



Banská Bystrica 2.11.2016
PP 43-2002 /P 287480/ I-100-2016

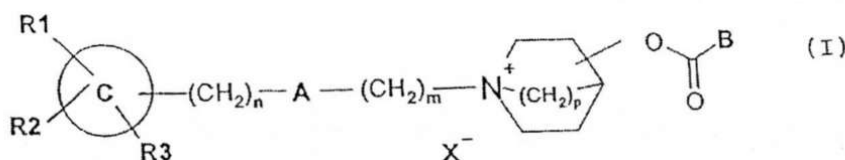
ROZHODNUTIE

Vo veci návrhu na čiastočné zrušenie patentu č. 287480 s názvom „Chinuklidínové deriváty, spôsob ich prípravy, liečivé kompozície, ktoré ich obsahujú, a ich použitie“, podaného 20.6.2016 majiteľom Almirall, S. A., Ronda del General Mitre 151, 08022 Barcelona, Španielsko (pred zmenou mena LABORATORIOS ALMIRALL, S.A.) zastúpeným v konaní patentovým zástupcom Ing. Pavlom Tomešom, HÖRMANNOVÁ-TOMEŠ, Patentová, technická a známková kancelária, Repašského 20, 841 02 Bratislava 4 (ďalej „majiteľ“), rozhodol Úrad priemyselného vlastníctva Slovenskej republiky (ďalej „úrad“) podľa § 46 ods. 2 a § 46 ods. 5 zákona č. 435/2001 Z. z. o patentoch, dodatkových ochranných osvedčeniach a o zmene a doplnení niektorých zákonov v znení neskorších predpisov takto:

patent č. 287480 sa čiastočne zrušuje.

Patentové nároky sa obmedzujú a stanovujú sa v tomto rozsahu:

1. Chinuklidínový derivát všeobecného vzorca (I)



kde

© znamená fenylový kruh, heteroaromatickú skupinu so 4 až 9 atómami uhlíka, obsahujúci jeden alebo viacej heteroatómov, naftylovú, 5,6,7,8-tetrahydronaftylovú alebo bifenylovú skupinu;

R¹, R² a R³ každý nezávisle znamená atóm vodíka alebo atóm halogénu, fenylovú skupinu, skupinu -OR⁴, -SR⁴, -NR⁴R⁵, -NHCOR⁴, -CONR⁴R⁵, -CN, -NO₂, -COOR⁴ a -CF₃, alebo alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka s priamym alebo rozvetveným reťazcom, ktorá môže byť prípadne substituovaná hydroxyskupinou alebo alkoxyskupinou, kde R⁴ a R⁵ každý nezávisle znamená atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka s priamym alebo s rozvetveným reťazcom, alebo spoločne tvoria alicyklický kruh; alebo R¹ a R² spoločne tvoria aromatický, alicyklický alebo heterocyklický kruh;

n znamená celé číslo od 0 do 4;

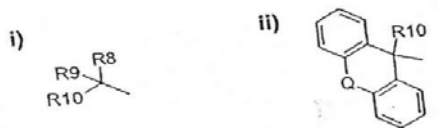
A znamená skupinu -CH=CR⁶-, -CR⁶=CH-, CR⁶R⁷-, -CO-, -O-, -S-, -S(O)-, SO₂ alebo -NR⁶-, kde R⁶ a R⁷ každý nezávisle znamená atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka s priamym alebo s rozvetveným reťazcom,

alebo R⁶ a R⁷ spoločne tvoria alicyklický kruh;

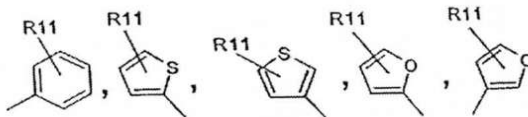
m znamená celé číslo od 0 do 8; s výhradou, že keď m = 0, A neznamena -CH₂-;

p znamená celé číslo od 1 do 2 a substitúcia v azoniabicyklickom kruhu môže byť v polohe 2, 3 alebo 4, zahŕňajúcej všetky možné konfigurácie na asymetrických uhlíkoch;

