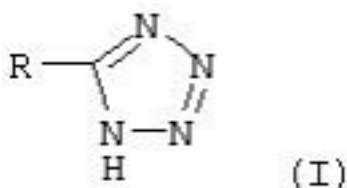


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии палаты по патентным спорам
по результатам рассмотрения возражения заявления

Коллегия палаты по патентным спорам в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 Гражданского кодекса Российской Федерации (далее – Кодекс) и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение НОВАРТИС АГ, Швейцария (далее – заявитель), поступившее в палату по патентным спорам 04.08.2008, на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности, патентам и товарным знакам (далее – Роспатент) об отказе в выдаче патента Российской Федерации по заявке на изобретение № 2006104322/04, при этом установлено следующее.

Заявлена группа изобретений «Способ получения производных тетразола из борорганических и алюминийорганических азидов», совокупность признаков которого изложена в уточненной заявителем, в корреспонденции, поступившей 28.10.2010, формуле изобретения в следующей редакции:

1. Способ получения тетразола формулы



или его таутомера или фармацевтически приемлемой соли, в которой R выбирается из группы, включающей:

- фенил, который является незамещенным или замещенным заместителем, выбранным из группы, включающей галоген или гидроксигруппу;
- бифенил, который является незамещенным или замещенным заместителем, выбранным из группы, включающей C₁-C₇алкил, гидроксис C₁-C₇алкил, формил или гидроксикарбонил;

- C₂-C₇алкенил, который является незамещенным или замещенным фенилом;
включающий

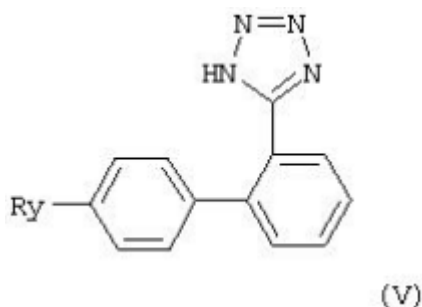
(i) проведение реакции соединения формулы R-CN (IIa) с азидом формулы (R₁)(R₂)M-N₃ (IIb), в которой R обладает определенным выше значением; R₁ и R₂ независимо друг от друга обозначают C₁-C₂₀алкил; и M обозначает алюминий; и

(ii) выделение полученного соединения формулы (I).

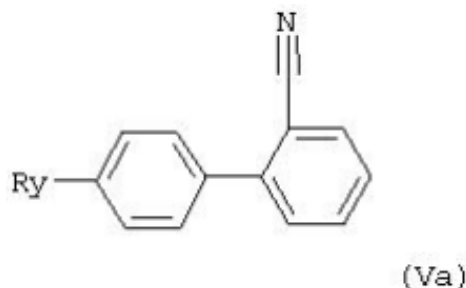
2. Способ по п.1, в котором R₁ и R₂ независимо друг от друга обозначают C₁-C₈-алкил.

3. Способ по п.1, где соединение формулы (IIb) выбирают из группы, включающей азид диметилалюминия, азид диэтилалюминия, азид диизопропилалюминия, азид дипропилалюминия, азид диизобутилалюминия и азид дибутилалюминия.

4. Способ получения соединения формулы

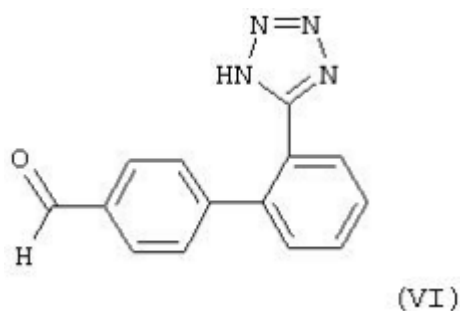


его таутомерной формы, в которой R_y обозначает C₁-C₇-алкил или C₁-C₇-алкил, замещенный гидроксигруппой, включающий проведение реакции соединения формулы (Va)

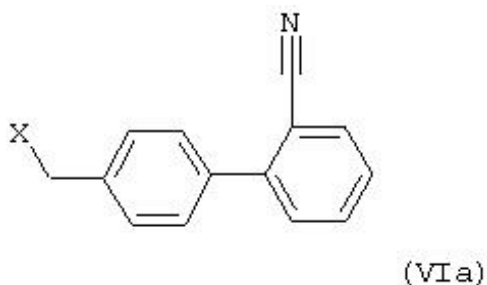


с азидом формулы (R₁)(R₂)M-N₃ (IIb), в которой R₁, R₂ и M имеют значения в соответствии с п.1 и выделение полученного соединения формулы (V).

