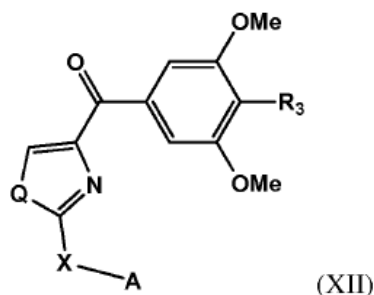


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам
рассмотрения возражения заявления

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 действующей на дату подачи возражения и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденными приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020 г. № 644/261, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020 № 59454, с изменениями, внесенными приказом Минобрнауки России и Минэкономразвития России от 23.11.2022 № 1140/646 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение Джи Ти Икс, ИНК., US, и ЮНИВЕРСИТИ ОФ ТЕННЕССИ РИСЕРЧ ФАУНДЕЙШН, US (далее – заявитель), поступившее 18.05.2023 на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее – Роспатент) от 18.10.2022 об отказе в выдаче патента по заявке № 2020131192, при этом установлено следующее.

Заявлена группа изобретений «СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ РАКА», охарактеризованная в формуле, представленной в корреспонденции от 18.08.2022, в следующей редакции:

«1. Соединение, представленное формулой XII:



где

Q представляет собой S или NH;

X представляет собой связь или NH;

A представляет собой замещенный или незамещенный фенил; или незамещенный индолил;

причем необязательные заместители при A включают O-алкил, O-галогеналкил, F, Cl, Br, I, NO₂, галогеналкил, C₁-C₅ линейный или разветвленный алкил, алкиламино, аминоалкил или их комбинацию;

R₃ представляет собой O-(C₁-C₅)алкил, O-галогеналкил, галогеналкил, гидроксил, -O(CH₂)_oNHCH₃, -O(CH₂)_oNHCH₃, -O(CH₂)_oNH₂, -O(CH₂)_oN(CH₃)₂, -O(CH₂)_oOMe, -O(CH₂)_oOH, C₁-C₅ линейный или разветвленный алкил, алкиламино или аминоалкил, при условии, что R₃ не является метоксигруппой и при условии, что если Q представляет собой S, то R³ не означает трифторацетил, хлорацетил, O-галогеналкил или гидроксигруппу, и при условии, что если Q представляет собой NH, а R³ представляет собой гидроксил, то A не может быть замещено п-Me или п-Cl;

o представляет собой целое число от 0 до 5;

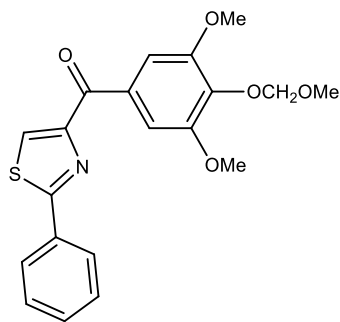
или его гидрат, стереоизомер, N-оксид, фармацевтически приемлемая соль или их комбинация.

2. Соединение по п. 1, в котором X представляет собой NH, а Q представляет собой S.

3. Соединение по п. 1, в котором X представляет собой связь, а Q представляет собой S.

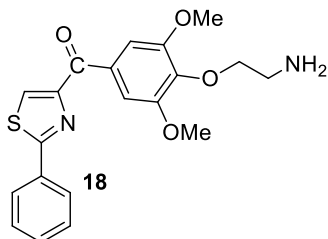
4. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что A представляет собой замещенный или незамещенный фенил.

5. Соединение по п. 1, или его фармацевтически приемлемая соль, где указанное соединение представляет собой соединение 15 или 18:



15,

или



6. Фармацевтическая композиция, обладающая противораковой активностью и содержащая эффективное количество соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли и по меньшей мере один фармацевтически приемлемый носитель.

7. Фармацевтическая композиция по п. 6, дополнительно содержащая по меньшей мере одно фармацевтически активное соединение, подходящее для лечения рака.

8. Применение соединения по п. 1 для получения лекарственного средства для лечения, ослабления, снижения тяжести, снижения риска развития или подавления рака.

9. Применение по п. 8, отличающееся тем, что указанный рак выбран из группы, состоящей из рака простаты, рака простаты с лекарственной устойчивостью, рака груди, рака груди с лекарственной устойчивостью, рака яичников, рака яичников с лекарственной устойчивостью, рака кожи, меланомы, меланомы с лекарственной устойчивостью, рака легкого, рака толстой кишки, глиомы, лейкоза, лимфомы, рака почки, рака ЦНС, рака матки, рака матки с лекарственной устойчивостью и их комбинаций.

