 с. (в качестве справочной литературы С4, далее – [16]).

Суть содержащихся в возражении доводов сводится к следующему.

По мнению лица, подавшего возражение, признак «фармацевтически приемлемая соль» соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил, указанный в формуле оспариваемого патента, отсутствовал в заявке ЕА № 200301193 на дату ее подачи (далее – Заявка на дату ее подачи).

По мнению лица, подавшего возражение, изобретение по оспариваемому патенту не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» на основании, в частности, следующего:

- в материалах Заявки на дату ее подачи не описаны средства и методы получения соединения, указанного в формуле оспариваемого патента, а приведенные примеры, не содержат сведений, позволяющих получить соединение 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-амино]-пиперидин-1-ил}-3-оксо-пропионитрила;

- в материалах Заявки на дату ее подачи не показаны стадии, указывающие на разделение рацемической смеси и получение необходимого энантиомера и отсутствуют сведения о получении оспариваемого соединения в результате

кристаллизации конгломерата и выделении именно энантиомера «3- {(3R,4R)-4-Метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-амино]-пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил»;

- в материалах Заявки на дату ее подачи не сформулировано «в явном виде назначение» для запатентованного соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил;

- в материалах Заявки на дату ее подачи назначение указано лишь в общем виде, а именно «Соединения пирроло[2,3-d]пиримидина являются ингибиторами протеинкиназ, таких как фермент киназа 3 Janus (JAK3)), и поэтому используются в терапии в качестве иммуносупрессивных средств для трансплантации органов, ксенотрансплантации, для лечения волчанки обыкновенной, рассеянного склероза, ревматоидного артрита, псориаза, диабета типа I и осложнений, связанных с диабетом, рака, астмы, атопического дерматита, аутоиммунных нарушений щитовидной железы, язвенных колитов, болезни Крона, болезни Альцгеймера, лейкоза и других симптомов, где иммуносупрессивное средство является желательным»;

- материалы Заявки на дату ее подачи не содержат достоверных данных, подтверждающих влияние заявленного в формуле оспариваемого патента энантиомера и любых его фармацевтически приемлемых солей на активность JAK3 и возможность использования запатентованного энантиомера в качестве иммуносупрессивного средства для лечения вышеуказанных заболеваний.

- в описании оспариваемого патента также не представлены какие-либо испытания, исследования запатентованного соединения и не раскрыты уровни фосфорилирования, значения IC50 для запатентованного соединения.

Как отмечено в возражении, при разделении рацемической смеси для получения энантиомера патентообладатель использует процесс кристаллизации. При этом, как считает лицо, подавшее возражение, опираясь на сведения из справочной литературы ([13]-[16]), хотя кристаллизацию,

действительно, применяют для разделения рацемической смеси, однако, не все соединения при кристаллизации способны образовывать конгломерат, из которого могут быть выделены конкретные энантиомерные формы, а разделение смеси путем кристаллизации, по общему правилу, нуждается во внесении затравки в виде конкретного энантиомера (С2, [14], стр.208-219). При этом, как отмечает лицо, подавшее возражение, в Примере 6 описания изобретения по оспариваемому патенту не содержится сведений как о введении затравки, так и о получении в результате кристаллизации конгломерата и выделении именно того энантиомера, который указан в заголовке Примера 6.

Кроме того, в возражении обращается внимание на то, что при разработке лекарственного препарата перед специалистами данной области встает необходимость исследования данного препарата, в частности: фармакологического скрининга, клинической проверки (С3, [14]), стр. 41, 42); выяснение зависимости между химической структурой веществ и их биологической активностью, поскольку свойства лекарственных средств обусловлены их химическим строением, наличием функционально активных группировок, формой и размером молекул (С4, [16], стр. 41, 42); оценки активности для установления того, обладает ли соединение какими-либо терапевтическими свойствами или нет (С2, [14], стр. 143, 148). Однако, в материалах Заявки на дату ее подачи, как и в описании оспариваемого патента такие сведения отсутствуют.

Лицо, подавшее возражение, подчеркивает, что описание Заявки на дату ее подачи, как и описание оспариваемого патента, не содержат никаких экспериментальных, исследованных данных для соединений пирроло[2,3-d]пиримидина и, в частности, для запатентованного соединения 3-((3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил)-3-оксопропионитрила, в связи с чем «нельзя сделать вывод о том, что соединение 3-((3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]

пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила или его соли обладает требуемой активностью и влияет на этиопатогенез хотя бы одного из состояний или заболеваний «при трансплантации органов, ксенотрансплантации, волчанке, рассеянном склерозе, ревматоидном артрите, псориазе, диабете I типа и осложнениях при диабете, раке, астме, атопическом дерматите, аутоиммунных тиреоидных расстройствах, неспецифическом язвенном колите, болезни Крона, болезни Альцгеймера, лейкемии и других аутоиммунных заболеваниях», указанных в описании оспариваемого патента.

В отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» в возражении отмечено, что соединение по оспариваемому патенту известно из заявки [1].

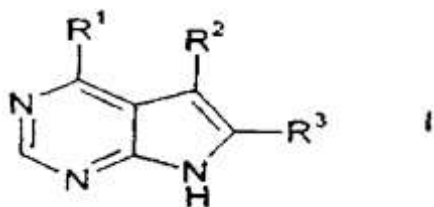
Доводы лица, подавшего возражение, сводятся к следующему.

Заявка [1] относится к соединениям пирроло[2,3-d]пиримидина, которые являются ингибиторами протеинкиназ, таких как ферментная Janus киназа 3 (JAK3). Более конкретно, из заявки [1] (п.8 формулы, стр.10 описания, Пример 14) известно соединение 3-{(4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил, указанное в формуле изобретения по оспариваемому патенту.

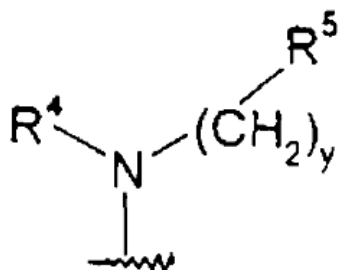
Альтернативный признак «его фармацевтически приемлемые соли» также известен, из заявки [1], поскольку «в пункте 8 формулы изобретения по заявке [1] заявлено соединение формулы соединение 3-{(4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемая соль».

Суть приведенных в возражении доводов, касающихся несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» сводится к следующему.

Из заявки [2] известно соединение со структурной формулой



или его фармацевтически приемлемая соль,
где R1 представляет группу формулы



где у означает 0 или 1.

Какой-либо технический результат, обеспечиваемый заявленной энантиомерной формой 3-{(4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила, не показан в материалах оспариваемого патента. Все представленные в оспариваемом патенте сведения касаются только получения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила. При этом какая-либо оценка активности именно такой формы по сравнению с другими энантиомерами 3-{(4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила патентообладателем не проводилась. В этой связи лицо, подавшее возражение, говорит о несущественности энантиомерной формы оспариваемого соединения и, соответственно, его несущественным признаком.

При этом и на основании сведений, представленных в источниках информации [2], [3], [4], [7], [8], [9]-[12] с учетом справочной информации, представленной в источниках [13]-[16] изобретение по оспариваемому патенту с очевидностью для специалиста следует из уровня техники.

Кроме того, в дополнительных материалах к возражению, представленных 17.04.2025, указано на то, что для изобретения по

оспариваемому патенту приоритет по первоначальным заявкам США №60/2946775 от 31.05.2001 и США №60/341048 от 06.12.2001 был установлен не верно, поскольку в приоритетной заявке США №60/2946775 от 31.05.2001 не был раскрыт пример получения соединения по оспариваемому патенту. В этой связи, по мнению лица, подавшего возражение, приоритет изобретения по оспариваемому патенту должен быть установлен по дате подачи более поздней заявки США №60/341048 от 06.12.2021, а международная публикация WO 2001/042246, опубликованная 14.06.2001, которая соответствует содержанию источника информации [1] и раскрывает тофацитиниб в рацемической форме, может быть противопоставлена для оценки соответствия изобретения со спорному патенту условию изобретательского уровня.

При этом изобретение по оспариваемому патенту, по мнению лица, подавшего возражение, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку в материалах заявки, по которой был выдан оспариваемый патент, не приведены сведения о том, что специально полученный и исследованный 3R, 4R энантиомер тофацитиниба проявляет новые свойства в качественном и количественном отношении, по сравнению с известным из публикации WO 2001/042246 тофацитинибом в рацемической форме.

С материалами возражения патентообладатель был ознакомлен в установленном порядке.

Патентообладатель представил 19.04.2022 отзыв по мотивам возражения.

К отзыву приложены следующие материалы (копии):

- Сведения о продлении евразийского патента № 7251, опубликованные в Бюллетене ЕАПВ «Изобретения (евразийские заявки и евразийские патенты)», 30.10.2013; материалы переписки заявителя с ЕАПВ в результате делопроизводства по заявке на выдачу оспариваемого патента- Приложения 1, 2, 3 к отзыву (далее – [17]);

- Статья Prevention of Organ AUograft Rejection by a Specific Janus Kinase 3

Inhibitor, Science, Vol. 302, October 31, 2003, с переводом релевантных частей на русский язык. Приложение 4 к отзыву (далее - [18]);

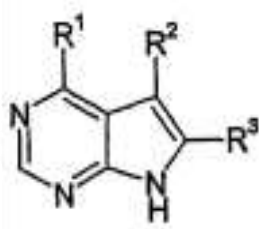
- Декларация доктора Марка Эдварда Фланагана с переводом на русский язык. Приложение 5 к отзыву (далее -[19]);

- Статья Jiang et Al. Examining the Chirality, Conformation and Selective Kinase Inhibition of 3-((3R,4R)-4-methyl-3-(methyl(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)amino)piperidin-1-yl)-3-oxopropanenitrile (CP-690,550); J. Med. Chem. 2008, 51, 8012-8018. Приложение 6 к отзыву (далее - [20]);

- Декларация доктора Джеймса Кларка с переводом на русский язык. Приложение 7 к отзыву (далее - [21]).

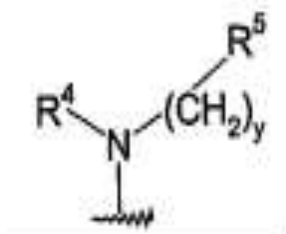
По мнению патентообладателя, все признаки формулы изобретения по оспариваемому патенту, в частности, альтернативный признак «фармацевтически приемлемая соль» содержатся как в описании патента, так и в Заявке на дату ее подачи. В обоснование данного довода патентообладатель приводит, в частности, следующие аргументы:

- на странице 2 заявки, по которой был выдан оспариваемый патент, содержится информация: «Данное изобретение относится к способам разделения энантиомеров предшественников, используемых для получения соединения следующей формулы и, в частности, его группы R1:



или его фармацевтически приемлемой соли; где

R1 представляет собой группу формулы



где у представляет собой 0, 1 или 2», а на страницах 2-5 Заявки приводятся возможные значения радикалов для соединения формулы I;

- на страницах 10-11 описания заявки указано, что «Данное изобретение относится к способу получения соединения формулы (I) или его фармацевтически приемлемой соли»;

- на страницах 11-14 описания заявки приводятся возможные значения радикалов, на страницах 14-15 приводятся стадии способа получения и разделения различных энантиомеров;

- на страницах 5-6 описания заявки указано, что «данное изобретение относится к получению стереоспецифических фармацевтически приемлемых кислотно-аддитивных солей соединений формулы I» и «к стереоспецифическим основно-аддитивным солям формулы I».