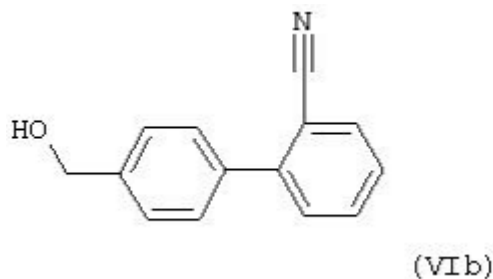
5. Способ получения соединения формулы (VI)



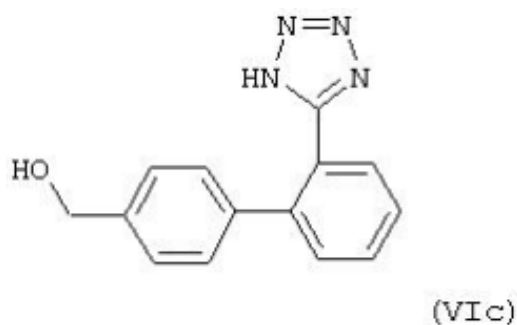
или его таутомера или его фармацевтически приемлемой соли, включающий
 (a) обработку соединения формулы (VIa)



в которой X обозначает галоген, сначала нуклеофильным агентом, представляющим собой соль щелочного металла C₂-C₁₀-алканкарбоновой кислоты, а затем "сольволитическим" основанием, представляющим собой гидроксид щелочного металла, приводящую к получению соединения формулы (VIb)



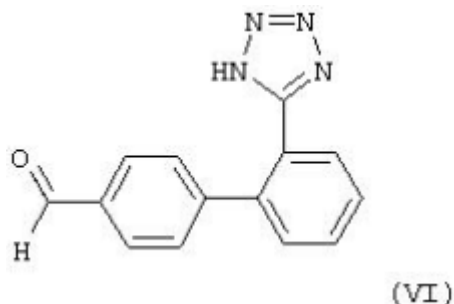
(b) проведение реакции соединения формулы (VIb) с азидом формулы (R₁)(R₂)M-N₃ (IIb), где R₁, R₂ и M имеют значения в соответствии с п.1, приводящей к получению соединения формулы (VIc)



или его таутомера или соли

(c) окисление соединения формулы (VIc) или его таутомера или соли,

приводящее к получению соединения формулы (VI)

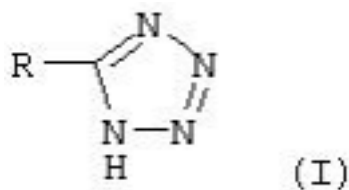


или его таутомера или соли; и

(d) выделение соединения формулы (VI) или его таутомера или соли.

6. Способ по п.5 или 6, в котором окисление проводят в присутствии окислительного реагента, выбранного из группы, включающей HNO_2 , HNO_3 и соответствующий их ангидрид и пероксодисульфат, и в присутствии растворителя, в качестве которого используется алкилированный ароматический углеводородный растворитель, такой как толуол.

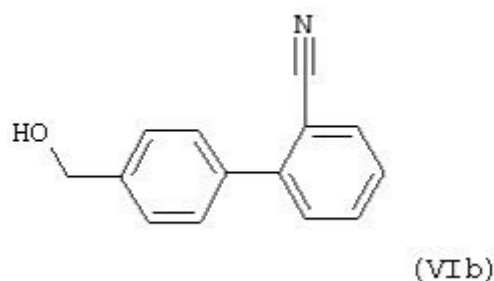
7. Способ получения соединения формулы (I)



или его таутомера или фармацевтически приемлемой соли, в которой R представляет собой бифенил, который является замещенным заместителем, представляющим собой гидроксис₁-С₇алкил;

включающий

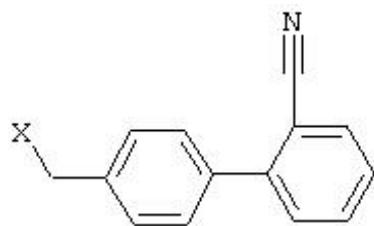
(i) проведения реакции соединения формулы (VIb)



или его соли с азидом формулы $(R_1)(R_2)M-N_3$ (IIb), где R_1 , R_2 и M имеют значения в соответствии с п.1, и

(ii) выделение полученного соединения формулы (I).