10. Применение по п. 8, отличающееся тем, что указанный рак представляет собой меланому.

11. Применение по п. 8, отличающееся тем, что указанный рак представляет собой метастатическую меланому.

12. Применение по п. 8, отличающееся тем, что указанный рак представляет собой рак простаты.

13. Применение по п. 12, отличающееся тем, что указанный рак простаты представляет собой рак простаты с лекарственной устойчивостью.

14. Применение по п. 8, отличающееся тем, что указанное лекарственное средство предназначено для введения в комбинации с другой противораковой терапией.

15. Применение соединения по п. 1 для получения лекарственного средства для лечения опухоли или опухолей с лекарственной устойчивостью.

16. Применение по п. 15, отличающееся тем, что указанная опухоль выбрана из группы, состоящей из раковой опухоли простаты, раковой опухоли груди, глиальной опухоли, раковой опухоли яичников, раковой опухоли кожи, меланомной опухоли, раковой опухоли легкого, раковой опухоли толстой кишки, лейкозной опухоли, лимфомной опухоли, раковой опухоли почки, раковой опухоли ЦНС, раковой опухоли матки и их комбинаций.

17. Применение по п. 15, отличающееся тем, что указанная опухоль представляет собой меланомную опухоль.

18. Применение по п. 15, отличающееся тем, что указанное лекарственное средство предназначено для введения в комбинации с другой противораковой терапией».

По результатам рассмотрения данной заявки 18.10.2022 Роспатентом было принято решение об отказе в выдаче патента на группу изобретений, т.к. заявленные решения не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень».

При этом в решении Роспатента отмечено, что из уровня техники, включающего следующие источники информации:

- патентный документ US 2013/0197049 А, дата публикации 01.08.2013 (далее- [1]);

- патентный документ US 2009/0326020, дата публикации 31.12.2009 (далее - [2]);

- патентный документ WO 2011/109059 А1, дата публикации 09.09.2011 (далее – [3]);

- патентный документ US 2011/0257196 А1, дата публикации 20.20.2011 (далее - [4]),

известны соединения, соответствующие соединениям, предложенным в независимом пункте 1 формулы группы изобретений.

При этом в решении Роспатента, в отношении альтернатив, которые не раскрыты в патентных документах [1]-[4], отмечено, что в материалах заявки отсутствуют сведения, раскрывающие получение и свойства таких соединений, которые могут быть признаны обладающими новыми неизвестными для этой группы свойствами, в качественном или количественном отношении.

Вместе с тем в решении Роспатента указано, что соединения 15 и 18 (см., например, зависимый пункт 5 формулы), неизвестны из уровня техники. Соответственно в решении Роспатента отмечено, что соединения по пункту 5 формулы признаны соответствующими условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В решении Роспатента также отмечено что изобретения, охарактеризованные в независимых пунктах 6, 8 и 15 формулы явным образом следуют из уровня техники, за исключением соединений 15 и 18. Так, в решении Роспатента поясняется, что из патентных документов [1] и [2] известны фармацевтическая композиция, а также способ лечения рака, за счет антитубулиновой активности, используемых в качестве активного ингредиента соединений, и получение лекарственного средства для лечения опухоли с лекарственной устойчивостью на основе данных соединений, как и предложенные изобретения, основанные на использовании в эффективном количестве производных тиазола и имидазола.

При этом из предшествующего уровня [1]-[2] техники, для специалиста будет явным образом следовать возможность применения заявленных соединений по указанному назначению, поскольку заявленные соединения имеют соответствующую структурную формулу, как и известные соединения и также применимы для лечения опухолевых заболеваний (в том числе, в составе фармацевтических композиций и лекарственного средства).

Признаки зависимых пунктов 7, 9-14 и 16-18 формулы также известны из патентных документов [1]-[2].

Заявитель в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Гражданского Кодекса РФ, действовавшего в редакции, указанной выше, подал возражение, доводы которого сводятся к следующему.

Заявителю не была предоставлена возможность изменить формулу группы изобретений так, чтобы замечания, представленные в уведомлении о результатах проверки патентоспособности изобретения (ф. 260), могли быть преодолены. При этом отмечено, что заявители ходатайствовали о проведении переговоров/совещания с экспертом, чтобы иметь возможность представить дополнительные доводы в поддержку изобретения или внести дополнительные уточнения в формулу изобретения.

В возражении указано, что хотя заявитель не согласен с выводом, сделанным в решении Роспатента, поскольку вопрос об изобретательском уровне, по мнению заявителя, остается дискуссионным, заявитель дополнительно уточнил формулу группы изобретений, ограничив притязания двумя соединениями 15 и 18, которые в решении Роспатента были признаны патентоспособными.

