

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

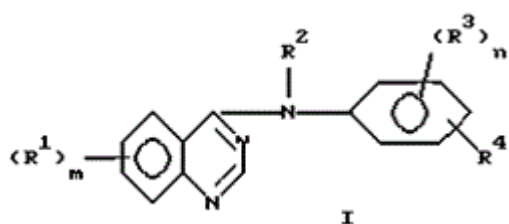
Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 321-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации и отдельные законодательные акты Российской Федерации» и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение ООО «РОЗЛЕКС ФАРМ» (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее 16.03.2018, против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2174977, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2174977 (далее – оспариваемый патент) на группу изобретений "Производные 4-(замещенного фениламино)хиназолина или их фармацевтически приемлемые соли, способ ингибирования рецепторной тирозинкиназы и фармацевтическая композиция", выдан по заявке № 96106055/04 на имя компании «ПФАЙЗЕР ИНК», США. Согласно регистрации договора об уступке патента Российской Федерации на изобретение (см. Договор № РД0006479 от 13.02.2006) патентообладателями на дату рассмотрения возражения являлись следующие компании: «ОСИ ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ, ИНК», США и «ПФАЙЗЕР ПРОДАКТС ИНК», США. В настоящее время, согласно записи в Государственном реестре изобретений, в результате перехода исключительного права от компании «ОСИ ФАРМАСЬЮТИКАЛЗ, ИНК.» (US) к правопреемнику «ОСИ

Фармасьютикалз, ЭлЭлСи» (US) (дата и номер государственной регистрации перехода исключительного права: 20.07.2018 № РП0008505) патентообладателями являются: ПФАЙЗЕР ПРОДАКТС ИНК. (US) и ОСИ Фармасьютикалз, ЭлЭлСи (US) (далее – патентообладатель).

Оспариваемый патент был выдан со следующей формулой изобретения:

«1. Производные 4-(замещенного фениламино)хиназолина формулы



в которой m представляет 1 или 2, n представляет 1 или 2, каждый R^1 независимо выбран из группы, состоящей из галогена; циано; гидроксигруппы; R^5 , нитро; амина; трифторметила, $C(=O)OR^5$, R^5O , необязательно замещенного галогеном, гидроксигруппы, (1-4)C алкокси, ацетокси, (1-4)C алкилпиперазинилом, морфолинилом, имидазолилом, 4-оксопиридилом или S(1-3)C алкилом, необязательно замещенным карбоксигруппой; SO_2R^5 , SR^5 , необязательно замещенного циано, (1-4)C алкокси, S(1-4)C алкилом или 4-цианогруппой; толуолсульфониламино, $NHSO_2R^5$, бензилсульфанила или фенилсульфанила, необязательно замещенного 1-2 атомами галогена; феноксигруппы, необязательно замещенного 1-2 заместителями, выбранными из галогена, (1-4)C алкила, (1-4)C алкокси, метансульфанила, метансульфанила и галогенфенилсульфанила; аллилсульфанила; винилокси, гуанидино и фталимидо (1-4)C алкилсульфониламино группы; или два R^1 фрагмента, взятые вместе в 6 и 7 положениях хиназолина, образуют метилendioксигруппу; и где алкильные группы или алкильные фрагменты указанных алкоксигрупп могут иметь прямую цепь и, если они составлены, по крайней мере, из трех атомов углерода, могут быть разветвленными;

R^2 представляет водород;

каждая группа R^3 независимо выбрана из водорода, галогена и (1-4)C

алкила;

R^4 представляет азидо или (2-4)С алкинил, где указанный алкинил необязательно замещен гидроксигруппой, аминогруппой или аминометильной группой;

R^5 представляет (1-4)С алкил;

или их фармацевтически приемлемые соли.

2. Соединение по п.1, в котором R^3 представляет водород, R^4 представляет этинил или азидо, каждый R^1 независимо выбран из карбометокси и (1-4)С алкокси, где алкокси необязательно замещен гидроксигруппой, галогеном, (1-4)С алкокси или ацетоксигруппой.

