

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, 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-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}}-3-оксопропионитрил 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].

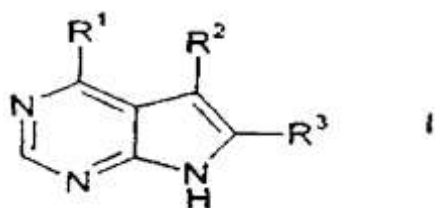
Доводы лица, подавшего возражение, сводятся к следующему.

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

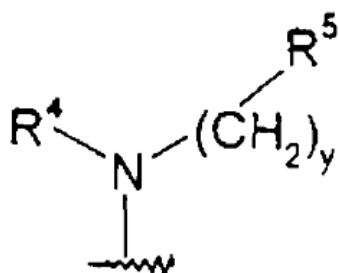
Суть приведенных в возражении доводов, касающихся несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» сводится к следующему.

Из заявки [2] известно соединение со структурной формулой



или его фармацевтически приемлемая соль,

где R1 представляет группу формулы



где y означает 0 или 1.

Какой-либо технический результат, обеспечиваемый 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. 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. При этом какая-либо оценка активности именно такой формы по сравнению с другими энантиомерами 3-{(4-метил-3-[метил-(7Н-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.

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 №007251, 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]);

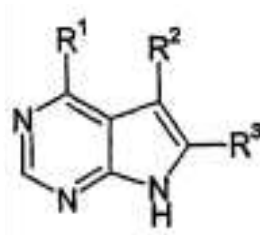
- Декларация доктора Марка Эдварда Фланагана с переводом на русский язык. Приложение 5 к отзыву (далее -[19]);

- 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-охopropanenitrile (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]).

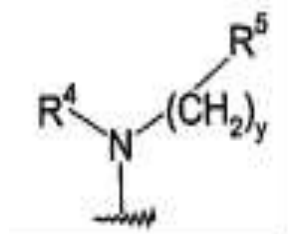
По мнению патентообладателя, все признаки формулы изобретения по оспариваемому патенту, в частности, альтернативный признак «фармацевтически приемлемая соль» содержатся как в описании патента, так и в Заявке на дату ее подачи. В обоснование данного довода патентообладатель приводит, в частности, следующие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

- на странице 2 заявки, по которой был выдан оспариваемый патента 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 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».

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-оксoproпионитрил 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.

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения возражения, коллегия палаты по патентным спорам 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 Договаривающемся государстве разрешается национальными судами или другими компетентными органами этого государства на основании настоящей Конвенции и Патентной инструкции. Решение имеет силу лишь на территории Договаривающегося 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 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 правила 71(1) 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.

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.

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.

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-с1]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.

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 отторжении 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 б) 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.

Что касается отсутствия данной альтернативы «или его фармацевтически приемлемая соль» в пункте 17 формулы, приведенной в заявке на дату ее подачи, то, действительно, пункт 17 формулы изобретения, представленной на стадии подачи заявки, содержит только перечисление конкретных соединений без указания на «фармацевтически приемлемые соли». Данная альтернатива «или его фармацевтически приемлемая соль» включена в формулу изобретения в результате переписки по делопроизводству и отражена в формуле изобретения по оспариваемому патенту (см. вышеприведенную формулу).

При этом согласно пункту 3 правила 49 Инструкции (см. правовая база выше) дополнение, уточнение или исправление описания и формулы изобретения, возможны только в случае, если такие дополнения, уточнения или исправление не выходят за пределы первоначальных материалов заявки, содержащихся на дату ее подачи, и не изменяют сущности изобретения.

Таким образом, указание в формуле изобретения по оспариваемому патенту на альтернативный признак «или его фармацевтически приемлемая соль» следует признать правомерным, поскольку он содержался в материалах заявки на дату ее подачи, 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-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрила 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 отторжения 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 (б) 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.

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.