- из материалов заявки, по которой был выдан патент, следует, что она относится к соединению формулы I и его фармацевтически приемлемым солям, где соединение формулы I представляет собой, например, тофацитиниб, в подтверждение чего на страницах 16-17 описания заявки раскрыто, что данное изобретение также относится к конкретным соединениям, среди которых указано соединение 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрил, приведенное в формуле оспариваемого патента.

В отношении довода лица, подавшего возражение, о несоответствии описания оспариваемого патента первоначальному тексту описания заявки ЕА 200301193 (заявка на дату ее подачи), патентообладатель со ссылкой на приложение 2 [17] отмечает, что «данная корректировка описания была сделана

патентообладателем при ответе на запрос экспертизы от 01.06.2005 исключительно по требованию экспертизы».

В отношении условия патентоспособности «промышленная применимость» суть приведенных доводов сводится к тому, что в описании к оспариваемому патенту описаны средства, использование которых позволило бы осуществить изобретение с реализацией заявленного назначения, что позволяет сделать вывод о соответствии изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость».

Патентообладатель отмечает, что описание оспариваемого патента содержит сведения, раскрывающие назначение объекта, а именно, что данное изобретение относится к способам осуществления разделения хиральных солей из рацемических смесей энантиомеров и, в частности, предшественников энантиомеров, используемых для получения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрила и его фармацевтически приемлемых солей.

Патентообладатель обращает внимание на то, что «запатентованное соединение и его соли используются в качестве ингибиторов протеинкиназ, таких как фермент киназа 3 Janus», при этом «в материалах заявки (стр. 1 описания) содержатся все сведения, подтверждающие возможность реализации назначения». В подтверждение этих доводов патентообладатель приводит цитату из описания оспариваемого патента «Соединения пирроло[2,3-d]пиримидина являются ингибиторами протеинкиназ, таких как фермент киназа 3 Janus (JAK3)), и поэтому используются в терапии в качестве иммуносуппрессивных средств для трансплантации органов, ксенотрансплантации, для лечения волчанки обыкновенной, рассеянного склероза, ревматоидного артрита, псориаза, диабета типа I и осложнений, связанных с диабетом, рака, астмы, атонического дерматита, аутоиммунных нарушений щитовидной железы, язвенных колитов, болезни Крона, болезни Альцгеймера, лейкоза и других симптомов, где иммуносуппрессивное средство

является желательным».

В отзыве отмечено, что соединения пирроло[2,3-d]пиримидина, их фармацевтические композиции и способы применения описаны в находящейся на одновременном рассмотрении заявке №09/732669, поданной 8 декабря 2000, и принадлежащей правопреемнику данного изобретения. Раскрытие указанной заявки включено в объем данного изобретения в качестве ссылки. Первоначально получают рацемические смеси соединений пирроло[2,3-d]пиримидина, тогда как индивидуальные энантиомеры, выделенные в по существу чистой форме, являются предпочтительными и иногда требуются для использования в качестве лекарственных средств. Представляется возможным предопределить стереохимию соединений в их синтезе путем использования стереоспецифических соединений-предшественников. Способы данного изобретения, соответственно, непосредственно относятся к способу существенного разделения хиральных солей из рацемических смесей соединений-предшественников, используемых для получения отдельных энантиомерных форм соединений пирроло[2,3-d]пиримидина».

По мнению патентообладателя «Соединение согласно формуле оспариваемого патента (тофацитиниб) относится к соединениям пирроло[2,3-d]пиримидина, и, следовательно, нет оснований полагать, что оно не обладает ингибирующей JAK3 активностью соединений широкого класса пирроло[2,3-c1]пиримидина, к которому он принадлежит, и чья ингибирующая тирозинкиназы активность известна».

По мнению патентообладателя «в материалах заявки приведены все сведения, которые позволяют получить запатентованное соединение (тофацитиниб), находящееся в 3R, 4R энантиомерной конфигурации», а «принципы разделения энантиомеров, проиллюстрированные в примерах 2 и 3 заявки, также раскрыты на с. 8 - 9 заявки».

Патентообладатель подчеркивает, что «тофацитиниб согласно формуле оспариваемого патента является стереоспецифическим изомером

(энантиомером), и также будет проявлять ингибирующую JAK3 активность в случае, если такая активность присуща указанному соединению в форме рацемата. Рацемат соединения 3- (4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил)-3-оксопропионитрил раскрыт в примере 14 заявки США №09/732669, содержание которой включено в объем данного изобретения в качестве ссылки».

В отзыве также обращается внимание на то, что «на стадии экспертизы по существу заявки, по которой был выдан оспариваемый патент, патентообладатель в ответе от 11 апреля 2005, чтобы снять сомнения экспертизы в том, что запатентованное соединение проявляет ингибирующую JAK3 активность, представил статью из журнала Science (Приложение 4), в которой независимые исследования подтвердили биологическую активность соединения 3- (4-метил-3-[метил - (7Н-пирроло[2,3-(1)]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил)-3-оксопропионитрил (CP-690550)».

Патентообладатель говорит о наличии в материалах заявки всех средств и методов, необходимых для получения соединений по формуле оспариваемого патента, а также о наличии сведений о возможности применения запатентованных соединений для ингибирования протеинкиназ, в частности Janus киназы 3 (JAK3), и для лечения или предупреждения расстройства или состояния, выбранного из отторжения трансплантата органа, ксенотрансплантации, волчанки, рассеянного склероза, ревматоидного артрита, псориаза, диабета первого типа и осложнений при диабете, рака, астмы, атопического дерматита, аутоиммунных тиреоидных расстройств, неспецифического язвенного колита, болезни Крона, болезни Альцгеймера, лейкемии и других аутоиммунных заболеваний, лечение и предупреждение которых обусловлено специфическим действием (ингибированием) соединений по оспариваемому патенту на протеинкиназу, в частности Janus киназу 3 (JAK3).

При этом, как отмечено в отзыве, в возражении не представлено

доводов о невозможности реализации назначения изобретения по оспариваемому патенту и о том, что «запатентованные соединения не обладают ингибирующей JAK3 активностью».

В отношении условия патентоспособности «новизна» патентообладатель отмечает, что в заявке [1] не раскрыто соединение {(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемая соль, которые приведены в формуле изобретения по оспариваемому патенту.

Патентообладатель подчеркивает, что в примере 14 заявки [1] нет указаний на то, что упомянутое в этом примере соединение имеет необходимую 3R, 4R стереохимию, а соединение в примере 14 по заявке [1] представляет собой рацемическую смесь четырех стереоизомеров.

Патентообладатель приводит декларацию (приложение к 5, [19]), в которой говорится о том, что соединение по примеру 14 в заявке [1] представляет собой рацемическую смесь из 4х стереоизомеров.

При этом в заявке [1] не раскрывается какая-либо конкретная стереохимия, связанная с соединениями общей формулы I, под которое подпадает и соединение по примеру 14, указанного в заявке [1], как и не раскрыт 3R,4R-изомер любого из соединений из примеров по заявке [1].

Патентообладатель также обращает внимание на статью [20] (Приложение 6 к отзыву), в которой обсуждаются аспекты хиральности тофацитиниба (CP-690,550) и его стереохимических изомеров. По мнению патентообладателя, приведенная в данной статье [20] информация свидетельствует о том, что специалист «не мог знать о (3R,4R) стереохимии тофацитиниба (CP-690,550) на дату приоритета изобретения по оспариваемому патенту».

Суть содержащихся в отзыве доводов в отношении условия патентоспособности «изобретательский уровень» сводится к следующему.

Соединение по оспариваемому патенту отличается от соединений, раскрытых в источниках [1]- [12] наличием стереоизомера, а «простая» замена

элементов химической структуры по оспариваемому патенту не может являться очевидной для получения соединений на основе известных из источников [1]-[12] сведений.

В отзыве отмечено, что отличительные признаки (стереоизомер) оспариваемого соединения, и указанные в возражении источники информации [1]- [12] не могли быть с очевидностью скомбинированы специалистом в данной области техники с целью получения соединения по независимому пункту изобретения по оспариваемому патенту.

По мнению патентообладателя, в источниках информации [1]-[12] нет сведений, которые бы указывали на очевидность и предпочтительность именно такой стереоизомерии, которая присутствует в соединении по оспариваемому патенту, и отсутствуют указания на то, что именно такая стереоизомерия будет обеспечивать ингибирование киназы JAK3, то есть, будет способствовать достижению технического результата по оспариваемому патенту, заключающего в реализации назначения запатентованного соединения по независимому пункту формулы изобретения по оспариваемому патенту.

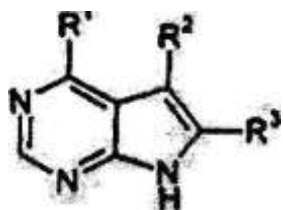
По результатам рассмотрения возражения Роспатент принял 24.01.2023 решение: удовлетворить возражение, поступившее 10.01.2022, действие евразийского патента на изобретение № 7251 на территории Российской Федерации признать недействительным полностью.

Роспатент установил следующее:

- доводы возражения о наличии в формуле изобретения по спорному патенту отсутствующих в первоначальных материалах заявки признаков, о несоответствии спорного изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость» не нашли своего подтверждения;
- заявка ЕА № 200200506 (источник информации [1]) является переводом заявки РСТ/IB2000/001742, опубликованной как WO2001/042246, на региональную фазу и входит в уровень техники;
- формула изобретения по спорному патенту состоит из одного независимого

пункта формулы на «Соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемая соль».