3. Соединение по п.1, выбранное из группы, состоящей из:

(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-[3-(3'-гидроксипропин-1-ил)фенил]-амин,

[3-(2'-(аминометил)этинил)фенил]-(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-амин,

[3-этинилфенил]-(6-нитрохиназолин-4-ил)-амин,

(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-(4-этинилфенил)-амин,

(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-(3-этинил-2-метилфенил)-амин,

(6-аминохиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(3-этинилфенил)-(6-метансульфониламинохиназолин-4-ил)-амин,

(3-этинилфенил)-(6,7-метилендиоксихиназолин-4-ил)-амин,

(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-(3-этинил-6-метилфенил)-амин,

(3-этинилфенил)-(7-нитрохиназолин-4-ил)-амин,

(3-этинилфенил)-[6-(4'-толуолсульфониламино)хиназолин-4-ил]-амин,

гидрохлорид (3-этинилфенил)-{6-[2'-фталимидо-1'-этил-сульфонил-амино]хиназолин-4-ил}-амина,

(3-этинилфенил)-(6-гуанидинохиназолин-4-ил)-амин,

(7-аминохиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(3-этинилфенил)-(7-метоксихиназолин-4-ил)-амин,

(6-карбометоксихиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(7-карбометоксихиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

[6,7-бис(2-метоксиэтокси)хиназолин-4-ил]-(3-этинилфенил)-амин,

(3-азидофенил)-(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-амин,
(3-азидо-5-хлорфенил)-(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-амин,
(4-азидофенил)-(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-амин,
(3-этинилфенил)-(6-метансульфонил-хиназолин-4-ил)-амин,
(6-этансульфанил-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,
(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-(3-этинил-4-фтор-фенил)-амин,
(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-[3-(пропин-1'-ил-фенил)]-амин,
[6,7-бис(2-метокси-этокси)-хиназолин-4-ил] - (5-этинил-2-метил-фенил)-
амин,
[6,7-бис(2-метокси-этокси)-хиназолин-4-ил]-(3-этинил-4-фтор-фенил)-амин,
[6,7-бис(2-хлор-этокси)-хиназолин-4-ил]-(3-этинилфенил)-амин,
[6-(2-хлор-этокси)-7-(2-метокси-этокси)хиназолин-4-ил]-(3-этинилфенил)-
амин,
[6,7-бис-(2-ацетокси-этокси)-хиназолин-4-ил]-(3-этинилфенил)-амин,
2-[4-(3-этинил-фениламино)-7-(2-гидрокси-этокси)-хиназолин-6-ил-окси] -
этанол,
6-(2-ацетокси-этокси)-4-(3-этинил-фениламино)-7-(2-метокси-этокси)-
хиназолин,
[7-(2-хлор-этокси)-6-(2-метокси-этокси)-хиназолин-4-ил] - (3-этинилфенил)-
амин,
[7-(2-ацетокси-этокси)-6-(2-метокси-этокси)-хиназолин-4-ил]-(3-
этинилфенил)-амин,
2-[4-(3-этинил-фениламино)-7-(2-метокси-этокси)-хиназолин-6-ил-окси] -
этанол,
2-[4-(3-этинил-фениламино)-6-(2-метокси-этокси)-хиназолин-7-ил-окси] -
этанол,
(3-этинилфенил)-{ 6-(2-метокси-этокси)-7-[2-(4-метил-пиперазин-1-ил)-
этокси]-хиназолин-4-ил}-амин,
(3-этинилфенил)-[7-(2-метокси-этокси)-6-(2-морфолин-4-ил)-этокси)-
хиназолин-4-ил]-амин,(6,7-диэтоксихиназолин-4-ил)-(-3-этинилфенил)-

амин,

(6,7-дибутоксихиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(6,7-диизопропоксихиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(6,7-диэтоксихиназолин-4-ил)-(3-этинил-2-метил-фенил)-амин,

[6,7-бис(2-метокси-этокси)хиназолин-4-ил]-(3-этинил-2-метил-фенил)-амин,

4. Соединение по п.1, выбранное из группы, состоящей из:

(6,7-дипропокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(6,7-диэтокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинил-5-фтор-фенил)-амин,

(6,7-диэтокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинил-4-фтор-фенил)-амин,

(6,7-диэтокси-хиназолин-4-ил)-(5-этинил-2-метил-фенил)-амин,

(6,7-диэтокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинил-4-метил-фенил)-амин,

(6-аминометил-7-метокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(6-аминокарбонилметил-7-метокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(6-аминокарбонилэтил-7-метокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(6-аминокарбонилметил-7-этокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(6-аминокарбонилэтил-7-этокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(6-аминокарбонилметил-7-изопропокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-

амин,

(6-аминокарбонилметил-7-пропокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-

амин,

(6-аминокарбонилэтил-7-изопропокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-

амин,

(6-аминокарбонилэтил-7-пропокси-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин.