Таки образом, независимый пункт 1 уточненной формулы ограничен соединениями 15 и 18.

Фармацевтическая композиция (независимый пункт 2, зависимый пункт 3) и применение (независимый пункт 4, зависимые пункты 5 – 10, независимый пункт 11, зависимые пункты 12-14), ограничены использованием соединений по пункту 1 уточненной формулы.

Помимо уточненной формулы в возражении представлены дополнительные пояснения, которые, демонстрируют соответствие условию патентоспособности «изобретательский уровень» группы изобретений, уточненной формулы, основанной на соединениях 15 и 18.

Заявитель полагает, что предложенная группа изобретений соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» и просит выдать патент с формулой, уточненной, как изложено выше.

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения, коллегия установила следующее.

С учетом даты подачи заявки (05.05.2015) правовая база включает, указанный выше Гражданский кодекс Российской Федерации в редакции, действовавшей на дату подачи заявки (далее – Кодекс), а также и Административный регламент исполнения Федеральной службой по интеллектуальной собственности, патентам и товарным знакам государственной функции по организации приема заявок на изобретение и их рассмотрения, экспертизы и выдачи в установленном порядке патентов Российской Федерации на изобретение, утвержденный приказом Министерства образования и науки Российской Федерации от 29.10.2008 №327, зарегистрированный в Министерстве юстиции Российской Федерации 20.02.2009 №13413 (далее – Регламент ИЗ).

Согласно пункту 1 статьи 1350 Кодекса изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно пункту 2 статьи 1350 Кодекса изобретение имеет изобретательский уровень, если для специалиста оно явным образом не следует из уровня техники.

Согласно подпункту 1 пункта 24.5.3 Регламента ИЗ изобретение явным образом следует из уровня техники, если оно может быть признано созданным путем объединения, изменения или совместного использования сведений, содержащихся в уровне техники, и/или общих знаний специалиста.

Согласно подпункту 2 пункта 24.5.3 Регламента ИЗ проверка изобретательского уровня может быть выполнена по следующей схеме:

определение наиболее близкого аналога в соответствии с пунктом 10.7.4.2 настоящего Регламента;

выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков); при наличии признаков, характеризующих иное решение, не считающееся изобретением, эти признаки не принимаются во внимание как не относящиеся к заявленному изобретению;

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

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

Изобретение признается не следующим для специалиста явным образом из уровня техники, если в ходе указанной выше проверки не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния этих отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно подпункту 4 пункта 24.5.3 Регламента ИЗ, условию изобретательского уровня соответствует химическое соединение, подпадающее под общую структурную формулу группы известных соединений, но не описанное как специально полученное и исследованное и при этом проявляющее новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении (селективное изобретение).

Согласно подпункту 7 пункта 24.5.3 Регламента ИЗ, в случае наличия в формуле изобретения признаков, в отношении которых заявителем не определен технический результат, или в случае, когда

установлено, что указанный им технический результат не достигается, подтверждения известности влияния таких отличительных признаков на технический результат не требуется.

Согласно пункту 39 Правил ППС в рамках рассмотрения возражения лицо, подавшее возражение, вправе ходатайствовать об изменении испрашиваемого объема правовой охраны изобретения, при условии, если испрашиваемые изменения могут устранить причины, препятствующие предоставлению правовой охраны заявленному объекту, либо в случае, если без внесения соответствующих изменений в предоставлении правовой охраны должно быть отказано в полном объеме, а при их внесении – частично.

Существо заявленной группы изобретений выражено в приведенной выше формуле.

Анализ доводов, содержащихся в возражении и решении Роспатента, с учетом материалов заявки, касающихся оценки соответствия заявленной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Как справедливо отмечено в решении Роспатента предложенные соединения общей формулы XII подпадают под общие формулы известных соединений, раскрытых в патентных документах [1]-[2].

В частности, в патентном документе [1] раскрыты соединения формулы I, Ia, III, VI, V, VI, XV, XVIII, XXI, соединения 55, 17ya, 17yb, 17yac, 9, 18, 20, 23, 26, 27, 34, 52, 12da, 12fa; XI, XIa, b, c, d, e, соединения 36a (пример 1, табл.V), 1h (фиг.3), 2l, 2r, 2r.HCl, 2u, 2n, 2o, 62a, 66a (фиг.3), 5a-d (фиг.6), 5e (пример 4), соединения на фиг.7-8 (12da), 10, 11, 14 (12fa), 13 (17ya, 17yab), табл.1-3, 5 6A, 8, 11, 12, 13, 13A-B, 14-20 (также см. формулу изобретения).