- альтернативный признак «его фармацевтически приемлемая соль» выражен общим понятием и включает в себя любую фармацевтически приемлемую соль;
- согласно описанию заявки, по которой был выдан оспариваемый патент, «данное изобретение относится к способам разделения энантиомеров предшественников, используемых для получения соединения следующей формы и, в частности, его группы R¹



или его фармацевтически приемлемой соли;

- согласно описанию «данное изобретение относится к способам разделения энантиомеров предшественников, используемых для получения 3- {(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила, «данное изобретение также относится к получению стереоспецифических фармацевтически приемлемых кислото-аддитивных солей соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила», «данное изобретение также относится к получению стереоспецифических фармацевтически приемлемых кислотно-аддитивных солей соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил» (см. описание);

- из источника информации [1] известно соединение 3- {-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло [2,3 - d] пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1 -ил} -3 - оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемые соли. Так, в примере 14, представленном в заявке ЕА № 200200506 (источник [1]), указан рацемат

этого соединения, а именно 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксopopионитрил. Соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксopopионитрил имеет структурную формулу, идентичную формуле соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксopopионитрил по спорному патенту;

- в описании заявки ЕА № 200200506 (источник информации [1]) содержатся сведения о том, что соединения по изобретению, в том числе соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксopopионитрил «включают в себя все конформационные изомеры (например, цис-и транс-изомеры)», «имеют асимметрические центры и, следовательно, существуют в различных энантиомерных и диастереомерных формах» (см. стр. 7-8 описания). Кроме того, в приведенной заявке указано, что данное изобретение относится «к применению всех оптических изомеров и стереоизомеров и их смесей и ко всем фармацевтическим композициям и способам лечения, которые могут применять или содержать их... соединения формулы I могут также существовать как таутомеры. Это изобретение относится к применению всех таких таутомеров и их смесей»;

- соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксopopионитрил, описанное в заявке ЕА № 200200506 (источник информации 1), является рацематом и включает в себя «различные энантиомерные формы», в том числе и 3R, 4R, которым охарактеризовано соединение 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксopopионитрил и которое имеет идентичную соединению 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксopopионитрил структуру и, как указано в противопоставленной заявке, может находиться в «любой» энантиомерной и диастемерной форме»;

- в заявке ЕА № 200200506 ([1]) нет указания на энантиомерную форму соединения CC1(CCN(C1C2=CN(C(=O)N2)C)C)C(=O)N 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил. Однако в этой заявке содержатся сведения о существовании данного соединения в различных энантиомерных формах;

- поскольку соединение CC1(CCN(C1C2=CN(C(=O)N2)C)C)C(=O)N 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил по оспариваемому патенту является индивидуальным химическим соединением, то оно должно быть исследовано на предмет выявления и проявления его новых, неизвестных для группы этих соединений свойств в качественном и/или количественном отношении. Однако, как материалы заявки на дату ее подачи, так и описание изобретения по спорному патенту, не содержат данных о каких-либо новых свойствах запатентованного соединения, по сравнению с известным из заявки ЕА № 200200506 [1] соединением CC1(CCN(C1C2=CN(C(=O)N2)C)C)C(=O)N 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил, которое также существует в различных энантиомерных формах и структура которого, в свою очередь, является идентичной структуре соединения CC1(CCN(C1C2=CN(C(=O)N2)C)C)C(=O)N 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил по спорному патенту;

- что касается альтернативного признака формулы оспариваемого патента «его фармацевтически приемлемая соль», то в пункте 8 формулы изобретения по заявке ЕА № 200200506 (источник информации [1]) указано соединение формулы CC1(CCN(C1C2=CN(C(=O)N2)C)C)C(=O)N 3-{(4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемая соль. Таким образом, из противопоставленной заявки также известны фармацевтически приемлемые соли соединения по спорному патенту;

- ни в описании изобретения по спорному патенту, ни в источнике информации 1 не содержится каких-либо различий в назначении между запатентованным соединением CC1(CCN(C1C2=CN(C(=O)N2)C)C)C(=O)N 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло [2,3-d] пиримидин-4-

ил)амино] пиперидин-1 -ил}-3-оксопропионитрил и известным из заявки ЕА№ 200200506 [источник информации [1]) соединением 3-{ -4-метил-3-[метил- (7Н-пирроло [2,3-d] пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил.

Установив данные обстоятельства, административный орган констатировал: соединение 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил по спорному патенту не может быть признано патентоспособным, поскольку это соединение входит в общую структурную формулу, указанную в источнике информации [1], является частью предшествующего уровня техники, а также не описано в материалах заявки как специально полученное и исследованное, не проявляет новые неизвестные свойства в качественном и количественном отношении к указанному в заявке [1].

С учетом данного вывода Роспатент не проводил анализ доводов сторон спора и источников информации [2]-[21] в целях оценки изобретения по оспариваемому патенту на соответствие его условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Приведенные обстоятельства послужили основанием для признания действия оспариваемого патента на территории Российской Федерации недействительным полностью и вынесения 24.01.2023 Роспатентом соответствующего решения.

Против данного решения патентообладателем было подано в Суд по интеллектуальным правам (далее - Суд первой инстанции) заявление о признании недействительным решения Роспатента от 24.01.2023.

Исследовав материалы дела, а также учитывая поступившие ответы на судебные запросы, суд первой инстанции пришел к следующим выводам:

- из заявки ЕА № 200200506 (источник информации [1]) известно соединение 3-{ -4-метил-3-[метил- (7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1 -ил} -3- оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемые соли. При

этом соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3- d] пиримидин-4 - ил)амино] пиперидин-1 -ил} -3-оксопропионитрил имеет структурную формулу, идентичную формуле соединения 3-{(3R,4R)-4- метил-3-[метил- (7Н-пирроло[2,3^]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил} -3- оксопропионитрил по оспариваемому патенту;

- в примере 14, приведенном в источнике [1] указан рацемат этого соединения, а также содержатся сведения о том, что соединения по изобретению, в том числе, соединение 3-{4-метил-3-[метил- (7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1 -ил} -3- оксопропионитрил «включают в себя все конформационные изомеры (например, цис-и транс-изомеры)», «имеют асимметрические центры и, следовательно, существуют в различных энантиомерных и диастереомерных формах», и данное изобретение [1] относится «к применению всех оптических изомеров и стереоизомеров и их смесей и ко всем фармацевтическим композициям и способам лечения, которые могут применять или содержать их...соединения формулы I могут также существовать как таутомеры. Это изобретение относится к применению всех таких таутомеров и их смесей».

Согласно выводам суда первой инстанции соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил, описанное в источнике информации [1], является рацематом и включает в себя «различные энантиомерные формы», в том числе и 3R, 4R, которым охарактеризовано соединение 3-{(3R,4R)- 4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d] пиримидин-4- ил)амино]пиперидин-1 -ил} -3-оксопропионитрил и которое имеет идентичную соединению 3-{4-метил-3 -[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил структуру и, как указано в этом источнике [1], может находиться в «любой» энантиомерной и диастомерной форме». То обстоятельство, что в противопоставленном источнике [1] нет указания на энантиомерную форму соединения 3-{(3R,4R)- 4-метил-3-[метил-(7Нпирроло[2,3-d]пиримидин-4-

ил)амино]пиперидин-1 -ил} -3-оксопропионитрил, не порочит правомерный вывод Роспатента о том, что в источнике информации [1] содержатся сведения о существовании данного соединения в различных энантиомерных формах.

Суд первой инстанции отметил необходимость применить в настоящем деле сложившийся в российской судебной практике подход к определению новизны изобретения в случае соотношения значения его параметра с аналогичным параметром прототипа по принципу «уже-шире», приведенный в определении Верховного Суда Российской Федерации от 25.12.2018 №300-КГ18-16152.

Таким образом, решением Суда по интеллектуальным правам от 18.10.2024 в удовлетворении требований патентообладателя было отказано, а решение Роспатента от 24.01.2023 о признании действия оспариваемого евразийского патента на изобретение № ЕА № 7251 на территории Российской Федерации недействительным полностью было оставлено в силе.

Не согласившись с принятым по делу судебным актом, патентообладатель обратился в президиум Суда по интеллектуальным правам с кассационными жалобами, в которых просят отменить решение суда первой инстанции и направить дело на новое рассмотрение или принять новый судебный акт.

Исследовав доводы, содержащиеся в кассационных жалобах, президиум Суда по интеллектуальным правам установил, что их заявители не оспаривают выводы суда первой инстанции факт вхождения источника информации [1] в уровень техники для проверки новизны оспариваемого изобретения.

В обоснование кассационной жалобы патентообладатель (компания Pfizer) отмечает: в противопоставленной заявке раскрыто химическое соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксо-пропионитрил в виде рацемата (пример 14 на стр. 32 заявки), но не раскрыт (не указан прямо) ни один из его возможных стереоизомеров, включая спорный запатентованный стереоизомер 3R,4R, и не показано их получение.

В своей кассационной жалобе патентообладатель (компания Pfizer)

подчеркивает: суд первой инстанции со ссылкой на определение Верховного Суда Российской Федерации от 25.12.2018 № 300-КГ18-16152 применил подход «уже-шире», который не подлежит применению к спорным правоотношениям.

В кассационной жалобе также обращается внимание на то, что в пункте 6.2.3 сборника практики Апелляционной палаты Европейского патентного ведомства (10-е издание, 2022, Приложение 1), на который ссылается Президиум Суда по интеллектуальным правам в деле № СИП-730/2022, была обобщена практика по оценке новизны индивидуальных стереоизомеров при известности из уровня техники соединения-рацемата. Апелляционная палата Европейского патентного ведомства указала, что рацемат не может порочить новизну индивидуального стереоизомера (энантиомера), несмотря на то, что наличие различных конфигурационных изомеров подразумевается в рацемическом соединении. Более того, указание в общем виде на все оптически активные формы не может порочить новизну энантиомеров, если они не были специально получены и изучены.

Кроме того, патентообладатель настаивал: согласно общепринятому подходу к оценке новизны изобретений общее раскрытие не порочит частное; само по себе требование наличия новых свойств в качественном или количественном отношении у соединения по независимому пункту формулы спорного изобретения не соответствует нормам материального права.

Президиум Суда по интеллектуальным правам, изучив материалы дела, обсудив доводы, содержащиеся в кассационных жалобах, заслушав позиции представителей лиц, участвующих в деле, пришел к следующим выводам.

- суд первой инстанции со ссылкой на определение Верховного Суда Российской Федерации от 25.12.2018 № 300-КГ18-16152 применил подход «уже-шире», который не подлежит применению к спорным правоотношениям;
- в пункте 6.2.3 сборника практики Апелляционной палаты Европейского патентного ведомства (10-е издание, 2022, Приложение 1) была обобщена практика по оценке новизны индивидуальных стереоизомеров при известности

из уровня техники соединения-рацемата. Согласно решению Т 296/87 (ОJ 1990, 195) описание рацематов не порочит новизну содержащихся в них пространственных конфигураций; рацематы были описаны в предшествующем уровне техники путем экспертной интерпретации структурных формул и научных терминов; вследствие асимметричного атома углерода, содержащегося в формуле, рассматриваемые вещества могли существовать в рамках множества возможных пространственных конфигураций (D- и L-энантиомеры), однако последние сами по себе не были выявлены при этом в индивидуальной форме. Существование способов разделения рацемата на энантиомеры следует рассматривать только в отношении изобретательского уровня;

- тот факт, что раскрытие документа из предшествующего уровня техники не охватывало более двух возможных стереических конфигураций, не умаляет новизны конкретной конфигурации, заявленной в заявке, поскольку не было однозначного технического описания данной конфигурации. Новизну подобной индивидуальной химической конфигурации можно было бы отрицать только при условии однозначного раскрытия этой конкретной конфигурации в форме технического описания. Таким образом, было недостаточно того, что рассматриваемая конфигурация по существу принадлежала раскрытому классу возможных конфигураций без какого-либо указания его отдельного члена;

- согласно приведенным подходам при рассмотрении на практике подобных дел рацемат не может порочить новизну индивидуального стереоизомера (энантиомера), несмотря на то что наличие различных конфигурационных изомеров гипотетически подразумевается в рацемическом соединении. Более того, указание в общем виде на все оптически активные формы не может порочить новизну энантиомеров, если они не были специально получены и изучены;

- поскольку суд первой инстанции правильно определил имеющие значение для дела обстоятельства в части, касающейся определения совпадающих и отличающихся признаков спорного изобретения и противопоставленного

технического решения, но допустил нарушение норм материального права, президиум Суда по интеллектуальным правам полагает возможным принять новое решение по делу, не направляя дело на новое рассмотрение в суд первой инстанции.