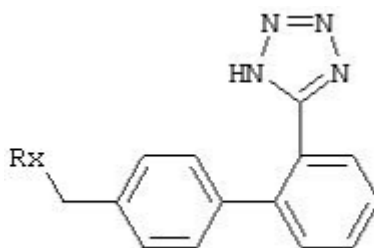
8. Способ по п.7, где соединение формулы (VIb) получают обработкой соединения формулы (VIa)



(VIa)

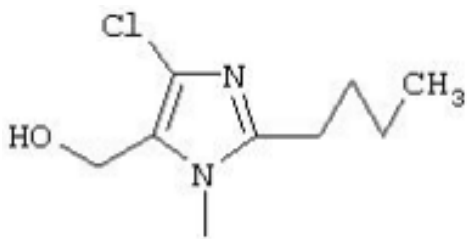
в которой X обозначает галоген, сначала нуклеофильным агентом, представляющим собой соль щелочного металла C₂-C₁₀-алканкарбоновой кислоты, а затем "сольволитическим" основанием, представляющим собой гидроксид щелочного металла.

9. Способ получения производного тетразола общей формулы (IV)

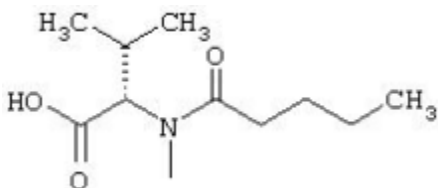


(IV)

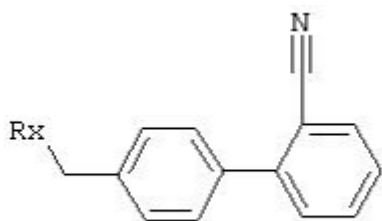
или его таутомерной формы, или его фармацевтически приемлемой соли, в котором Rx обозначает структурный элемент, выбранный из группы, включающей



и



закрывающийся в том, что осуществляют реакцию соединения формулы (IVa)



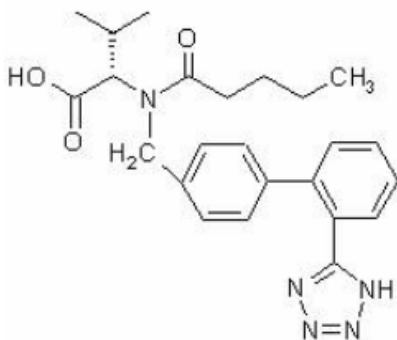
(IVa)

в которой R_x обладает приведенными выше значениями,

с азидом формулы $(R_1)(R_2)M-N_3$ (IIb), в которой R_1 и R_2 независимо друг от друга обозначают C_1-C_{20} алкил и M обозначает алюминий;

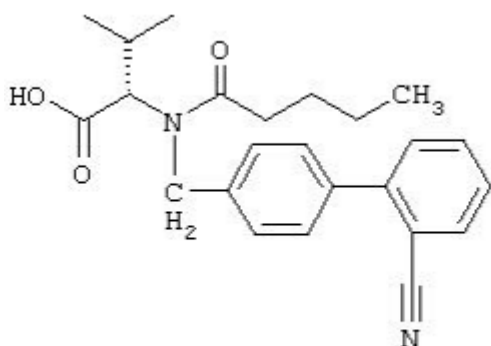
с последующим выделением полученного соединения формулы (IV).

10. Способ получения соединения формулы (IVb)



(IVb)

закрывающийся в том, что проводят реакцию соединения формулы (IVc)



(IVc)

с азидом формулы $(R_1)(R_2)M-N_3$ (IIb), в которой R_1 и R_2 независимо друг от друга обозначают C_1-C_{20} алкил; M обозначает алюминий;

с последующим выделением соединения формулы (IVb).

11. Способ по п.10, где R_1 и R_2 независимо друг от друга обозначают C_1-C_{20} алкил.