5. Соединение по п.3, выбранное из группы, состоящей из:

(6,7-диэтоксихиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(3-этинилфенил)-[6-(2-гидрокси-этокси)-7-(2-метокси-этокси)-хиназолин-4-ил]-амин,

[6,7-бис-(2-гидрокси-этокси)-хиназолин-4-ил]-(3-этинилфенил)-амин,

[6,7-бис-(2-метокси-этокси)-хиназолин-4-ил]-(3-этинилфенил)-амин,

(6,7-диметоксихиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин,

(3-этинилфенил)-(6-метансульфониламино-хиназолин-4-ил)-амин,
(6-амино-хиназолин-4-ил)-(3-этинилфенил)-амин.

6. Способ ингибирования рецепторной тирозинкиназы с помощью введения млекопитающему ингибирующего вещества, при этом в качестве ингибирующего вещества используют соединение по п.1, в эффективном количестве.

7. Фармацевтическая композиция, обладающая антипролиферативной активностью и содержащая активный агент и фармацевтически приемлемый носитель, отличающаяся тем, что в качестве активного агента она содержит терапевтически эффективное количество соединения по п. 1».

В соответствии с пунктом 3 статьи 3 Патентного Закона Российской Федерации срок действия оспариваемого патента продлен до 25.03.2021 в отношении независимых пунктов 1, 7 формулы изобретения, о чем свидетельствует запись в Государственном реестре изобретений (см. Код раздела: ND4A, извещение опубликовано 27.04.2007, БИ: 12/2007, с поправками, согласно извещению от 10.05.2007, БИ: 13/2007).

Таким образом, на дату подачи возражения оспариваемый патент, в результате продления его срока действия, действовал в отношении независимых пунктов 1, 7 формулы изобретения

Против выдачи данного патента, в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса, было подано возражение, мотивированное несоответствием изобретения в объеме независимого пункта 1 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость».

Поскольку оспариваемый патент продлен в отношении упомянутого независимого пункта 1 формулы изобретения, то проверка заинтересованности согласно статье 1398 Кодекса, не проводится.

По мнению лица, подавшего возражение, в описании к оспариваемому патенту отсутствуют сведения, подтверждающие возможность получения производных 4-(замещенного фениламино) хиназолина.

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

Патентообладатель представил отзыв по мотивам возражения.

Суть содержащихся в отзыве доводов сводится к следующему.

В описании к оспариваемому патенту приведено большое количество примеров, в которых показано получение множества соединений с приведением физико-химических характеристик, а также приведены сведения о биологических испытаниях 32-х соединений, подтверждающие их высокую активность в качестве ингибиторов тирозинкиназ.

К отзыву приложена скорректированная формула изобретения, которую патентообладатель просит принять к рассмотрению.

При этом патентообладатель обращает внимание на то, что представленная им формула изобретения «снимает все возражения оппонента», поскольку касается изменений в части удаления из объема притязаний по оспариваемому патенту альтернативных признаков (соединений) независимого пункта 1 формулы по оспариваемому патенту.

Копия отзыва также была представлена на заседании коллегии от 29.06.2018 и приобщена к протоколу заседания коллегии (см. приложение №2). Кроме того, от патентообладателя поступило ходатайство (см. приложение №4 к протоколу заседания коллегии) с просьбой не анализировать доводы возражения по существу.

От лица, подавшего возражение, поступило встречное ходатайство (см. приложение № 3 к протоколу заседания коллегии), в котором им было выражено согласие с уточненной патентообладателем формулой изобретения без оценки доводов возражения по существу.

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения возражения, коллегия палаты по патентным спорам установила следующее.