B znamená skupinu vzorca (i) alebo (ii):



kde R¹⁰ znamená atóm vodíka, hydroxyskupinu alebo metylovú skupinu; a R⁸ a R⁹ každý nezávisle znamená



kde R¹¹ znamená atóm vodíka alebo atóm halogénu, alebo alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka s priamym alebo s rozvetveným reťazcom a Q znamená jednoduchú väzbu, -CH₂, -CH₂-CH₂-, -O-, -O-CH₂-, -S-, -S-CH₂- alebo -CH=CH-; a X znamená farmaceuticky prijateľný anión mono- alebo polyvalentnej kyseliny.

2. Chinuklidínový derivát podľa nároku 1, kde R¹, R² a R³ každý nezávisle znamená atóm vodíka alebo atóm halogénu, alebo fenylovú skupinu, skupinu-OR⁴, -SR⁴, -NR⁴R⁵, -NHCOR⁴, -CONR⁴R⁵, -CN, -NO₂, -COOR⁴ alebo -CF₃, alebo alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka s priamym alebo rozvetveným reťazcom, ktorá môže byť prípadne substituovaná hydroxyskupinou, kde R⁴ a R⁵ každý nezávisle znamenajú atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka s priamym alebo s rozvetveným reťazcom alebo spolu tvoria alicyklický kruh s 3 až 10 atómami uhlíka; alebo R¹ a R² spolu tvoria aromatický kruh so 6 až 14 atómami uhlíka, alicyklický kruh s 3 až 10 atómami uhlíka alebo heterocyklický kruh s 3 až 10 atómami uhlíka.

3. Chinuklidínový derivát podľa nároku 1 alebo 2, kde A znamená skupinu -CH=CR⁶-, -CR⁶=CH-, -CR⁶R⁷-, -CO-, -O-, -S-, -S(O)-, SO₂ alebo -NR⁶-, kde R⁶ a R⁷ každý nezávisle znamená atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka s priamym alebo s rozvetveným reťazcom alebo R⁶ a R⁷ spolu tvoria alicyklický kruh s 3 až 10 atómami uhlíka.

4. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z nárokov 1 až 3, kde všetky alkylové skupiny prítomné ako R¹ až R⁷ alebo R¹¹ obsahujú 1 až 4 atómy uhlíka.

5. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z nárokov 1 až 4, kde p znamená 2.

6. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z predchádzajúcich nárokov, kde © znamená fenylovú, pyrolylovú, tienylovú, furylovú, bifenylovú, naftylovú, 5, 6, 7, 8-tetrahydrynaftylovú, benzo[1, 3]dioxylovú, imidazylovú alebo benzotiazolylovú skupinu.

7. Chinuklidínový derivát podľa nároku 6, kde © znamená fenylovú, pyrolylovú alebo tienylovú skupinu.

8. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z predchádzajúcich nárokov, kde R¹, R² a R³ každý nezávisle znamená atóm vodíka alebo atóm halogénu, alebo hydroxyskupinu, metylovú, terc-butylovú skupinu, skupinu -CH₂OH, 3-hydroxypropylovú, skupinu -OMe, -NMe₂, -NHCOMe, -CONH₂, -CN, -NO₂, -COOMe alebo -CF₃.

9. Chinuklidínový derivát podľa nároku 8, kde R¹, R² a R³ každý nezávisle znamená atóm vodíka alebo atóm halogénu, alebo hydroxyskupinu.

10. Chinuklidínový derivát podľa nároku 9, kde atóm halogénu je fluór.

11. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z predchádzajúcich nárokov, kde A znamená skupinu -CH₂-, -CH=CH-, -CO-, -NH-, -NMe-, -O- alebo -S-; n znamená 0 alebo 1; a m znamená celé číslo od 1

do 6.