Таким образом, Постановлением Президиума Суда по интеллектуальным правам от 13.02.2025 по делу № СИП-384/2023 отменено решение Суда по интеллектуальным правам от 18.10.2024 по делу № СИП-384/2023.

На Роспатент возложена обязанность повторно рассмотреть поступившее 10.01.2022 возражение ООО «ПСК ФАРМА» против действия на территории Российской Федерации евразийского патента № ЕА 007251 на изобретение.

Таким образом, упомянутое возражение рассматривается повторно с учетом доводов, изложенных в Постановлении Суда по интеллектуальным правам.

Исполняя требования Суда по интеллектуальным правам, стороны спора были в установленном порядке ознакомлены с материалами возражения повторно.

От лица, подавшего возражение, были представлены 17.04.2025, 24.07.2025 (со ссылкой на пункт 38 Правил ППС) дополнительные материалы, содержащие дополнительные доводы о несоответствии изобретения по оспариваемому патенту условиям патентоспособности: «промышленная применимость», «новизна», «изобретательский уровень».

Суть доводов, представленных лицом, подавшим возражение, в отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», сводится к следующему: сведения о получении 3-{{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-амино]-пиперидин-1-ил}}-3-оксо-пропионитрила приведены в Примере 6 оспариваемого патента. Однако способ получения энантиомера 3-{{(3R,4R)-4-Метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-(1]пиримидин-4-ил)-амино]-пиперидин-1-ил}}-3-оксо-пропионитрила (способ А из примера 6 описания к

оспариваемому патенту), по мнению лица, подавшего возражение, является «недостоверным, так как не приводит к получению заявленного соединения согласно независимому пункту формулы (это подтверждает в своей статье один из соавторов оспариваемого патента Флэнэган Марк Эдвард), что должно вызывать сомнения в возможности реализации изобретения и у эксперта», в то время как, согласно пункту 4.3 Правил ЕАПВ «у эксперта не должно возникать сомнений в возможности реализации изобретения»;

- в материалах заявки и в описании к оспариваемому патенту не приведены данные испытаний и не показаны примеры лечения или предотвращения заболевания или состояния, выбранного из отторжения органов при трансплантации, ксенотрансплантации, волчанки обыкновенной, рассеянного склероза, ревматоидного артрита, псориаза, диабета типа I и осложнений, связанных с диабетом, рака, астмы, атопического дерматита, аутоиммунных нарушений щитовидной железы, язвенных колитов, болезни Крона, болезни Альцгеймера, лейкемии и других аутоиммунных заболеваний;

- оспариваемый патент не содержит сведений, указывающих на средства, необходимые для получения заявленного соединения, и объективно подтверждающих им реализацию назначения, в связи с чем, нельзя сделать вывод о том, что соединение согласно формуле оспариваемого патента может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других областях человеческой деятельности;

- не приведены показатели количественных характеристик активности и достоверные сведения, подтверждающие пригодность соединения 3-((3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил)-3-оксопропионитрил по оспариваемому патенту для лечения, диагностики или профилактики указанных заболеваний;

- в формуле оспариваемого патента заявляется 3R, 4R- энантиомер известного соединения, а не способ его получения, поэтому какие-либо особенности способов разделения рацемической смеси и получения 3R, 4R - энантиомера,

достигнутые разработчиками экспериментальным путем, не могут влиять на оценку патентоспособности заявленного изобретения.

Суть доводов, представленных лицом, подавшим возражение, в отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна», сводится к следующему:

- соединение 3-(-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил, описанное в заявке ЕА 200200506 А1 [1] является рацематом и включает в себя «различные энантиомерные формы», в том числе и 3R,4R, которым охарактеризовано соединение 3-((3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил и которое имеет идентичную соединению 3-(-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил структуру и, как указано в заявке ЕА 200200506 [1], может находиться в «любой» энантиомерной и диастомерной форме»;

- из полученных судом ответов, специалистам в данной области техники известно существование четырех стереоизомеров пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила, а именно 3R,4R; 3R,4S; 3S,4R; 3S,4S. При этом ни в описании к оспариваемому патенту ЕА № 7251, ни в заявке ЕА 200200506 А1 [1] не содержится каких-либо сведений, подтверждающих то, что соединение 3-((3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил по оспариваемому патенту в действительности было получено и исследовано, как это должно быть по отношению к индивидуальным химическим соединением, каким является, согласно мнению патентообладателя, соединение 3-((3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил по оспариваемому патенту;

- таким образом, соединение 3-((3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил по

оспариваемому патенту ЕА № 7251 не может быть признано патентоспособным, поскольку это соединение входит в общую структурную формулу, указанную в заявке ЕА 200200506 А1 [1], является частью предшествующего уровня техники, а также не описано в материалах заявки ЕА № 200301193 как специально полученное и исследованное, не проявляет новые неизвестные свойства в качественном и количественном отношении к указанному в заявке ЕА № 200200506 А1 [1];

- патентообладатель не выделяет энантиомерную форму (3R,4R) тофацитиниба ни в качестве самостоятельного признака изобретения, ни в качестве эквивалентного признака. Данное позволяет утверждать, что стереоизомер (3R,4R) является тем же самым, чем является рацемическое соединение, то есть, не является по отношению к рацемату новым;

- в споре о нарушении исключительного права на группу изобретений по евразийскому патенту №006227, выданному по заявке ЕА № 200200506 [1], иностранное лицо (патентообладатель) приводило доводы о том, что никакого различия между рацемическим соединением и конкретным стереоизомером (3R,4R) нет, утверждая, что химическая структурная формула вещества, в том числе вещества тофацитиниб, приведённая в формуле изобретения патента, охватывает все возможные химические вещества, попадающие под данную химическую формулу и все возможные изомеры каждого такого вещества, в том числе и стереоизомер (3R,4R), при этом, говоря о том, что он не является отличительным признаком, тогда как при рассмотрении настоящего возражения патентообладатель указывает на то, что в противопоставленной евразийской заявке [1] такого стереоизомера нет ни по структуре, ни по названию, а стереоизомер (3R,4R) является отличительным признаком, позволяющим признать, что изобретение соответствует условию патентоспособности «новизна»;

- структурные формулы соединений по оспариваемому патенту и раскрытого в заявке ЕА № 20200506[1], практически полностью совпадают лишь с тем

различием, что в структурной формуле соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1ил}-3-оксопропионитрила уточнена конкретная энантиомерная форма;

- согласно информации, данной ученым из МГУ, «заявленный в спорном патенте энантиомер существует, так как ясно, что при наличии двух хиральных атомов, рацемат будет иметь четыре конфигурации, одна из которых 3R,4R. Сомнения есть в возможности его получения в чистом виде», при этом стереоизомер 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-с1]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1ил}-3-оксопропионитрил обязательно присутствует в рацемической смеси согласно источнику [1] и присущ ей;

- кроме того, анализ полученного соединения показал данные LRMS:313 (M+1), при этом идентичные данные получены при анализе соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1ил}-3-оксопропионитрил, полученного согласно где также указан результат LRMS: 313 (M+1). Такой правовой подход подтверждается практикой Суда по интеллектуальным правам, например, решение от 27.06.2017 по делу № СИП-176/2017, в котором суд пришел к выводу о том, что: «Необходимо учитывать, что в формуле изобретения, относящегося к известному продукту или способу, не требуется приведение всех неотъемлемо (имманентно) присущих ему признаков за исключением тех, на изменение которых направлено изобретение. Например, если заявлено изобретение «Велосипед», направленное на усовершенствование рамы велосипеда, упоминать в формуле о наличии колес не обязательно».

На основании изложенного лицо, подавшее возражение, делает следующий вывод-согласно оспариваемому патенту «просто получили известный из заявки [1] стереоизомер, обладающий той же активностью и тем же назначением, а методы получения конкретного энантиомера широко известны из уровня техники (см., например, [C1], стр.28-32, 40-80, 86-105, 128-136), то есть, все признаки изобретения по оспариваемому патенту известны из заявки [1],

соединение согласно оспариваемому патенту не является селективным изобретением. Следовательно, изобретение по формуле оспариваемого патента является частью уровня техники и, должно быть признано несоответствующим условию патентоспособности «новизна» (правило 3(1) Инструкции).

Суть доводов, представленных лицом, подавшим возражение, в отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень», сводится к следующему:

- в пункте 8 формулы изобретения [1] заявлено соединение формулы соединение 3-{(4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3- α]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемая соль. Таким образом, из [1] также известны фармацевтически приемлемые соли соединения по оспариваемому патенту.

- соединение 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрилу согласно оспариваемому патенту подпадает под общую структурную формулу группы соединений, известных из международной заявки WO 2001/042246, переведенной на евразийскую региональную фазу как источник [1];

- согласно материалам заявки, по которой выдан оспариваемый патент, и описания изобретения согласно оспариваемому патенту соединение 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3- α]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил не обладает новыми в качественном и количественном отношении свойствами по сравнению с группой соединений, известных из международной заявки WO 2001/042246, переведенной на евразийскую региональную фазу как источник [1];

- отличительный признак «3R,4R», указывающий, согласно мнению патентообладателя, на принадлежность заявленного в оспариваемом патенте соединения к конкретной энантиомерной форме, известен из международной заявки WO 2001/042246, опубл. 14.06.2001, переведенной на евразийскую региональную фазу как источник [1], которая относится ко всем конформациям

производных пирроло[2,3-d]пиримидина;

- таким образом, соединение по независимому пункту формулы оспариваемого патента с очевидностью следует из источника [1] и соответственно из публикации WO 2001/042246;

- методы получения конкретного энантиомера широко известны из уровня техники, исходя из сведений, содержащихся в источниках С1, Д10;

- какой-либо технический результат, обеспечиваемый непосредственно заявленной энантиомерной формой 3-{(4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила, не показан в материалах оспариваемого патента, а все представленные в оспариваемом патенте сведения касаются только получения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3- оксопропионитрила;

-источник WO 2001/042246 правомерно включен в уровень техники в отношении оценки условия патентоспособности «изобретательский уровень» согласно пункту 3(1) Инструкции, при этом пункт 3(2) Инструкции не может быть применен к источнику WO 2001/042246, с учетом указания на конкретное соединение, которое специально не описано в источнике WO 2001/042246;

- при отсутствии новых неизвестных свойств указанного в пункте 1 формулы изобретения энантиомера в качественном и количественном отношении к указанному рацемату в заявке WO 2001/042246, опубл. 14.06.2001, которая была переведена на евразийскую региональную фазу как источник [1], изобретение по оспариваемому патенту не может быть признано соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень» на основании пункта 4.6 Правил ЕАПВ;

- исключение источника WO 2001/042246 из уровня техники на основании п. 3(2) Инструкции однозначно свидетельствует, что все признаки изобретения согласно оспариваемому патенту полностью раскрыты в источнике [1], что однозначно приводит к несоответствию изобретения согласно оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна»;

На основании изложенного лицо, подавшее возражение, делает следующий вывод: соединение по формуле оспариваемого патента не может быть признано соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень», так как является очевидным для специалиста, с учетом сведений, представленных в источниках [1]-[16].