С учетом даты подачи заявки (29.03.1996), на основании которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для проверки патентоспособности

группы изобретений по указанному патенту включает Патентный закон Российской Федерации от 23 сентября 1992 г. № 3517-1 (далее – Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатентом от 20.09.1993, зарегистрированными в Минюсте РФ 05.11.1993, № 386 (далее - Правила ИЗ).

Согласно пункту 1 статьи 4 Закона изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо. Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности.

Согласно подпункту 1 пункта 3.3.1 Правил ИЗ формула изобретения предназначается для определения объема правовой охраны, предоставляемой патентом.

Согласно подпункту 3 пункта 3.2.4.5. Правил ИЗ если изобретение относится к группе (ряду) новых индивидуальных химических соединений с установленной структурой, описываемых общей структурной формулой, подтверждается возможность получения всех соединений группы (ряда) путем приведения общей схемы способа получения, а также примера получения конкретного соединения группы (ряда), а если группа (ряд) включает соединения с разными по химической природе радикалами - примеров, достаточных для подтверждения возможности получения соединений с этими разными радикалами. Для полученных соединений приводятся также их структурные формулы, подтвержденные известными методами, физико-химические константы, доказательства возможности реализации указанного назначения с подтверждением такой возможности в отношении некоторых соединений с разными по химической природе радикалами. Если новые соединения являются биологически активными, приводятся показатели активности и токсичности для этих соединений, а в случае необходимости - избирательности действия и другие показатели.

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

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.1 Правил ИЗ при установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения. Проверяется также, описаны ли средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в независимом пункте формулы изобретения. При отсутствии таких сведений допустимо, чтобы указанные средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения. Кроме того, следует убедиться, что в случае осуществления изобретения действительно возможна реализация указанного заявителем назначения.

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

При несоблюдении хотя бы одного из указанных требований делается вывод о несоответствии изобретения условию промышленной применимости.

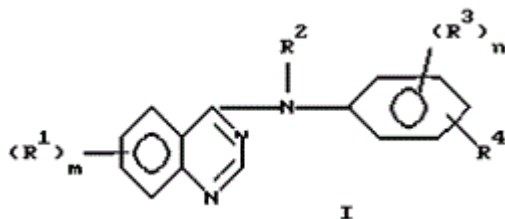
Согласно подпункту 3 пункта 19.5.4 Правил ИЗ, если заявлена группа изобретений, проверка патентоспособности проводится в отношении каждого из входящих в нее изобретений. Патентоспособность группы может быть констатирована только тогда, когда патентоспособны все изобретения группы.

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

Анализ доводов сторон показал следующее.

На дату 16.03.2018 подачи возражения оспариваемый патент действовал в части пунктов 1, 7 формулы, приведенной выше, действие которых, согласно сведениям из БИ № 13/2007, код раздела ND4A, продлено до 25.03.2021.

Независимый пункт 1 формулы по оспариваемому патенту относится к производным 4-(замещенного фениламино)хиназолина формулы



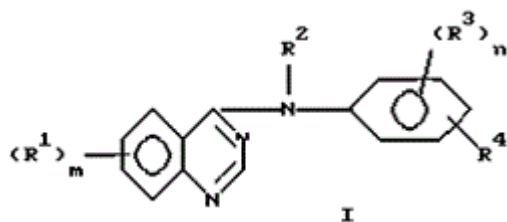
Независимый пункт 7 формулы по оспариваемому патенту относится к фармацевтической композиции, содержащей в качестве активного агента терапевтически эффективное количество соединения по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту.

Лицом, подавшим возражение, оспаривался только независимый пункт 1 указанной формулы изобретения в части альтернативных соединений, касающихся производных 4-(замещенного фениламино) хиназолина.

Как уже говорилось выше, на заседании коллегии, состоявшемся 29.06.2018 между сторонами спора было достигнуто мирное урегулирование спора, разрешенное путем корректировки формулы изобретения патентообладателем (см. приложения №№ 2 и 4 к протоколу заседания коллегии) и согласия лица, подавшего возражение с представленной формулой изобретения и выраженным мнением не осуществлять оценку приведенных им в возражении доводов (см. приложение № 3 к протоколу заседания коллегии).

Тем не менее, можно согласиться с доводами лица, подавшего возражение в том, что в отношении некоторых альтернативных соединений, приведенных в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту, не подтверждена возможность их получения.