12. Chinuklidínový derivát podľa nároku 11, kde A znamená skupinu -CH₂-, -CH=CH- alebo -O- a m znamená 1, 2 alebo 3.

13. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z predchádzajúcich nárokov, kde azonia-bicykloskupina je substituovaná na atóme dusíka 3-fenoxypropylou, 2-fenoxyetylou, 3-fenylalylou, fenetylou, 3-fenylpropylou, 4-fenylbutylou, 3-(2-hydroxyfenoxy)propylou, 3-(4-fluórfenoxy)propylou, 2-benzyloxyetylou, 3-pyrol-1-ylpropylou, 2-tién-2-yletylou alebo 3-tién-2-ylpropylou skupinou.

14. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z predchádzajúcich nárokov, kde B znamená skupinu všeobecného vzorca (i) a R⁸ a R⁹ každý nezávisle znamená fenylú, 2-tienylú, 3-tienylú, 2-furylovú alebo 3-furylovú skupinu a R¹¹ znamená atóm vodíka.

15. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z nárokov 1 až 13, kde B znamená skupinu vzorca (ii) a Q znamená jednoduchú väzbu, skupinu -CH₂-, -CH₂-CH₂- alebo atóm kyslíka.

16. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z predchádzajúcich nárokov, kde X znamená bromidový, chloridový alebo trifluóracetátový anión.

17. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z predchádzajúcich nárokov, kde azoniabicykloskupina je substituovaná v polohe 3.

18. Chinuklidínový derivát podľa nároku 17, kde substituent v polohe 3 má konfiguráciu (R).

19. Chinuklidínový derivát podľa nároku 18, kde v skupine vzorca (i) má substituent R⁸ iný význam ako R⁹, a asymetrický uhlík, ku ktorému sú R⁸ a R⁹ pripojené, má konfiguráciu (R).

20. Chinuklidínový derivát podľa nároku 18, kde v skupine vzorca (i) má substituent R⁸ iný význam ako R⁹, a asymetrický uhlík, ku ktorému sú R⁸ a R⁹ pripojené, má konfiguráciu (S).

21. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z predchádzajúcich nárokov, ktorý je jediným izomérom.

22. Chinuklidínový derivát podľa nároku 1, ktorým je:

3(R)-difenylacetoxy-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2-hydroxy-2,2-difenylacetoxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2,2-difenylpropionyloxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2-hydroxy-2-fenyl-2-tién-2-ylacetoxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2-furán-2-yl-2-hydroxy-2-fenylacetoxy)-1-(3-fenylalyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2-furán-2-yl-2-hydroxy-2-fenylacetoxy)-1-(2-fenoxyetyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2-furán-2-yl-2-hydroxy-2-fenylacetoxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-fenetyl-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-(4-fenylbutyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

1-[3-(4-fluórfenoxy)propyl]-3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; chlorid

3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-[3-(2-hydroxyfenoxy)propyl]-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; trifluóracetát

3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-(3-pyrol-1-ylpropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; trifluóracetát

3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-(2-tién-2-yletyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-(3-tién-2-ylpropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

1-(2-benzyloxyetyl)-3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; trifluóracetát

3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-3-ylacetoxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

1-(3-fenylalyl)-3(R)-(9-hydroxy-9[H]-fluoren-9-karboxyloxy)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(9-hydroxy-9[H]-fluoren-9-karboxyloxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(9-hydroxy-9[H]-fluoren-9-karboxyloxy)-1-fenetyl-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(9-hydroxy-9[H]-fluoren-9-karboxyloxy)-1-(3-tién-2-ylpropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(9-metyl-9[H]-fluoren-9-karboxyloxy)-1-(3-fenylalyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

3(R)-(9-metyl-9[H]-fluoren-9-karboxyloxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid

1-(4-fenylbutyl)-3(R)-(9[H]-xantén-9-karbonyloxy)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid
1-(2-fenoxyetyl)-3(R)-(9[H]-xantén-9-karbonyloxy)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid
1-(3-fenoxypropyl)-3(R)-(9[H]-xantén-9-karbonyloxy)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid
3(R)-(9-hydroxy-9[H]-xantén-9-karbonyloxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid
3(R)-(9-hydroxy-9[H]-xantén-9-karbonyloxy)-1-fenetyl-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid
3(R)-(9-hydroxy-9[H]-xantén-9-karbonyloxy)-1-(3-tién-2-ylpropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid
alebo
3(R)-(9-metyl-9[H]-xantén-9-karbonyloxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid.