От патентообладателя поступили 17.06.2025, 29.08.2025, 02.09.2025 дополнительные материалы, в которых приведены, в частности, следующие доводы:

- изобретение по оспариваемому патенту описывает способ выделения стереоизомеров (энантиомеров) из рацемических смесей для получения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрила и его фармацевтически приемлемых солей;
- технический результат изобретения заключается в расширении арсенала средств и совпадает с назначением, указанным на стр. 1 спорного патента – получение индивидуального энантиомера соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрила (далее - тофацитиниб) и его фармацевтически приемлемых солей, используемых в качестве ингибитора протеинкиназы киназы JAK3.

Суть доводов, представленных патентообладателем, в отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», сводится к следующему:

- в материалах заявки приведены все сведения, которые позволяют получить запатентованное соединение (тофацитиниб), находящееся в 3R, 4R энантиомерной конфигурации;
- пример 6 (стадии А-В) демонстрирует как из соединений, полученных из примеров 1-3 получить запатентованное соединение тофацитиниб, представляющее собой именно стереоспецифический 3R, 4R энантиомер;
- в материалах заявки раскрыты средства (тофацитиниб) и методы (способы по

примерам 1-3, 6 и также примерам 4 и 5) для получения тофацитиниба;

- в материалах заявки (стр. 1 описания оспариваемого патента) содержатся все сведения, подтверждающие возможность реализации назначения изобретения - получение соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло [2,3-d]пиримидин-4-ил)-амино]-пиперидин-1-ил]-3-оксо-пропионитрил, обладающего ингибирующей JAK3 протеинкиназу активностью;

- соединение согласно формуле оспариваемого патента (тофацитиниб) относится к соединениям пирроло[2,3-d]пиримидина, и, следовательно, нет оснований полагать, что оно не обладает ингибирующей JAK3 активностью соединений широкого класса пирроло[2,3-d]пиримидина, к которому он принадлежит, и чья ингибирующая тирозин-киназы активность известна;

- в оспариваемом патенте указано (стр.1 описания), что задача изобретения была в получении 3R,4R энантиомера, который является более предпочтительным чем рацемат ввиду его чистоты для использования в качестве лекарственных средств;

- материалы заявки по оспариваемому патенту содержат исчерпывающие сведения о возможности реализации назначения изобретения по оспариваемому патенту;

- в материалах оспариваемого патента содержатся достаточные сведения, подтверждающие возможность получения индивидуального энантиомера и его применения в лечении заболеваний, опосредованных активностью JAK3;

- в материалах заявки, по которой был выдан оспариваемый патент содержатся все сведения, подтверждающие возможность реализации назначения изобретения - получение соединения 3-{(3R, 4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-амино]-пиперидин-1-ил]-3-оксо-пропионитрил, обладающего ингибирующей JAK3 протеинкиназу активностью.

- на стр. 1 описания к оспариваемому патенту, указано, что «Соединения пирроло[2,3-d]... являются ингибиторами протеинкиназ, таких как фермент киназа 3 Janus (JAK3)), и поэтому используются в терапии в качестве

иммуносупрессивных средств для трансплантации органов, ксенотрансплантации, для лечения волчанки обыкновенной, рассеянного склероза, ревматоидного артрита, псориаза, диабета типа I и осложнений, связанных с диабетом, рака, астмы, атонического дерматита, аутоиммунных нарушений щитовидной железы, язвенных колитов, болезни Крона, болезни Альцгеймера, лейкоза и других симптомов, где иммуносупрессивное средство является желательным;

- соединение согласно формуле оспариваемого патента (тофацитиниб) относится к соединениям пирроло[2,3-d]пиримидина, и, следовательно, нет оснований полагать, что оно не обладает ингибирующей JAK3 активностью соединений широкого класса пирроло[2,3-d]пиримидина, к которому он принадлежит, и чья ингибирующая тирозин-киназы активность известна, например, из источника информации WO99/65908 [2] к возражению.

Суть доводов, представленных патентообладателем, в отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна», сводится, в частности, к следующему:

- согласно действующему законодательству порочить новизну изобретения может только такой объект, который обладает всеми признаками, идентичными признакам спорного изобретения;

- Президиум Суда по интеллектуальным правам установил, что индивидуальное соединение, специально полученное и изученное только в оспариваемом патенте, но не описанное как таковое в противопоставленном источнике, соответствует условию патентоспособности "новизна" согласно нормам евразийского законодательства, что также подтверждается и практикой иных патентных ведомств: «Как Роспатент, так и суд первой инстанции установили, что признаки, характеризующие конкретный энантиомер, защищенный спорным патентом, не присущи ни одному соединению, известному из источника информации [1]. Из такого источника известно соединение, охарактеризованное общей структурной формулой, а также известно, что

данное соединение может существовать в различных энантиомерных формах, а согласно применимым нормам евразийского законодательства, требующим для отрицания новизны идентичности признаков, данных выводов достаточно для того, чтобы признать, что соединение, известное из источника информации [1], не порочит новизну спорного изобретения;

- согласно применимым нормам евразийского законодательства, требующим для отрицания новизны идентичности признаков, данных выводов достаточно для того, чтобы признать, что соединение, известное из источника информации 1, не порочит новизну спорного изобретения.

- согласно приведенным подходам рацемат не может порочить новизну индивидуального стереоизомера (энантиомера), несмотря на то что наличие различных конфигурационных изомеров гипотетически подразумевается в рацемическом соединении. Более того, указание в общем виде на все оптически активные формы не может порочить новизну энантиомеров, если они не были специально получены и изучены» (стр. 16-18 постановления президиума СИП);

- при вынесении решения суд кассационной инстанции принял во внимание все доказательства по делу, включая заключения ученых МГУ и уже дал им правовую оценку с точки зрения норм материального и процессуального права;

- несогласие лица, подавшего возражение, с выводом Президиума Суда по интеллектуальным правам, не может послужить основанием для принятия иного решения Роспатентом, отличного от указанного в судебном акте.

На основании вышеизложенного, с учетом вывода Президиума Суда по интеллектуальным правам о неизвестности из уровня техники объекта, охарактеризованного признаками, идентичными признаками запатентованного соединения, патентообладатель делает вывод о том, что изобретение по оспариваемому патенту отвечает условию патентоспособности «новизна» согласно ст. 6 Конвенции и правилу 3(1) Инструкции.

Суть доводов, представленных патентообладателем, в отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию

патентоспособности «изобретательский уровень», сводится, в частности, к следующему:

- источник WO 2001/042246 с датой публикации 14.06.2001 не входит в уровень техники для оценки соответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» согласно правилам 3(1) и 3(2) Патентной Инструкции, поскольку он был опубликован после даты приоритета изобретения по спорному патенту, установленного по первоначальным заявкам США №60/2946775 от 31.05.2001 (дата первого приоритета) и США №60/341048 от 06.12.2001;

- международная публикация WO 2001/042246, не входит в уровень техники для целей оценки патентоспособности изобретения по спорному патенту и в силу правила 3(2) Инструкции, поскольку заявителем международной публикации WO 2001/042246 является то же лицо, что и правообладатель спорного патента, компания Пфайзер Продактс Инк., а авторы изобретения Флэнган Марк Эдвард и Манчхов Майкл Джон также являются авторами изобретения по спорному патенту. При этом публикация международной публикации состоялась 14.06.2001, т.е. не ранее чем за шесть месяцев до даты 06.12.2001, и не может быть противопоставлена для оценки патентоспособности запатентованного изобретения. В этой связи доводы лица, подавшего возражение, в отношении несоответствия изобретения по спорному патенту в силу публикации WO 2001/042246, не подлежат рассмотрению;

- соединение по оспариваемому патенту не следует явным образом из источников информации [2]-[21];

- технический результат изобретения по оспариваемому патенту заключается в расширении арсенала средств и совпадает с назначением, указанным на стр. 1 описания к оспариваемому патенту - получение индивидуального энантиомера соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-с1]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил ... и его фармацевтически приемлемых солей, используемых в качестве ингибитора протеинкиназы

киназы JAK3;

- само соединение в рацемической форме 3-(4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}- 3-оксoproпионитрил до даты приоритета изобретения по оспариваемому патенту в уровне техники раскрыто не было;

- в описании изобретения к оспариваемому патенту приведены примеры 1 -6 специфичного синтеза запатентованного соединения из соединений предшественников, при этом указанные соединения-предшественники сначала подвергали разделению с целью выделения чистых 3R, 4R энантиомеров.

На основании вышеизложенного, патентообладатель делает вывод о том, что изобретение по оспариваемому патенту отвечает условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Изучив все доводы, представленные в материалах дела, в том числе приведенные в решении СИП, и заслушав участников рассмотрения возражения, коллегия установила следующее.

С учетом даты (29.05.2002) подачи заявки, на основании которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности группы изобретений по указанному патенту включает упомянутую Конвенцию и Патентную инструкцию к Евразийской патентной конвенции, утвержденную Административным советом Евразийской патентной организации на втором (первом очередном) заседании 1 декабря 1995 г. с изменениями и дополнениями, утвержденными на одиннадцатом (восьмом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 15-19 октября 2001 года (далее – Патентная Инструкция).

В соответствии со статьей 6 Конвенции Евразийское ведомство выдает евразийский патент на изобретение, которое является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно статье 10 Конвенции объем правовой охраны, предоставляемой евразийским патентом, определяется формулой изобретения.

Согласно статье 13 пункта 1 Конвенции любой спор, касающийся действительности евразийского патента в конкретном Договариваемом государстве разрешается национальными судами или другими компетентными органами этого государства на основании настоящей Конвенции и Патентной инструкции. Решение имеет силу лишь на территории Договариваемого государства.

Согласно пункту 1 правила 3 Патентной Инструкции в соответствии со статьей 6 Конвенции евразийский патент выдается на изобретение, которое является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других областях человеческой деятельности.

