



Ķīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

1. Savienojumu vai kompozīciju, kas *kā tāda* nav zināma tehnikas līmenī, var patentēt kā tādu, neatkarīgi no jebkāda lietojuma.
(Ķīmiskās vielas patents - visspēcīgākais)

2. Savienojumu vai kompozīciju, kas *kā tāda* ir zināma no tehnikas līmeņa, bet kurai nav zināma terapeitiskā aktivitāte, var patentēt kā savienojumu vai kompozīciju terapeitiskai lietošanai vispār.
(Pirmā medicīniskā lietojuma patents - *first medical use*)

3. Savienojumu vai kompozīciju, kas *kā tāda* ir zināma un kurai ir zināms pirmais farmaceitiskais lietojums, var patentēt kā savienojumu vai kompozīciju lietošanai jaunam konkrētam terapeitiskam lietojumam
(Sekundārais medicīniskais lietojums - *second medical use*)

1. Jauns produkts:

- konkrēta savienojuma zināmība kaitē vispārīgi definēta produkta novitātei;
- vispārējās formulas zināmība netiek pretstatīta konkrēta savienojuma novitātei;

Piemēri:

- "zemākā alkilgrupa" netraucē C_2H_5 grupas novitātei;
- konkrētu zināmu savienojumu sarakstu pretstata katra izgudrotā savienojuma novitātei, ja šo savienojumu var iegūt un izdalīt;
(saraksts, kas satur $Ph-CH_3$, $Ph-C_2H_5$, $Ph-iC_3H_7$, $Ph-nC_3H_7$, $Ph-nC_4H_9$ kaitē $Ph-C_2H_5$ novitātei)



KĪmijas (farmācijas) patentu īpatnības

1. Produkts caur paņēmienu:

ja ir grūti noteikt produkta sastāvu (piem., augu ekstrakti), ir atļauts pretenzijā definēt produktu ar tā iegūšanas paņēmienu, jādefinē precīzs paņēmiens, proti, tāds, kura atkārtošana nenovēršami un reproducējami noved pie minētā produkta.

Pretenzijas forma: "Produkts Y, kas ir iegūstams ar paņēmienu X"

Taču: produkts nav jauns vienīgi tādēļ, ka tas iegūts ar jaunu paņēmienu.



KĪmijas (farmācijas) patentu īpatnības

1. Jauna produkta izgudrojuma līmenis:

produkts ir jauns un tam ir izgudrojuma līmenis, ja

- savienojumam ir negaidīta struktūra;
- savienojums uzrāda negaidītu efektu vai lietojams negaidītā

veidā;

- produkts ir iegūts ar ne-acīmredzamu (negaidītu)

paņēmienu.



KĶīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

1. Piemērs:

Jaunais A' savienojums strukturāli ir ļoti tuvs zināmajam savienojumam A. A' pretendē būt par pretiekaisuma līdzekli.

Risinājums:

- a) zināmajam savienojumam A nav minēts efekts: izgudrojuma līmenis IR
- b) zināmajam savienojumam A ir minēts pilnīgi cits efekts: izgudrojuma līmenis IR
- c) savienojumam A ir tāds pats efekts: izgudrojuma līmeņa NAV
- d) ir minēts radniecīgs efekts (piem., COX-inhibitors): izgudrojuma līmeņa NAV



KĶīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

2. Pirmais lietojums medicīnā:

produkts kā tāds ir zināms, bet tā lietošana medicīnā nav zināma;

ir atļauta pretenzija uz produktu ar nolūku (kam);

aizsardzība produkta visiem zināmajiem un nezināmajiem lietojumiem medicīnā;

(valstīs, kur ir atkarīgie patenti, šis patents var būt atkarīgs no patenta uz pašu produktu).