В патентном документе [2] раскрыты соединения формулы II, абзацы 0008-0015, 0027-0039, соединение Ic, примеры 2, 4, таблицы 3-5, соединения 54, 52, схема 7, схема 6B (46) (также см. формулу изобретения).

Вместе с тем, соединения аналоги раскрыты в патентных документах

[3] – [4].

В патентном документе [3] соединения раскрыты в примерах и таблицах.

В патентном документе [4] соединения раскрыты в примере 1 (абзац 0298), примере 2 (абзац 0334), примерах 3-7, а также в таблицах.

Исходя из структуры полученных соединений формулы XII, явным образом следует, что R3 представляет собой замещенный метокси.

При этом необходимо отметить, что известные соединения из числа полученных и исследованных, отличаются от предложенных полученных соединений значением радикала R3, который не означает «метокси», однако известные соединения также как и заявленные полезны при лечении раковых заболеваний. Соответственно, для специалиста очевидно, что основным структурным фрагментом полученных соединений, ответственных за указанное назначение, является фенил, замещенный метокси в положениях 3,4,5-фенильного кольца.

При этом согласно совокупности признаков, охарактеризованных в формулах изобретения в патентных документах [1]-[4] фенилкарбонильное кольцо может содержать заместители, выбранные из водорода, алкила, алкосигруппы, галогена, бензилокси и т.д. При этом кольцо А также может быть необязательно замещенным. Соответственно, на основании известных решений, у специалиста не будет сомнений в наличии активности у всех известных соединений, уровень показателя активности которых позволяет применять их для лечения раковых заболеваний.

При этом совокупность признаков независимого пункта 1 формулы включает в положении R3 также различные альтернативные значения, пересекающиеся с известными группами соединений.

На основании сведений, раскрытых в документах [1]-[4], для специалиста в данной области, будет явным образом следовать возможность модификации известных соединений путем замены одного фрагмента на другой, с последующим применением по указанному назначению.

Технический результат предложенной группы изобретений

заключается в получении соединений, взаимодействующих с участком связывания колхицина, обладающим противораковой активностью, а также к композициям, содержащим такие соединения, и к их применению для лечения различных форм рака.

Анализ сведений уровня техники свидетельствует о том, что вид заместителя R3 играет роль при применении соединения и соответственно, мотивации модифицировать известные соединения по указанному назначению.

При этом в материалах заявки отсутствуют данные, подтверждающие получение и возможность применения всех типов заявленных соединений по указанному назначению с достижением неожиданного технического результата.

Так, отсутствуют сведения о показателях активности для соединений по изобретению, когда А обозначает замещенный фенил и (не)замещенный индол, R3 обозначает C2-C5алкил, О-галогеналкил, галогеналкил. Соответственно, экстраполировать результаты двух исследованных соединений 15 и 18 на всю заявленную группу соединений невозможно.

Таким образом, поскольку не выявлено неожиданных полезных свойств всей совокупности соединений формулы XII, необходимо констатировать, что специалист в данной области техники может модифицировать известные соединения с получением вариантов соединений с сохранением при этом их биологических свойств.

Таким образом, изобретение по независимому пункту 1 формулы не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

Изобретения по пунктам 6-7 (фармацевтические композиции), 8-14 и 15-19 (применение) формулы, также не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку из патентных документов [1]-[2] известны фармацевтические композиции и применение аналогичных соединений, которые за счет наличия у них антитубулиновой активности позволяют использовать их в качестве активного ингредиента в

получении лекарственного средства для лечения опухоли, в том числе с лекарственной устойчивостью (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

Вместе с тем необходимо отметить, что на протяжении всего делопроизводства, в ходе экспертизы по существу предложенной группы соединений (запросы от 15.03.2021 и от 06.08.2021, уведомление о результатах проверки патентоспособности от 21.02.2022), до вынесения решения об отказе в выдаче патента, до сведения заявителя было доведено, что изобретения, относящиеся к соединениям 15 и 18 могут быть признаны соответствующими всем условиям патентоспособности (пункт 1 статьи 1350 Кодекса), поскольку только соединения 15 и 18 являются новыми, полученными, исследованными и достигают заявленный технический результат.

Однако, до вынесения решения об отказе в выдаче патента, заявитель не представил уточненную формулу группы изобретений, признанных патентоспособными.

Таким образом, необходимо констатировать, что решение Роспатента является правомерным.

Вместе с тем, группа изобретений по уточнённой формуле, представленной с возражением, как отмечено выше, соответствует всем условиям патентоспособности.