Изобретение признается новым, если оно не является частью предшествующего уровня техники. Объекты, являющиеся частью предшествующего уровня техники, для определения новизны изобретения могут учитываться лишь отдельно. Предшествующий уровень техники включает все сведения, ставшие общедоступными в мире до даты подачи евразийской заявки, а если испрашен приоритет, - до даты ее приоритета.

Для целей проверки новизны изобретения предшествующий уровень техники включает также содержание любой заявки на выдачу евразийского патента в той редакции, в которой она была подана на дату ее подачи, при условии, что эта заявка или выданный по ней евразийский патент впоследствии будут опубликованы в установленном порядке и что дата подачи такой заявки или, если испрашен приоритет, дата ее приоритета предшествует соответствующей дате, указанной в абзаце третьем настоящего пункта.

Содержание международной заявки включается в предшествующий уровень техники с даты ее подачи или с даты приоритета, если он испрашен, в случае выполнения требований пункта 1 правила 71 Патентной Инструкции.

Изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста

очевидным образом не следует из предшествующего уровня техники.

Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других областях человеческой деятельности.

Согласно пункту 2 Правила 3 Инструкции не признается обстоятельством, препятствующим признанию патентоспособности изобретения, такое раскрытие информации, относящейся к изобретению, изобретателем, заявителем или любым лицом, получившим от них прямо или косвенно эту информацию, при котором сведения о сущности изобретения стали общедоступными не ранее чем за шесть месяцев до даты подачи евразийской заявки или до даты приоритета, если он испрашен. При этом обязанность доказывания обстоятельств раскрытия информации лежит на заявителе.

В соответствии с пунктом 1 правила 11 Патентной Инструкции евразийская заявка должна раскрывать сущность изобретения достаточно ясно и полно, чтобы изобретение могло быть осуществлено специалистом.

Согласно пункту 1 правила 12 Патентной Инструкции формула изобретения определяет объем охраны, предоставляемой евразийским патентом.

Согласно пункту 2 правила 12 Патентной Инструкции в соответствии со статьей 10 Конвенции при определении объема правовой охраны, предоставляемой евразийским патентом, описание и чертежи служат только для целей толкования формулы изобретения.

При этом принимается во внимание каждый признак изобретения, включенный в независимый пункт формулы изобретения, или эквивалентный ему признак, известный в качестве такового до даты подачи евразийской заявки, а если установлен приоритет, - до даты приоритета изобретения, охраняемого евразийским патентом.

В соответствии с пунктом 5 правила 23 Патентной Инструкции изложение раздела описания «Сущность изобретения» должно способствовать

пониманию технической задачи, на достижение которой направлено заявляемое решение. При этом указывается технический результат, который может быть получен при осуществлении изобретения, а также преимущества заявляемого решения по сравнению с предшествующим уровнем техники.

Согласно пункту 2 правила 47 Патентной Инструкции при проверке соответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость» устанавливаются: наличие в материалах евразийской заявки указания на назначение заявленного изобретения; наличие в материалах евразийской заявки или источниках информации, относящихся к предшествующему уровню техники, сведений о средствах и методах, использование которых позволяет осуществить изобретение в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения.

При проверке соответствия заявленного изобретения условию патентоспособности «новизна» устанавливается, является ли заявленное изобретение частью предшествующего уровня техники. Изобретение не признается соответствующим условиям новизны, если в предшествующем уровне техники выявлены сведения об объекте, который имеет признаки, идентичные всем признакам изобретения, содержащимся в независимом пункте формулы изобретения.

При проверке соответствия заявленного изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» определяется, является ли заявленное изобретение очевидным для специалиста, исходя из предшествующего уровня техники.

Проверка соответствия заявленного изобретения условиям патентоспособности промышленной применимости, новизны и изобретательского уровня осуществляется на дату подачи евразийской заявки, а при испрашивании приоритета - на дату приоритета. Если заявитель отказался от права на приоритет или оно было утрачено в связи с несоблюдением условий, предусмотренных правилами 6 или 36 Инструкции, проверка

соответствия заявленного изобретения условиям патентоспособности осуществляется на дату подачи евразийской заявки.

Согласно пункту 3 правила 49 Патентной Инструкции дополнение, уточнение или исправление описания и формулы изобретения, а также чертежей, если они имеются в материалах заявки, не изменяющее сущности изобретения, допускается, за исключением исправления технических и очевидных ошибок, до даты вынесения по евразийской заявке решения об отказе в выдаче евразийского патента или решения о его выдаче. Изменение формулы изобретения допускается в пределах раскрытия изобретения в описании изобретения.

Исходя из пункта 1 правила 54 Патентной инструкции евразийский патент может быть признан недействительным на территории Договаривающегося государства на основании процессуальных норм его национального законодательства полностью или частично, в течение всего срока его действия.

С целью толкования положений Конвенции и Патентной Инструкции используются Правила составления, подачи и рассмотрения евразийских заявок в Евразийском патентном ведомстве, утвержденные приказом Евразийского патентного ведомства 18 мая 1998 №22 и опубликованные в Бюллетене Евразийского патентного ведомства №3 от 25 июня 1998 г. (далее – Правила ЕА), действующие на дату (29.05.2002) подачи заявки, на основании которой был выдан оспариваемый патент.

Согласно пункту 38 Правил ППС в рамках рассмотрения спора лицо, подавшее возражение или заявление, вправе представлять дополнительные доводы по возражениям и заявлениям и подтверждающие их документы и материалы. Указанные дополнительные доводы могут быть представлены до удаления коллегии в совещательную комнату для формирования вывода по результатам рассмотрения спора.

Анализ доводов сторон показал следующее.

Изобретению по оспариваемому патенту предоставлена правовая охрана в объеме совокупности признаков, содержащихся в формуле, приведенной выше.

Объектом изобретения по оспариваемому патенту является «Соединение 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемая соль.» (см. вышеприведенную формулу).

Изобретение по оспариваемому патенту относится к соединениям пирроло[2,3-d]пиримидина, которые согласно описанию к оспариваемому патенту (см. стр. 1 описания) являются ингибиторами протеинкиназ, таких как фермент Janus киназа 3 (далее - JAK3), и используются в терапии в качестве иммунодепрессивных агентов при трансплантации органов, при ксенотрансплантации, а также при многочисленных болезнях, в частности: волчанке, рассеянном склерозе, ревматоидном артрите, псориазе, диабете 1 типа и осложнениях при диабете, раке, астме, атопическом дерматите, аутоиммунных тиреоидных расстройствах, неспецифическом язвенном колите, болезни Крона, болезни Альцгеймера, лейкемии и при других заболеваниях и состояниях, при которых, желательна иммунодепрессия.

Решением Роспатента от 24.01.2023 возражение было удовлетворено, и оспариваемый патент был признан недействительным полностью в связи с несоответствием изобретения по оспариваемому патенту по пункту 1 формулы условию патентоспособности «новизна» по отношению к евразийской заявке ЕА №200200506 [1]. При вынесении решения Роспатент признал изобретение по оспариваемому патенту соответствующим условию патентоспособности «промышленная применимость», и данный вывод не был оспорен лицом, подавшим возражение.

Решением Суда по интеллектуальным правам (первая инстанция) от 18.10.2024 решение Роспатента от 24.01.2023 было оставлено в силе.

Постановлением Президиума Суда по интеллектуальным правам от

13.02.2025 признан незаконным вывод Роспатента о несоответствии изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности "новизна" по отношению к источнику уровня техники [1], который раскрывает рацемат соединения, индивидуальный энантиомер которого защищен в оспариваемом патенте, указав, что "рацемат не может порочить новизну индивидуального стереоизомера (энантиомера), несмотря на то, что наличие различных конфигурационных изомеров гипотетически подразумевается в рацемическом соединении. Более того, указание в общем виде на все оптически активные формы не может порочить новизну энантиомеров, если они не были специально получены и изучены" (стр. 18 постановления президиума СИП).

Установив соответствие изобретения по спорному патенту условию патентоспособности "новизна", президиум Суда по интеллектуальным правам обязал Роспатент повторно рассмотреть поступившее 10.01.2022 возражение от ООО «ПСК ФАРМА» с учетом выводов, изложенных в судебном акте от 13.02.2025, "поскольку Роспатент не проводил анализ доводов сторон административного спора и источников информации 2-21 в целях оценки изобретения по спорному патенту на соответствие его условию патентоспособности «изобретательский уровень»" (стр. 18 постановления СИП от 13.02.2025).

В соответствии со статьей 6 Федерального конституционного закона от 31 декабря 1996 г. N 1-ФКЗ "О судебной системе Российской Федерации" и в силу статьи 16 Арбитражного процессуального кодекса РФ вступившие в законную силу судебные акты арбитражного суда являются обязательными для органов государственной власти, органов местного самоуправления, иных органов, организаций, должностных лиц и граждан и подлежат исполнению на всей территории Российской Федерации.

В связи с тем, что в соответствии с Постановлением президиума Суда по интеллектуальным правам от 13.02.2025 изобретение по оспариваемому патенту уже признано содержащим в первоначальных материалах заявки, по которой

был выдан оспариваемый патент альтернативу, касающуюся «фармацевтически приемлемой соли», а также отвечающим условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «новизна», то анализу подлежат доводы возражения, касающиеся условия патентоспособности «изобретательский уровень» и с учетом сведений, представленных в источниках информации [2]-[21].

Тем не менее, исходя из действующих процессуальных норм на дату подачи возражения, оцениваются доводы сторон на дату повторного рассмотрения возражения, анализ которых показал следующее.

Проверка изобретения по оспариваемому патенту на наличие в формуле оспариваемого патента признаков, отсутствующих в первоначальных материалах заявки показала следующее.

В возражении в качестве такового оспаривается признак «или его фармацевтически приемлемая соль», который указан в формуле изобретения по оспариваемому патенту в качестве альтернативного признака.

При этом в описании заявки, послужившей основанием для выдачи патента (далее – материалы заявки на дату ее подачи), приведены сведения о том, что «...изобретение также относится к конкретным соединениям, которые являются предпочтительными и выбраны из группы, состоящей из...», далее приводится перечень этих соединений, включающий указанное в формуле оспариваемого патента соединение «3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино] пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил» (стр. 16 описания заявки), «...данное изобретение также относится к фармацевтической композиции для а) лечения или предотвращения заболевания или состояния, выбранного из отторжения органов при трансплантации, ксенотрансплантации, волчанки обыкновенной, рассеянного склероза, ревматоидного артрита, псориаза, диабета типа 1 и осложнений, связанных с диабетом, рака, астмы, атопического дерматита, аутоиммунных нарушений щитовидной железы, язвенных колитов, болезни Крона, болезни Альцгеймера,

лейкемии и других аутоиммунных заболеваний или b) ингибирования протеинкиназ или киназы 3 Jnus (JAR3) у млекопитающих, включая человека, содержащая эффективное для таких нарушений или состояний количество описанного выше конкретно предпочтительного соединения или его фармацевтически приемлемой соли, и фармацевтически приемлемый носитель» (см. с.17 описания заявки).