Atļautie pretenziju formulējumi:

Produkts X (kompozīcija X)

- lietošanai par medikamentu;
- lietošanai par antibakteriālu līdzekli (analģētisku līdzekli utt.)
- slimības Y ārstēšanai

Medikaments, kas satur produktu X



Kļīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

2. Pirmais lietojums medicīnā:

Vienā pieteikumā var atsevišķi iekļaut vairāk nekā vienu konkrētu lietošanu terapijā;

Pamatojums: savienojums ir jauns vienīgi tad, ja pirmo reizi ir atklāta tā izmantošana terapijā; jebkurš dokuments, kas apraksta minētā savienojuma vai kompozīcijas izmantošanu medicīnā, neatkarīgi no ārstējamā stāvokļa, kaitē izgudrojuma novitātei.

Piemērs:

pieteikums: 1. pretenzija: Savienojums X diabēta ārstēšanai;

D1: savienojums X izmantojams kā anksiolītisks līdzeklis;

secinājums: 1. pretenzija šādā formulējumā nav atļauta, jo ir zināma vismaz viena lietošana medicīnā. BET...

3. Sekundārs lietojums medicīnā:

Iepriekš minēto gadījumu var patentēt, ja to definē kā sekundāro lietojumu medicīnā (Šveices tipa pretenzija);

Atļauti šādi sekundārā lietojuma pretenziju formulējumi:

Produkta X izmantošana

- medikamenta izgatavošanai slimības Y ārstēšanai;
- medikamenta ražošanai slimības Y ārstēšanai;
- farmaceitiskas kompozīcijas iegūšanai slimības Y ārstēšanai;

Paņēmiens medikamenta ražošanai, kas paredzēts slimības Y ārstēšanai, kas satur produktu X.

Pamatojums: novitāti piešķir konkrētā ārstējamā slimība.



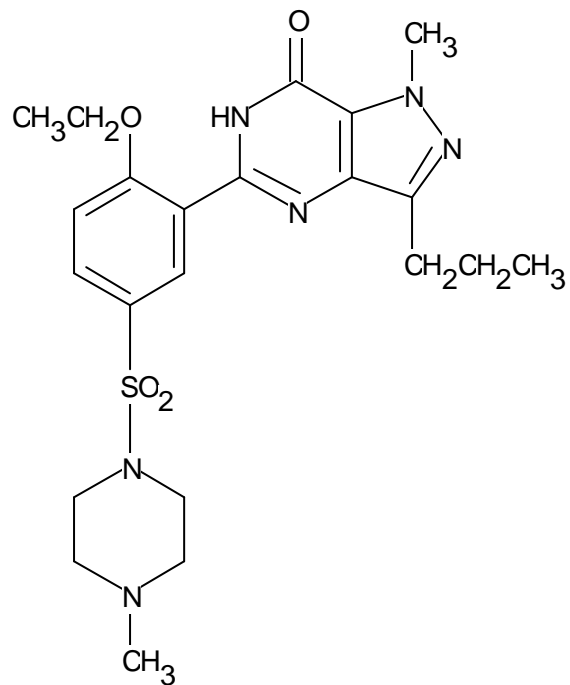
3. Sekundārs lietojums medicīnā:

Nav atļauti šādi sekundārā lietojuma definējumi pretenzijās:

- Paņēmiens slimības Y ārstēšanai, kas paredz vielas/kompozīcijas X (efektīva daudzuma) ievadīšanu;
- Vielas/kompozīcijas X izmantošana slimības Y ārstēšanai;
- Vielas/kompozīcijas X izmantošana par antibakteriālu (kardiovaskulāru, bronholītisku utt.) līdzekli;
- Vielas/kompozīcijas X izmantošana par medikamentu slimības Y ārstēšanai.

Kīīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

Piemērs (sildenafilis VIAGRA) Pfizer Eiropas patents 0463756



Sildenafil (turpinājums): patentā ir šādas pretenzijas:

- savienojums ar formulu (I), kur tas ir izvēlēts no... 5-[2-etoksi-5-(4-metilpiperazinilsulfonil)fenil]-1-metil-3-n-propil-1,6-dihidro-7H-pirazol[4,3-d]pirimidin-7-ona. [jauns savienojums]
- farmaceitiska kompozīcija, kas satur savienojumu ar formulu (I)... , kopā ar farmaceitiski saderīgu atšķaidītāju vai nesēju. [Pirmais lietojums medicīnā]
- Savienojuma ar formulu (I)... izmantošana medikamenta ražošanā, īpaši hipertensijas, sirds mazspējas, aterosklerozes, triekas, perifēro asinsvadu slimību, samazinātas asinsvadu caurlaidības, hroniskas astmas, alerģiskā rinīta, glaukomas un slimību, kam raksturīga zarnu darbības traucējumi, ārstēšanai. [Sekundārs medicīniskais lietojums].



Kīrijas (farmācijas) patentu īpatnības

EPO prakse ir tāda, ka pretenzijas sekundārajam lietojumam vienmēr jāattiecinā uz konkrētu terapeitisku lietojumu, proti, un labi zināmu un definētu slimību. Ja pretenzijas satur atsauci uz "jaunu" iedarbības veidu, iedarbības mehānismu vai efektu, to uzskata tikai par atklājumu vai par nepatentējamu skaidrības trūkuma dēļ.

T892/94: jaunatklāts tehniskais efekts nepiešķir pretenzijai novitāti, kas ir formulēta kā zināmas vielas lietojums zināmam medicīniskam nolūkam, ja jaunatklātais tehniskais efekts jau ir pamatā zināmās vielas zināmajam lietojumam.



Ķīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

Piemērs:

Pretenzija: savienojuma X izmantošana medikamenta ražošanai slimības ārstēšanai, kurā ir iesaistīti 5-HT_{1a} receptori.

(minētie receptori ir iesaistīti tādos stāvokļos kā narkomānija, nemiers, kompulsīvie traucējumi...)

Tehnikas līmenis:

Savienojumu X izmanto nemiera ārstēšanai.

Secinājums: NAV novitātes, jo slimība (nemiers) jau zināma un pieteicējs ir tikai atklājis savienojuma X iedarbības mehānismu.



KĶīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

Piemērs:

Pretenzija: NO-sintetāzes inhibitora izmantošana medikamenta ražošanai slimības ārstēšanai, kurā ir iesaistīts kappā receptors kk.

Tehnikas līmenis:

Savienojums X ir NO-sintetāzes inhibitors un tiek lietots cistiskās fibrozes ārstēšanai (par to ir zināms, ka ir iesaistīti kappā receptori kk).

Secinājums: NAV novitātes, jo terapeitiskais lietojums ietver cistisko fibrozi.

[Ja grib patentēt citai slimībai, nedrīkst pieminēt mehānismu, ja tas vēl nav zināms. Jo mehānisms ir atklājums, tāpēc, ja mehānisms nav zināms, var patentēt jaunām diagnozēm.]

Īpaši gadījumi farmaceitisko izgudrojumu jomā:

- sekundārais lietojums ir iedarbības veids (*mode of action*):

Piemēri (nav patentējami, jo ir tikai atklājums, tiek tikai izskaidrots iedarbības mehānisms jau zināmam lietojumam):

Savienojuma X izmantošana medikamenta ražošanā triptofāna metabolisma regulēšanai.

Savienojuma X izmantošana medikamenta ražošanā, kam piemīt 5-HT₃ antagonista aktivitāte.

Savienojuma X izmantošana medikamenta ražošanā, kas paredzēts interleikīna-1 producēšanas nomākšanai cilvēka vai dzīvnieka organismā.

Piemēri (nav patentējams, jo nav novitātes) - skat. jau iepriekš aprakstīto par 5-HT_{1a} receptoriem.



KĶīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

Īpaši gadījumi farmaceitisko izgudrojumu jomā:

- sekundārais lietojums ir zāļu lietošanas veids (*mode of administration*):

Pretenzija:

Cilvēka horioniskā gonadotropīna (HCG) izmantošana nedepozīta (labi uzsūcas) medikamenta ražošanā lietošanai zem ādas...