12. Способ по п.10, где соединение формулы (Pb) выбирают из группы, включающей азид диметилалюминия, азид диэтилалюминия, азид диизопропилалюминия, азид дипропилалюминия, азид диизобутилалюминия и азид дибутилалюминия.

13. Применение соединения формулы $(R_1(R_2)M-N_3)$ (Pb), в которой M обозначает алюминий, а R_1 и R_2 независимо друг от друга имеют значения в соответствии с п.1, в способе получения тетразола или его таутомера или его фармацевтически приемлемой соли формулы в соответствии с п.п.1,4,5,7,9 или 10.

По результатам рассмотрения указанной формулы изобретения Роспатентом было принято решение от 23.12.2010 об отказе в выдаче патента из-за несоответствия заявленной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень», ввиду того, что заявленная группа изобретений для специалиста явным следует из уровня техники.

Данный вывод обоснован следующим.

Из описания к патенту RU 2115648 C1, 1998 (далее – [1]) известен способ получения производных тетразола из соединений, содержащих цианогруппу, взаимодействующих с азотоводородной кислотой или ее солью. При этом, в качестве солей азотоводородной кислоты могут быть использованы соли металлов, способных образовывать соли с азотоводородной кислотой, например, азид алюминия, азид олова и т.д.

Из описания к патенту RU 2117664 C1, 1998 (далее – [2]) известен способ получения производных тетразолсодержащего амида из соединения содержащего цианогруппу, при этом получение производится в присутствии азидов органических производных металлов, в частности, органических азидов олова (алкил азиды олова) (см. реакционная схема II).

Кроме того, в описании к заявке EP 0557843 A2, 1993(далее – [3]), раскрыто применение диалкилалюминийазидов в реакциях [3+2] циклоприсоединения с нитрилами, с получением тетразолов. В частности, в указанном документе, в примере XV раскрыто, что диэтилалюминийхлорид подвергают взаимодействию с азидом (триметилсилилазидом), с последующим добавлением соединения R-CN,

при этом в реакции тетразотирования используется азотоводородная кислота или ее соли, в частности, азид алюминия и азид олова.

В решении об отказе в выдаче патента сделан вывод о том, что из указанного выше документа [1], с учетом сведений из документа [2] следует, что алюминий органический азид также может быть применен в способе получения тетразольного кольца.

При этом в решении Роспатента отмечено, что замена азид олова азидом алюминия является очевидной для обеспечения технических результатов, сформулированных заявителем как «исключение токсичного и дорого исходного реагента, содержащего олово, с заменой на известные соединения, которые доступны в достаточно больших количествах и являются не токсичными и относительно недорогими, и их применение не требует особых мер предосторожности при регенерации сточных вод».

Таким образом, как отмечено в решении Роспатента, известные из уровня техники решения, описанные в документах [1]-[3] включают сведения о всей совокупности существенных признаков, приведенных в пунктах 1-13 формулы заявленной группы изобретений, т.е. заявленные способы получения производных тетразола с использованием алюминий органического азид и применение алюминий органического азид в способах получения производных тетразола явным образом следуют из уровня техники.

Заявитель выразил несогласие с решением об отказе в выдаче патента и в возражении отметил следующее.

В документе [1] описаны тетразолы общей формулы I, которые могут быть получены реакцией содержащего цианогруппу соединения (IV) с азотоводородной кислотой или ее солью и при этом перечислено большое количество солей азид, которые могут применяться, включая азид алюминия и азид олова. Однако примеры, приведенные в источнике информации [1], иллюстрируют применение в известном способе только азид натрия и хлорида алюминия.

Кроме того, в возражении подчеркнуто, что производные тетразолсодержащего амида формулы I в патентном документе [2] действительно раскрываются, но они

могут быть получены и путем реакции этилцианоацетатных производных (12) с три-*n*-бутилолово азидом. В то время как в заявленном изобретении для получения производных тетразолов общей формулы I применен алюминий органический азид, представляющий собой молекулы с ковалентными связями. Такие соединения стабильны относительно термической обработки и обладают тримерной структурой, состоящей из планарного шестичленного Al-N кольца. Соответственно, специалист в данной области техники будет ожидать различную реакционную способность солей азотводородной кислоты в сравнении с металлоорганическими азидами, и, следовательно, нельзя предсказать заранее, что алюминий органические азиды могут быть пригодны при получении тетразолов.