Таким образом, альтернатива, касающаяся «фармацевтически приемлемой соли» содержалась в первоначальных материалах заявки, по которой был выдан оспариваемый патент.

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретения по оспариваемому условию патентоспособности «промышленная применимость», показал следующее.

В соответствии с нормами действующего законодательства проверка соответствия заявленного изобретения условиям патентоспособности промышленной применимости, новизны и изобретательского уровня осуществляется на дату подачи евразийской заявки, а при испрашивании приоритета - на дату приоритета (см. пункт 2 Правила 47 Инструкции, правовая база приведена выше).

В описании оспариваемого патента, а также в описании заявки (по которой был выдан оспариваемый патент) на дату ее подачи содержатся сведения о том, что «данное изобретение относится к способам осуществления разделения хиральных солей из рацемических смесей энантиомеров и, в частности, предшественников энантиомеров, используемых для получения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрила и его фармацевтически приемлемых солей, используемых в качестве ингибиторов протеинкиназ, таких как фермент киназа 3 Janus» (см. стр. 2 описания заявки, стр. 1 описания патента), «Данное изобретение относится к способам разделения энантиомеров предшественников, используемых для получения

3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила», «Данное изобретение также относится к получению стереоспецифических фармацевтически приемлемых кислотно-аддитивных солей соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила. Данное изобретение также относится к получению стереоспецифических фармацевтически приемлемых кислотно-аддитивных солей соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила», «Кислоты, которые используются для получения фармацевтически приемлемых кислотно-аддитивных солей, упомянутых выше основных соединений данного изобретения, представляют собой кислоты, которые образуют нетоксичные кислотноаддитивные соли, т.е., соли, содержащие фармакологически приемлемые анионы, такие как гидрохлорид, гидробромид, гидройодид, нитрат, сульфат, бисульфат, фосфат, кислый фосфат, ацетат, лактат, цитрат, кислый цитрат, тартрат, битартрат, сукцинат, малеат, фумарат, глюконат, сахарат, бензоат, метансульфонат, этансульфонат, бензолсульфонат, паратолуолсульфонат и памоат [т.е. 1,1'-метилен-бис-(2-гидрокси3-нафтоат)] (см. стр. 1-6 описания заявки, стр. 1 описания патента).

Описание оспариваемого патента содержит информацию о применении соединения по оспариваемому патенту в композиции «для (а) лечения или предотвращения заболевания или состояния, выбранного из отторжении органов при трансплантации, ксенотрансплантации, волчанки обыкновенной, рассеянного склероза, ревматоидного артрита, псориаза, диабета типа I и осложнений, связанных с диабетом, рака, астмы, атонического дерматита, аутоиммунных нарушений щитовидной железы, язвенных колитов, болезни Крона, болезни Альцгеймера, лейкемии и других аутоиммунных заболеваний или (b) ингибирования протеинкиназ или киназы 3 Janus (JAK3) у млекопитающих, включая человека, содержащая эффективное для таких

нарушений или состояний количество описанного соединения или его фармацевтически приемлемой соли, и фармацевтически приемлемый носитель» (см. стр. 1 описания к патенту, стр. 17 описания заявки).

Таким образом, можно признать, что указание на назначение изобретения по оспариваемому патенту содержится как в описании оспариваемого патента, так и в описании заявки на дату ее подачи.

Что касается средств и методов, необходимых для осуществления изобретения по оспариваемому патенту (в данном случае получения соединения «3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрил или его фармацевтически приемлемой соли»), то сведения о получении упомянутого соединения содержатся в описании заявки на дату ее подачи.

Получение фармацевтически приемлемых солей биологически активных соединений основаны на общеизвестных рутинных методах, в частности, на смешении основания с подходящим солеобразователем.

На основании изложенного, можно констатировать, что в возражении не представлено доводов, позволяющих сделать вывод о несоответствии изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость».

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна», показал следующее.

В силу пункта 1 Правила 3 Патентной инструкции изобретение признается новым, если оно не является частью предшествующего уровня техники. Объекты, являющиеся частью предшествующего уровня техники, для определения новизны изобретения могут учитываться лишь отдельно.

Предшествующий уровень техники включает все сведения, ставшие общедоступными в мире до даты подачи евразийской заявки, а если испрашен приоритет - до даты ее приоритета.

Для целей проверки новизны изобретения предшествующий уровень техники включает также содержание любой заявки на выдачу евразийского патента в той редакции, в которой она была подана на дату ее подачи, при условии, что эта заявка или выданный по ней евразийский патент впоследствии будут опубликованы в установленном порядке и что дата подачи такой заявки или, если испрашен приоритет, дата ее приоритета предшествует соответствующей дате, указанной в абзаце третьем пункта 1 правила 3 Патентной инструкции.

Содержание международной заявки включается в предшествующий уровень техники с даты ее подачи или с даты приоритета, если он испрашен, в случае выполнения требований пункта 1 правила 71 Патентной инструкции.

Согласно пункту 2 правила 47 Патентной инструкции при проверке соответствия заявленного изобретения условию патентоспособности «новизна» устанавливается, является ли это изобретение частью предшествующего уровня техники.

Как указано в пункте 2 правила 47 Патентной инструкции, изобретение не признается соответствующим условиям новизны, если в предшествующем уровне техники выявлены сведения об объекте, который имеет технические признаки, идентичные всем техническим признакам изобретения, содержащимся в независимом пункте формулы изобретения. Согласно пункту 5.6 Правил ЕАПВ международная заявка входит в предшествующий уровень техники с даты ее подачи или с даты приоритета, если заявитель представил перевод международной заявки на русский язык.

Заявка ЕА 200200506 [1] является переводом заявки РСТ/IB2000/001742, опубликованной как WO2001/042246 на региональную фазу и входит в уровень техники.

По заявке [1] установлен приоритет от 10.12.1999 по дате подачи заявки US 60/170.179. Датой подачи заявки [1] является дата 23.11.2000, установленная по дате подачи заявки РСТ IB 2000/001742 (WO 2001042246 от 14.06.2001 A2).

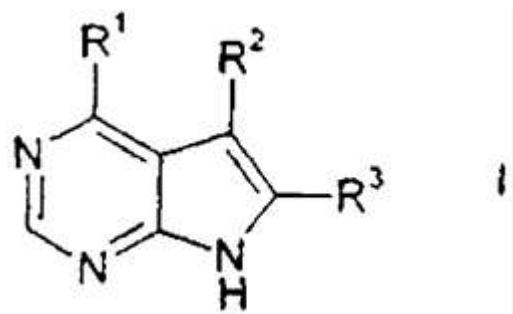
Таким образом, дата приоритета и дата подачи заявки [1] (10.12.1999 и 23.11.2000) предшествуют соответствующим датам приоритета (31.05.2001 и 06.12.2001) и дате подачи (29.05.2002) заявки на изобретение по оспариваемому патенту, поскольку патент ЕА 7251 выдан по заявке ЕА № 200301193, с датой подачи 29.05.2002, с конвенционными приоритетами от 31.05.2001 и 06.12.2001, установленными по дате подачи заявок US 60/294,775 и US 60/341,048 соответственно. Кроме того, дата публикации заявки PCT WO 2001042246 от (14.06.2001) предшествует одной из дат приоритета (06.12.2001) заявки на изобретение по оспариваемому патенту.

Правомерность включения заявки [1] в уровень техники для целей проверки условия патентоспособности “новизна” изобретения по оспариваемому патенту также подтверждена Судом по интеллектуальным правам.

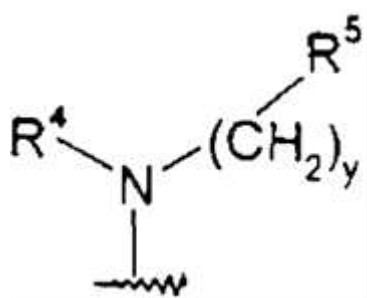
Согласно реестру евразийских патентов, изобретение по оспариваемому патенту названо как «3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрил и его фармацевтически приемлемые соли».

Формула изобретения по оспариваемому патенту состоит из одного независимого пункта формулы на «Соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-оксoproпионитрил или его фармацевтически приемлемая соль» (см. формулу изобретения по оспариваемому патенту). При этом альтернативный признак «его фармацевтически приемлемая соль» выражен общим понятием и включает в себя любую фармацевтически приемлемую соль.

Согласно описанию заявки, по которой был выдан оспариваемый патент «Данное изобретение относится к способам разделения энантиомеров предшественников, используемых для получения соединения следующей формы и, в частности, его группы R1



или его фармацевтически приемлемой соли, где R¹ представляет собой группу формулы



где y представляет собой 0, 1 или 2 (см. стр. 2 описания).

Согласно описанию оспариваемого патента «данное изобретение относится к способам разделения энантиомеров предшественников, используемых для получения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрила», «данное изобретение также относится к получению стереоспецифических фармацевтически приемлемых кислотно-аддитивных солей соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрила», «данное изобретение также относится к получению стереоспецифических фармацевтически приемлемых кислотно-аддитивных солей соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксoproпионитрила» (см. описание).

Далее в описании изобретения по оспариваемому патенту содержатся сведения о способах разделения энантиомеров. Как уже сказано выше, объем правовой охраны определяется формулой (см. статья 10 Конвенции), которая

охарактеризована по оспариваемому патенту наличием соединения или его фармацевтически приемлемой соли (см. формулу изобретения выше).

Анализ информации, содержащейся в заявке [1] показал, что из данной заявки известно соединение 3-{ -4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемые соли.

В примере 14, представленном в заявке [1] указан рацемат этого соединения, а именно 3-{ -4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-оксопропионитрил.

Соединение 3-{ -4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-оксопропионитрил имеет структурную формулу идентичную формуле соединения 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил по оспариваемому патенту.

В описании заявки [1] содержатся сведения о том, что соединения по изобретению, в том числе, соединение 3-{ -4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-оксопропионитрил «включают в себя все конформационные изомеры (например, цис-и транс-изомеры)», «имеют асимметрические центры и, следовательно, существуют в различных энантиомерных и диастереомерных формах» (см. стр.7-8 описания). Кроме того, в заявке [1] указано, что данное изобретение относится «к применению всех оптических изомеров и стереоизомеров и их смесей и ко всем фармацевтическим композициям и способам лечения, которые могут применять или содержать их...соединения формулы I могут также существовать как таутомеры. Это изобретение относится к применению всех таких таутомеров и их смесей».

Исходя из сведений, содержащихся в источнике [1], соединение 3-{ -4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-оксопропионитрил, описанное в заявке [1], является рацематом и как указано в

заявке [1], может находиться в «любой» энантиомерной и диастомерной форме».