Таким образом, необходимо констатировать, что не выявлено препятствий для выдачи патента Российской Федерации на группу изобретений, охарактеризованную в представленной заявителем 18.05.2023, уточненной формуле.

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

удовлетворить возражение, поступившее 18.05.2023, отменить решение Роспатента от 18.10.2022 и выдать патент Российской Федерации на изобретение с формулой, представленной 18.05.2023.

(21) 2020131192

(51) МПК

C07D277/24 (2006.01)

C07D277/28 (2006.01)

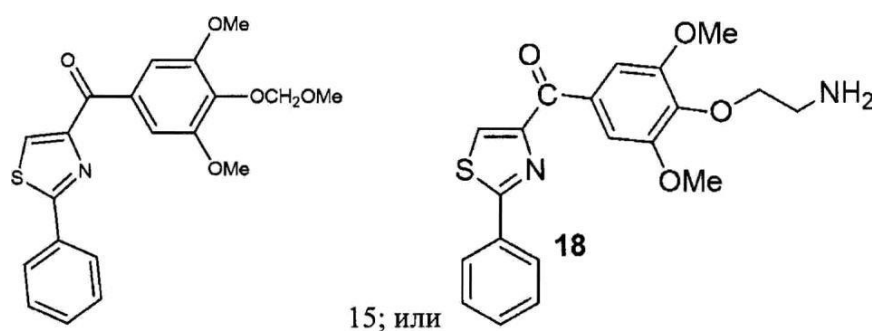
C07D277/56 (2006.01)

C07D417/12 (2006.01)

A61K31/427 (2006.01)

A61P35/00 (2006.01)

(57) 1. Соединение 15 или 18, или его фармацевтически приемлемая соль, где соединение имеет формулу:



2. Фармацевтическая композиция, обладающая противораковой активностью и содержащая эффективное количество соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли и по меньшей мере один фармацевтически приемлемый носитель.

3. Фармацевтическая композиция по п. 2, дополнительно содержащая по меньшей мере одно фармацевтически активное соединение, подходящее для лечения рака.

4. Применение соединения по п. 1 для получения лекарственного средства для лечения, ослабления, снижения тяжести, снижения риска развития или подавления рака.

5. Применение по п. 4, отличающееся тем, что указанный рак выбран из группы, состоящей из рака простаты, рака простаты с лекарственной устойчивостью, рака груди, рака груди с лекарственной устойчивостью, рака яичников, рака яичников с лекарственной устойчивостью, рака кожи, меланомы, меланомы с лекарственной устойчивостью, рака легкого, рака толстой кишки, глиомы, лейкоза, лимфомы, рака почки, рака ЦНС, рака матки, рака матки с лекарственной устойчивостью и их комбинаций.

6. Применение по п. 4, отличающееся тем, что указанный рак представляет собой меланому.

7. Применение по п. 4, отличающееся тем, что указанный рак представляет собой метастатическую меланому.

8. Применение по п. 4, отличающееся тем, что указанный рак представляет собой рак простаты.

9. Применение по п. 8, отличающееся тем, что указанный рак простаты представляет собой рак простаты с лекарственной устойчивостью.

10. Применение по п. 4, отличающееся тем, что указанное лекарственное средство предназначено для введения в комбинации с другой противораковой терапией.

11. Применение соединения по п. 1 для получения лекарственного средства для лечения опухоли или опухолей с лекарственной устойчивостью.

12. Применение по п. 11, отличающееся тем, что указанная опухоль выбрана из группы, состоящей из раковой опухоли простаты, раковой опухоли груди, глиальной опухоли, раковой опухоли яичников, раковой опухоли кожи, меланомной опухоли, раковой опухоли легкого, раковой опухоли толстой кишки, лейкозной опухоли, лимфомной опухоли, раковой

опухоли почки, раковой опухоли ЦНС, раковой опухоли матки и их комбинаций.

13. Применение по п. 11, отличающееся тем, что указанная опухоль представляет собой меланомную опухоль.

14. Применение по п. 11, отличающееся тем, что указанное лекарственное средство предназначено для введения в комбинации с другой противораковой терапией.

(56) US 2013/0197049 A1, 01.08.2013

US 2009/0326020 A1, 31.12.2009

WO 2011/109059 A1, 09.09.2011

US 2011/0257196 A1, 20.20.2011

Li, C.-M. et al: "Biological Activity of 4-Substituted Methoxybenzoyl- Aryl-Thiazole: An Active Microtubule Inhibitor", Cancer Research, 2010, 71(1), 216-224 (doi:10.1158/0008-5472.can-10-1725)