Это относится к производным 4-(замещенного фениламино)хиназолина формулы



имеющих следующие химические радикалы:

R_1 = гидроксигруппа,

$R_1 = R_{50}$, где R_{50} замещен S(1-3)C алкилом [согласно п. 1 формулы изобретения R_{50} имеет только одно значение — (1-4)C алкил],

$R_4 = (2-4)C$ алкинил, замещенный аминогруппой.

Получение соединений с указанными значениями радикалов не подтверждено какими-либо примерами по оспариваемому патенту и не может быть осуществлено в соответствии с общими схемами, имеющимися в описании изобретения к оспариваемому патенту.

Патентообладателем не представлено сведений о наличии в уровне техники информации об органических соединениях, в частности, хиназолинах, содержащих химическую группу с двумя атомами углерода вида $R^4 = -C=C-NH_2$, как и о их химическом синтезе.

В частности, в описании к оспариваемому патенту отсутствуют примеры получения таких соединений, где:

(2-4)C алкинил, замещ. амино- с номером радикала R_4 ;

гидроксигруппа - с номером радикала R_1 ;

R_{50} , где R_{50} имеет заместитель S(1-3)C алкил - с номером радикала R_1 .

М Также отсутствуют наименования указанных соединений.

Таким образом, в возражении представлены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту в части производных 4-(замещенного фениламино)хиназолина по независимому пункту 1 формулы изобретения, имеющих вышеуказанные

значения химических радикалов, несоответствующим условию патентоспособности "промышленная применимость".

Коллегия в соответствии с пунктом 4.9 Правил ППС предложила патентообладателю уточнить формулу изобретения по оспариваемому патенту.

Патентообладатель представил скорректированный вариант формулы изобретения, исключив из независимого пункта 1 формулы часть альтернативных признаков (см. приложение к данному заключению ниже).

Уточненная патентообладателем формула изобретения была принята коллегией к рассмотрению.

Направления материалов заявки для проведения дополнительного информационного поиска не требовалось, поскольку формула изобретения скорректирована путем исключения альтернативных признаков.

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

удовлетворить возражение, поступившее 16.03.2018, патент Российской Федерации на изобретение № 2174977 признать недействительным частично и выдать новый патент Российской Федерации с уточненной патентообладателем формулой изобретения.

(21) 0096106055/04

(51) МПК 6

C07D239/94

C07D403/12

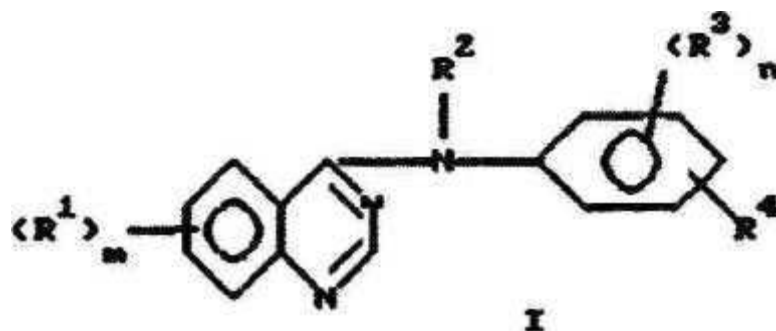
C07D413/12

C07D491/056

A 61 K31/505 (2006.01)

(54) (57)

«1. Производные 4-(замещенного фениламино)хиназолина формулы



в которой m представляет 2,

n представляет 1,

каждый R1 выбран из группы, состоящей из R50, замещенного (1-4)С алкокси;

R2 представляет водород;

группа R3 выбрана из водорода;

R4 представляет (2-4)С алкинил;

R5 представляет (1-4)С алкил;

или их фармацевтически приемлемые соли.

2. Фармацевтическая композиция, обладающая антипролиферативной активностью и содержащая активный агент и фармацевтически приемлемый

носитель, отличающаяся тем, что в качестве активного агента она содержит терапевтически эффективное количество соединения по п.1».

WO 95/03283 A, 02.02.1995

EP 0520722 A1, 30.12.1992

EP 0566266 A1, 20.10.1993

SU 40048 A, 1973

SU 466233 A, 1975

При публикации сведений о выдаче патента будет использовано описание в редакции заявителя с уточненным названием изобретения.