Судом по интеллектуальным правам установлено, что в заявке [1] не содержится указания на энантиомерную форму соединения 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-оксопропионитрил. Так, соединение 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил по оспариваемому патенту является новым по отношению к известному из заявки [1] соединению 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил, поскольку в заявке [1] не описано получение каких-либо изомерных форм соединения 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил.

Судом первой инстанции установлено, что в источнике [1] (заявка на выдачу евразийского патента ЕА200200506), который согласно положению правила 3(1) Инструкции входит в уровень техники для целей проверки новизны, раскрыто соединение в форме рацемата, но не указан конкретный 3R, 4R энантиомер, охватываемый формулой спорного изобретения. Президиум Суда по интеллектуальным правам подтвердил правомерность включения данного источника [1] в целях проверки изобретения по оспариваемому патенту на его соответствие условию патентоспособности «новизна», а также установил, что индивидуальное соединение по оспариваемому патенту, не описанное как таковое в противопоставленном источнике, соответствует условию патентоспособности "новизна. Так, в Постановлении президиума Суда по интеллектуальным правам указано «... рацемат не может порочить новизну индивидуального стереоизомера (энантиомера), несмотря на то что наличие различных конфигурационных изомеров гипотетически подразумевается в рацемическом соединении... указание в общем виде на все оптически активные

формы не может порочить новизну энантиомеров, если они не были специально получены и изучены» (стр. 16-18 постановления президиума СИП).

На основании вышеизложенного, с учетом вывода президиума Суда по интеллектуальным правам о неизвестности из уровня техники, в частности, из заявки [1] объекта, охарактеризованного признаками, идентичными признаками запатентованного соединения, изобретение по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности «новизна».

При этом вопрос о том, проявляет ли соединение новые неизвестные свойства в качественном и количественном отношении не входит в состав проверки «новизны», а подлежит проверке при оценке изобретательского уровня согласно пункту 4.6 Правил ЕА.

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Согласно пункту 1 правила 3 Инструкции изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста очевидным образом не следует из предшествующего уровня техники. Предшествующий уровень техники включает все сведения, ставшие общедоступными в мире до даты подачи евразийской заявки, а если испрашен приоритет, - до даты ее приоритета.

Согласно пункту 2 Правила 3 Инструкции не признается обстоятельством, препятствующим признанию патентоспособности изобретения, такое раскрытие информации, относящейся к изобретению, изобретателем, заявителем или любым лицом, получившим от них прямо или косвенно эту информацию, при котором сведения о сущности изобретения стали общедоступными не ранее чем за шесть месяцев до даты подачи евразийской заявки или до даты приоритета, если он испрашен. При этом обязанность доказывания обстоятельств раскрытия информации лежит на заявителе.

Изобретение по оспариваемому патенту относится к области фармацевтики и органической химии, в частности к соединению 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-амино]-пиперидин-1-ил}-3-оксо-пропионитрил, имеющему международное непатентованное наименование (МНН) - тофацитиниб, и к его фармацевтически приемлемым солям.

Данное соединение является оптически активным 3R, 4R стереоизомером (энантиомером) соединения 3-(4-метил-3-[метил-(7H-пирроло [2,3 - d]пиримидин-4-ил)-амино] -пиперидин-1-ил)-3-оксо-пропионитрил. Данное соединение и его соли используются в качестве ингибиторов протеинкиназ, таких как фермент Janus киназа 3 (JAK3), что обуславливает их применение в качестве иммуносупрессоров.

Технический результат изобретения заключается в расширении арсенала средств и совпадает с назначением, указанным в описании к оспариваемому патенту – получение индивидуального энантиомера соединения 3-{(3R, 4R)-4-метил-3-[метил-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила (далее - тофацитиниб) и его фармацевтически приемлемых солей, используемых в качестве ингибитора протеинкиназы киназы JAK3.

Как уже отмечено выше с целью толкования положений Конвенции и Патентной Инструкции используются Правила ЕА. Согласно пункту 4.6. Правил ЕА проверка изобретения на соответствие условию патентоспособности «изобретательский уровень» включает:

- выявление наиболее близкого аналога (прототипа);
- выявление признаков, отличающих заявленное изобретение от прототипа;
- определение технических решений, характеризуемых этими признаками;
- установление известности этих технических решений.

В результате анализа независимого пункта формулы изобретения может быть установлено: а) все содержащиеся в нем признаки изобретения имеют отношение к достижению заявленного технического результата. В этом случае

установление соответствия изобретения по этому пункту условию патентоспособности «новизна», как правило, одновременно означает соответствие этого изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Согласно пункту 1.4.3. Правил ЕА, в качестве наиболее близкого аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений, ставших общедоступными до даты подачи заявки или даты приоритета изобретения, если он испрошен, характеризуемое совокупностью признаков, сходной с совокупностью признаков изобретения.

Согласно пункту 1.4.4. Правил ЕА, техническим результатом может являться расширение арсенала средств, актуальных в какой-либо области деятельности или получение таких средств впервые.

Согласно указаниям президиума СИП, изложенным в постановлении от 13.02.2025, Роспатент обязан повторно рассмотреть возражение Общества с учетом выводов президиума СИП, и проанализировать доводы сторон и противопоставленные источники информации [2]-[21] в целях оценки изобретения по спорному патенту на соответствие его условию патентоспособности «изобретательский уровень».

По мнению лица, подавшего возражение (см. дополнительные материалы от 17.04.2025), для изобретения по оспариваемому патенту приоритет по первоначальным заявкам США №60/2946775 от 31.05.2001 и США №60/341048 от 06.12.2001 установлен неверно, поскольку в приоритетной заявке США №60/2946775 от 31.05.2001 не был раскрыт пример получения соединения по оспариваемому патенту.

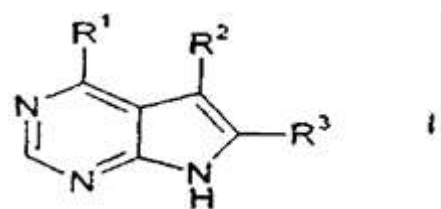
Целесообразно отметить, что Роспатент уже признал правомерность установления приоритета оспариваемого изобретения по заявке США от 31.05.2001. При этом факт установления данного приоритета не был оспорен в Суде по интеллектуальным правам и им не отклонен.

Таким образом, Роспатентом уже было установлено и не оспорено в Суде по интеллектуальным правам, что материалы приоритетной заявки США №60/2946775 от 31.05.2001 содержат все признаки соединения тофацитиниб по оспариваемому патенту.

В случае установления приоритета по дате подачи более поздней приоритетной заявки US 60/341,048 от 06.12.2001, международная публикация WO 2001/042246 с датой публикации 14.06.2001, не входит в уровень техники для целей оценки патентоспособности изобретения по оспариваемому патенту в силу правила 3(2) Инструкции (см. выше), поскольку заявителем международной публикации WO 2001/042246 является то же лицо, что и патентообладатель по оспариваемому патенту (компания Пфайзер Продактс Инк.), а авторы изобретения (Флэнган Марк Эдвард и Манчхов Майкл Джон) также являются авторами изобретения по оспариваемому патенту.

При этом публикация международной публикации состоялась 14.06.2001, то есть, не ранее чем за шесть месяцев до даты 06.12.2001, и не может быть противопоставлена для оценки патентоспособности изобретения по оспариваемому патенту.

Согласно возражению, в качестве ближайшего аналога изобретению по оспариваемому патенту рассматривается известное из источника [2] соединение



или его фармацевтически приемлемая соль. В оспариваемом патенте приведены примеры 1-6 специфичного синтеза соединения по оспариваемому патенту из соединений предшественников. При этом указанные соединения-предшественники сначала подвергали разделению с целью выделения чистых 3R, 4R энантиомеров.

Само соединение в рацемической форме 3-(4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}- 3-оксопропионитрил до даты приоритета изобретения по оспариваемому патенту в источниках [2]-[21] раскрыто не было.

Согласно переводу источника [2] « R^5 представляет собой R^{14} , $R^{14}(C_1-C_6)$ алкил или $R^{14}(C_3-C_{10})$ циклоклакил, где R^{14} является (C_2-C_9) гетероциклоалкилом, (C_1-C_6) ацилпиперазино, (C_6-C_{10}) арилпиперазино, (C_5-C_9) гетероарилпиперазино, (C_1-C_6) алкилпиперазино, (C_6-C_{10}) арил (C_1-C_6) алкилпиперазино, (C_5-C_9) гетероарил (C_1-C_6) алкилпиперазино, морфолино, тиоморфолино, пиперидино, пирролидино, пиперидилом, (C_1-C_6) алкилпиперидинилом, (C_6-C_{10}) арилпиперидилом, (C_5-C_9) гетероарилпиперидилом, (C_6-C_{10}) арил (C_1-C_6) алкилпиперидилом, (C_5-C_9) гетероарил (C_1-C_6) алкилпиперидилом или (C_1-C_6) ацилпиперидилом».

В источнике [2] не содержится примеров полученного соединения, где R_5 представляет замещенный или незамещенный пиперидинил.

Отличительным признаком оспариваемого соединения от соединений, раскрытых в источнике информации [2], является:

- радикал R_5 представляет собой пиперидинильное кольцо, замещенное двумя заместителями: метилом и карбоксильной группой, непосредственно соединенной через атом углерода с циано-группой на конце;
- соединение является 3R, 4R энантиомером.

Указанные отличительные признаки не известны из приведённых в возражении источников информации [2]-[16], в которых также не раскрыты соединения с ингибирующей JAK3 активностью. Кроме того, представленные в возражении источники [2]-[16] не раскрывают получение соединения по оспариваемому патенту в форме только одного энантиомера, охарактеризованного в оспариваемом патенте

Согласно примеру 2 описания к оспариваемому патенту, в качестве растворителя используют ди-пара-толуол-L-винную кислоту для получения 3R,

4R соединения-предшественника, но не для разделения рацемической смеси соединения CC(C(=O)N1CCCCC1)C#N 3-(4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил)- 3-оксопропионитрил.

При этом, согласно источнику [13] важнейшей задачей является подбор асимметрического реагента, а образуемые при его участии диастереомеры должны как можно сильнее различаться по растворимости или другим свойствам, если для разделения используют не кристаллизацию, а иные приемы (см. стр. 51), а известность винной кислоты в качестве растворителя не свидетельствует об очевидности применения другого растворителя - ди-пара-толуол-L-винной кислоты для выделения соединения по оспариваемому патенту, а источники [17], [18], [21] свидетельствуют о высокой ингибирующей JAK3 киназе активности рацемического тофацитиниба по сравнению с другими известными соединениями.

Представленные патентообладателем источники информации [19], [20] также не содержат сведений, позволяющих сделать вывод об очевидности для специалиста изобретения по оспариваемому патенту, исходя из представленного сторонами уровня техники.

Таким образом, можно констатировать, что возражение не содержит доводов, позволяющих признать изобретение по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 10.01.2022, действие на территории Российской Федерации евразийского патента на изобретение № 7251 сохранить в силе.