При этом заявитель отмечает, что в источнике [1] не приведены примеры использования азида алюминия или олова, а специалисту в данной области техники известно только то, что тетразолы могут быть получены путем реакции содержащего цианогруппу соединения (IV) с азидом натрия и хлоридом аммония или с другими солями азида.

Заявитель отмечает, что в источнике информации [2] содержатся сведения о получении тетразолов благодаря использованию три-*n*-бутилолово азида, но при этом он обращает внимание на отсутствие в этом источнике иных указаний на то, что для этих же целей могут быть использованы алюминий органические азиды.

Патентный документ [3], по мнению заявителя, раскрывает способ получения тетразола из нитрила в реакционных условиях, включающих применение TMgCN_3 и диэтилалюминий хлорида, но при этом не раскрывает информацию о механизме образования диэтилалюминий азида. В подтверждение позиции о том, что механизм реакции, описанный в источнике [3] может быть иным, заявителем приводится статья Sharpless et al.: "Why is tetrazole formation by addition of azide to organic nitriles catalyzed by zinc (II) salts?", J.Am.Chem.Soc., 2003, 125, 9983-9987 (далее - [4]), из которой, по мнению заявителя, также не следует применение азида диалкил алюминия в способе получения тетразолов.

На основании изложенных доводов заявитель делает вывод о том, что из патентных документов [1] и [2], с учетом сведений из источника информации [3],

ни по отдельности, ни в комбинации, для специалиста не очевидно, что алюминий органический азид будет реагировать с цианогруппой и что такой процесс был бы выгоден в свете крупномасштабного производства.

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

С учетом даты международной подачи заявки, правовая база для проверки патентоспособности заявленной группы изобретений включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 № 3517-1, с изменениями и дополнениями, внесенными Федеральным законом "О внесении изменений и дополнений в Патентный закон Российской Федерации" от 07.02.2003 № 22 – ФЗ (далее – Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 06.06.2003 №82, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 30.06.2003 № 4852, с изменениями от 11.12.2003 (далее – Правила ИЗ) и Правила ППС.

Согласно пункту 1 статьи 4 Закона, изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо. Изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники. Уровень техники включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Согласно подпункту (1) пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение признается не следующим для специалиста явным образом из уровня техники, в частности, в том случае, когда не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не установлена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Проверка соблюдения указанных условий включает:

- определение наиболее близкого аналога;

- выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);

- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения;

- анализ уровня техники с целью установления известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на указанный заявителем технический результат.

В соответствии с пунктом 22.3 Правил ИЗ при определении уровня техники общедоступными считаются сведения, содержащиеся в источнике информации, с которым любое лицо может ознакомиться само, либо о содержании которого ему может быть законным путем сообщено. Датой, определяющей включение источника информации в уровень техники, является:

- для опубликованных описаний к охраняемым документам – указанная на них дата опубликования.

Не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные, в частности (см. пункт 19.5.3(3) Правил ИЗ):

- на дополнении известного средства какой-либо известной частью, присоединяемой к нему по известным правилам, для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно таких дополнений;

- на замене какой-либо части известного средства другой известной частью для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно такой замены;

Подтверждения известности влияния отличительных признаков на технический результат не требуется, если в отношении этих признаков такой результат не определен заявителем или в случае, когда установлено, что указанный им технический результат не достигается (см. пункт 19.5.3(7) Правил (ИЗ)).

Согласно подпункту 6 пункта 19.5.3 Правил ИЗ известность влияния отличительных признаков заявленного изобретения на технический результат может быть подтверждена как одним, так и несколькими источниками информации. Допускается привлечение аргументов, основанных на общеизвестных в конкретной области техники знаниях, без указания каких-либо источников информации.

Существо заявленной группы изобретений выражено в приведенной выше формуле, принятой к рассмотрению при экспертизе заявки по существу.

Анализ доводов возражения и доводов, содержащихся в решении Роспатента, касающихся оценки соответствия заявленной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Способ по независимому пункту 1 формулы относится к получению производных тетразола общей формулы I.

Способы по независимым пунктам 4,5,7 формулы, представляют собой частные случаи способа по пункту 1 и относятся к получению производных тетразола общей формулы I, с конкретными значениями радикала R – замещенный бифенил.