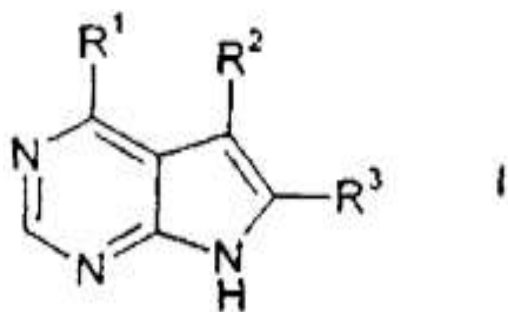
По заявке [1] установлен приоритет от 10.12.1999 по дате подачи заявки US 60/170.179. Датой подачи заявки [1] является дата 23.11.2000, установленная по дате подачи заявки РСТ IB 2000/001742 (WO 2001042246 от 14.06.2001 А2). Таким образом, дата приоритета и дата подачи заявки [1] (10.12.1999 и 23.11.2000) 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 РСТ WO 2001042246 от (14.06.2001) предшествует одной из дат приоритета (06.12.2001) заявки на изобретение по оспариваемому патенту.

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-оксопропионитрил и его фармацевтически приемлемые соли».

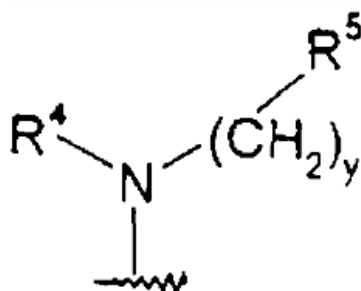
Формула изобретения по оспариваемому патенту состоит из одного независимого пункта формулы на «Соединение 3-{-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемая соль» (см. формулу изобретения по

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-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил» (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}-3-оксопропионитрил или его фармацевтически приемлемые соли.

Так, 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}-3-оксопропионитрил.

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-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}-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» (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».

Таким образом, соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил, описанное в заявке [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 [1], может находиться в «любой» энантиомерной и диастомерной форме».

Стоит согласиться с мнением патентообладателя в том, что в заявке [1], действительно, нет указания на энантиомерную форму соединения 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил. Однако, как уже сказано выше, в заявке [1] содержатся сведения о существовании данного соединения в различных энантиомерных формах.

При этом, целесообразно обратить внимание на то, что поскольку 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 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 оспариваемому патенту, не содержат данных о каких-либо новых свойствах запатентованного соединения, по сравнению с известным из заявки [1] соединением 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 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил по оспариваемому патенту.

Что касается альтернативного признака формулы оспариваемого патента «его фармацевтически приемлемая соль», то в пункте 8 формулы изобретения по заявке [1] указано 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. Таким образом, из заявки [1] также известны фармацевтически приемлемые соли соединения по оспариваемому патенту.

Можно также отметить, что ни в описании патента, ни в заявке [1] не содержится каких либо различий в назначении между запатентованным соединением 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 [1] соединением 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил.

Согласно заявке [1] соединения пирроло[2, 3-d]пиримидина, к которым относится соединение 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил, так же как и соединение по оспариваемому патенту применяются 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.

Доводы патентообладателя о том, 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 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, нельзя признать убедительными в связи со следующим.

Согласно действующему законодательству, объем охраны изобретения определяется формулой изобретения, по которой выдан патент.

В формуле изобретения по оспариваемому патенту указан лишь энантиомер 3-{(3R,4R)-4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил известного из заявки [1] соединения 3-{4-метил-3-[метил-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)амино]пиперидин-1-ил}-3-оксопропионитрил, а не способ получения этого энантиомера.

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 не может быть признано патентоспособным, поскольку это соединение входит в общую структурную формулу, указанную в заявке [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] (пункт 1 правила 3 Патентной Инструкции).

Ввиду сделанного выше вывода анализ доводов сторон и источников информации [2]-[21], в целях оценки изобретения по оспариваемому патенту на соответствие его условию патентоспособности «изобретательский уровень», не проводился.

Учитывая вышеизложенное, коллегия палаты по патентным спорам пришла к выводу о возможности:

удовлетворить возражение, поступившее 10.01.2022, действие евразийского патента на изобретение № 7251 на территории Российской Федерации признать недействительным полностью.