23. Chinuklidínový derivát podľa nároku 1, ktorým je 3(R)-(2-hydroxy-2,2-ditién-2-ylacetoxy)-1-(3-fenoxypropyl)-1-azoniabicyklo-[2.2.2]oktán; bromid.

24. Chinuklidínový derivát podľa nároku 1, ktorým je 1-fenetyl-3(R)-(9[H]-xantén-9-karbonyloxy)-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktán; bromid.

25. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z predchádzajúcich nárokov, ktorý má hodnotu IC_{50} pre muskarínové receptory M_3 ($Hm3$) menšie ako 35 nM.

26. Farmaceutická kompozícia, **vyznačujúca sa tým**, že obsahuje chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z nárokov 1 až 25 v zmesi s farmaceuticky prijateľným nosičom alebo riedidlom.

27. Chinuklidínový derivát podľa akéhokoľvek z nárokov 1 až 25 alebo farmaceutická kompozícia podľa nároku 26 na použitie ako liečivo.

28. Použitie chinuklidínového derivátu podľa akéhokoľvek z nárokov 1 až 25 alebo farmaceutickej kompozície podľa nároku 26 na výrobu liečiva na liečenie respiračného, urinárneho alebo gastrointestinálneho ochorenia.

29. Použitie chinuklidínového derivátu podľa niektorého z nárokov 1 až 25 alebo farmaceutickej kompozície podľa nároku 26 na výrobu liečiva na liečenie COPD, chronickej bronchitídy, astmy a rinitídy.

Odôvodnenie:

Úradu bol 20.6.2016 doručený návrh na čiastočné zrušenie patentu č. 287480 s názvom „Chinuklidínové deriváty, spôsob ich prípravy, liečivé kompozície, ktoré ich obsahujú, a ich použitie“.

V predmetnom návrhu, ktorý bol podaný v zmysle § 46 ods. 5 zákona č. 435/2001 Z. z. o patentoch, dodatkových ochranných osvedčeniach a o zmene a doplnení niektorých zákonov v znení neskorších predpisov (ďalej „patentový zákon“), majiteľ žiadal o zrušenie patentových nárokov 26 až 32 a následnom prečíslovaní ďalších nárokov 33 až 35 na nároky 26 až 29.

Majiteľ súčasne žiadal aj o opravu drobných chýb vzniknutých prepisovaním, a to:

- v nároku 1 zo „4 a 9“ na „4 až 9“;
- v nároku 12 z „-CH=CH-a-O-“ na „-CH=CH-alebo-O-“;
- v nároku 22, ôsma zlúčenina v poradí z „3(R)-(2-ditién-“ na „3(R)-(2,2-ditién-“.

Majiteľ poznamenal, že podobnú úpravu patentových nárokov vykonal aj Európsky patentový úrad v súbežnom európskom patente EP 1 200 431 B3 a za účelom preukázania uvedenej skutočnosti pripojil k návrhu aj titulný list a znenie patentových nárokov európskeho patentu EP 1 200 431 B3 v anglickom jazyku.

Rozhodnutie úradu sa opiera o nasledovné skutočnosti a dôvody:

Podľa § 46 ods. 2 zákona č. 435/2001 Z. z. o patentoch, dodatkových ochranných osvedčeniach a o zmene a doplnení niektorých zákonov v znení neskorších predpisov, ak sa dôvody zrušenia týkajú patentu čiastočne, patent sa zruší len v rozsahu primeranom zisteným dôvodom, a to zmenou patentových nárokov, opisu alebo výkresov.