Способы по независимым пунктам 9 и 10 формулы относятся к способам получения производных тетразола формул IV и IVb, путем взаимодействия соединения, содержащего цианогруппу с органическим алюминий азидом. Соединения формул IV и IVb содержат в своей структуре тетразольное кольцо и конкретные группы заместителей на нем.

Объект по независимому пункту 13 формулы, относится к применению соединения формулы $(R_1)(R_2)M-N_3$, где R_1 и R_2 представляют собой C_1-C_{20} алкил, а M обозначает алюминий, в вышеуказанных способах получения производных тетразола по пунктам 1, 4, 5, 7, 9, 10 формулы.

Ближайшим аналогом заявленной группы изобретений является решение, известное из патентного документа [2], в котором приводятся сведения о реакциях получения тетразолов с использованием азидов органических соединений и азидов органических производных металлов - например, азид алкилолова. В таких соединениях азид связан с остальной молекулой именно ковалентной связью.

Заявленная группа изобретений отличается от известного из патентного документа [2] решения тем, что вместо органических азидов олова используют азиды алкилалюминия, а также отличается заместителями в исходных реагентах.

Однако из патентного документа [1] следует, что в обсуждаемой реакции получения тетразолов, в качестве реагента могут использоваться азиды самых различных металлов и даже непосредственно азотистоводородная кислота. Таким образом, показано, что принципиальным является наличие азидной группы, в то время как строение частицы, к которой азид присоединен, может быть существенно различным. В числе прочих вариантов, в описании к патентному документу [1] в качестве альтернативы конкретно перечисляются азиды олова и алюминия.

Дополнительно следует отметить, что в патентном документе [3] приводится описание способа получения тетразола путем все той же реакции нитрила с азидом, в котором на первой стадии способа смешивают диэтилалюминийхлорид с триметилсилилазидом.

Специалисту в данной области техники известно, что (см. в частности источники информации, используемые заявителем при описании уровня техники в материалах заявки) в аналогичной реакции азид натрия с диэтилалюминийхлоридом образуется азид диэтилалюминия. Т.е. указанный специалист располагает сведениями, что подобное образование азид диэтилалюминия может происходить и в механизме способа, описанного в источнике [3], и, что в реакцию с нитрилом вступает уже именно азид диэтилалюминия, как это и предложено в заявляемом способе (см примеры выполнения заявленной группы изобретений, где диэтилалюминийхлорид подвергают взаимодействию с азидом натрия, с последующим добавлением соединения R-CN, а в реакции тетразотирования используется азотоводородная кислота или ее соли, в частности, азид алюминия и азид олова).

Статья [4], которую заявитель привел в качестве доказательства того, что механизм реакции в способе, известном из патентного документа [3], может быть иным, по отношению к механизму, приведенному в материалах заявки, был

опубликован после даты приоритета настоящей заявки, т.е. был недоступен специалисту на дату создания изобретения.

Таким образом, отсутствуют основания сомневаться в том, что в способе, известном из источника [3], образовывается азид диэтилалюминия, который затем и вступает в реакцию с нитрилом.

Известные сведения, указанные в источнике информации [2] и в источнике информации [1] свидетельствуют о том, что азид алкилалюминия является приемлемой альтернативой оловоорганическому азиду в реакции получения тетразолов.

Возможность достижения указанных заявителем технических результатов при замене одного соединения на другое, очевидно будет обусловлена исключительно известными свойствами этих соединений.

Кроме того, следует отметить, что выбор заместителей на исходных соединениях не влияет на протекание химической реакции, поскольку основополагающую роль играет сам механизм образования тетразольного кольца из цианогруппы, т.е. тот или иной заместитель на исходных соединениях, не оказывает влияние на протекание механизма образования тетразольного кольца.

Таким образом, на дату подачи заявки известный уровень техники содержит сведения, позволяющие осуществить способ получения тетразолов реакцией нитрилов с азидами органических производных алюминия, т.е. сведения об объектах, заявленных в пунктах 1-12 формулы, и, соответственно, о возможности применения азидов органических производных алюминия в способах получения производных тетразолов, что раскрыто в п.13 формулы.

Следовательно, в возражении не содержится доводов, позволяющих сделать вывод о соответствии заявленной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень».

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

**отказать в удовлетворении возражения, поступившего 11.07.2011,
решение Роспатента оставить в силе.**

.