Podľa § 46 ods. 5 citovaného zákona, úrad môže čiastočne zrušiť patent podľa odseku 2 aj na návrh jeho majiteľa bez ohľadu na existenciu dôvodov podľa odseku 1.

Formulácia patentových nárokov v konaní o udelení patentu je výlučne vecou prihlasovateľa, a preto aj po udelení patentu je potrebné prednostne rešpektovať vôľu majiteľa, pokiaľ ide o upravené znenie patentových nárokov, za predpokladu, že majiteľom navrhované znenie spĺňa zákonné požiadavky. Presná formulácia patentových nárokov pritom môže mať vplyv aj na ďalšie prípadné konania týkajúce sa udeleného patentu.

Preto je potrebné posúdiť, či majiteľom navrhované znenie patentových nárokov vyhovuje požiadavkám stanoveným patentovým zákonom, ako aj Vyhláškou Úradu priemyselného vlastníctva Slovenskej republiky č. 223/2002, ktorou sa vykonáva zákon č. 435/2001 Z. z. o patentoch, dodatkových ochranných osvedčeniach a o zmene a doplnení niektorých zákonov v znení neskorších predpisov (ďalej „vyhláška“), a teda či navrhované znenie patentových nárokov je dostatočne jasné, stručné a podložené opisom (§ 5 ods. 1 vyhlášky) a zároveň to, či by takýmto znením patentových nárokov nedošlo k rozšíreniu rozsahu ochrany napadnutého patentu v porovnaní s pôvodne udeleným patentom obdobne ako v prípade úpravy patentovej prihlášky v konaní podľa § 45 ods. 1 patentového zákona.

V súlade s uvedeným je možné konštatovať, že úpravy v patentových nárokoch 1, 12 a 22, ktoré predstavujú len opravu písárskych chýb, spĺňajú ustanovenie § 45 ods. 1 patentového zákona, pretože zmenené znenie patentových nárokov má oporu v pôvodnom podaní ekvivalentnej medzinárodnej patentovej prihlášky WO 01/04118 A2. Rovnaké chyby sa vyskytujú aj v opise predmetného patentu na str. 3, 5 a v abstrakte, ktoré budú preto opravené v súlade s opisom ekvivalentnej medzinárodnej patentovej prihlášky WO 01/04118.

Ďalej je potrebné uviesť, že zrušením patentových nárokov 26 až 32 došlo k obmedzeniu, resp. zúženiu rozsahu platného znenia predmetného patentu, pričom nedošlo k zmene predmetu ochrany, a teda nejde o neprípustnú zmenu alebo rozšírenie rozsahu ochrany napadnutého patentu v porovnaní s pôvodne udeleným znením patentových nárokov.

Vzhľadom na uvedené, ako aj vzhľadom na to, že majiteľom predložené patentové nároky 1 až 29 sú jasné, stručné a podložené opisom, čím spĺňajú aj ustanovenie § 5 ods. 1 vyhlášky, bolo rozhodnuté tak, ako je uvedené vo výrokovej časti tohto rozhodnutia.

Poučenie o opravnom prostriedku:

Podľa § 55 ods. 1 zákona č. 435/2001 Z. z. o patentoch, dodatkových ochranných osvedčeniach a o zmene a doplnení niektorých zákonov v znení neskorších predpisov možno proti tomuto rozhodnutiu podať na úrade rozklad v lehote 30 dní od jeho doručenia. Včas podaný rozklad má odkladný účinok.

JUDr. Ingrid Maruniaková
generálna riaditeľka
sekcie hlavných procesov

Doručiť:

Ing. Pavol Tomeš
HÖRMANNOVÁ-TOMEŠ
Patentová, technická a známková kancelária
Repašského 20
841 02 Bratislava