Tehnikas līmenis:

- 1) Depozītu veidojoša (slikti uzsūcas) HCG intramuskulāra vai subkutāna ievadīšana
- 2) Intramuskulāra nedepozīta (labi uzsūcas) HCG ievadīšana

Atšķirības: pretenzijā - zemādas injekcijas, tehn. līmenī - intramuskulāras injekcijas.

Secinājums: JĀ novitāte, JĀ izgudrojuma līmenis

(pamatojums: patentējams tādēļ, ka zemādas injekcijas parasti slikti uzsūcas, bet tehnikas līmenī katrs dokuments rādīja pretējo, tādēļ bija pozitīvs vērtējums; ļoti daudz ir atkarīgs no konkrētā tehnikas līmeņa).



Klīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

Īpaši gadījumi farmaceitisko izgudrojumu jomā:

- sekundārais lietojums ir īpaša pacientu grupa:

Pretenzija:

Fosfolipīdu pūslīšu (liposomu) maisījuma un zīdītāju asiņu faktora Xa izmantošana medikamenta ražošanā nehemofilu zīdītāju asiņošanas regulēšanai.

Tehnikas līmenis:

Šī paša maisījuma izmantošana hemofilu asiņošanas apturēšanai.

Atšķirības: pretenzija - nehemofili zīdītāji; tehn. līm. - hemofili zīdītāji

Secinājums: JĀ novitāte, JĀ izgudrojuma līmenis

(pamatojums: dažāds asins koagulēšanās process). Tādējādi konkrēta slimnieku grupa var piešķirt patentspēju izgudrojumam uz zināmas vielas izmantošanu zināmas slimības ārstēšanā.

Īpaši gadījumi farmaceitisko izgudrojumu jomā:

- selektīvie izgudrojumi:

- slimības selekcija;
- konkrēta ķīmiskā savienojuma selekcija;
- vispārīgās ķīmiskās formulas selekcija;
- parametra vērtību intervāla selekcija.

Selekcija no vispārīgas tehnikas līmeņa informācijas. Pamatojas uz konkrētu tehnisko efektu vai tehniskajām atšķirībām.

EPO prakse - pat ja tehnikas līmeņa dokumentos ir nosaukti daudzi konkrēti savienojumi, EPO neuzskata, ka tie ir pilnīgi atklāti, jo neuzskata, ka saprātīgs cilvēks pārbaudītu katru šo savienojumu par tā darbības veidu.

Īpaši gadījumi farmaceitisko izgudrojumu jomā:

- selektīvie izgudrojumi:

Maisījumi (tas pats attiecas arī uz Markuša formulām un gariem atsevišķu vielu sarakstiem):

Tehnikas līmenī ir zināmi vielu saraksti (A1, A2, A3) un (B1, B2, B3, B4, B5). Pretenzijā ir kombinācija A2 un B3 (piemēram: pretvēža līdzekļa A kombinācija ar aNSAID "B").

Šādos gadījumos vērtēšanas princips ir šāds: ja pirmās vielas zināmajā sarakstā ir tikai 1 savienojums, tad visām šī savienojuma kombinācijām ar 2. saraksta vielām nav izgudrojuma līmeņa. Ja abos sarakstos ir vairāki savienojumi, tad konkrētā kombinācija nav viennozīmīgi zināma, un jāskatās, kādu tehnisko efektu dod konkrētā kombinācija



KĶīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

Īpaši gadījumi farmaceitisko izgudrojumu jomā:

- selektīvie izgudrojumi:

Kopsavilkums: selektīvo izgudrojumu patentspēja:

- iedarbības veids - NĒ
- ievadīšanas veids - JĀ
- ievadīšanas režīms (devas) - NĒ/JĀ
- specifiski pacienti - JĀ
- selektīvi parametri - JĀ

Īpaši gadījumi farmaceitisko izgudrojumu jomā:

- enantiomēri

Enantiomēri NAV jauni, ja tie ir viennozīmīgi atklāti tehnikas līmenī veidā, kas dod tehniski atkārtojamu instrukciju:

-enantiomērs ir tieši nosaukts, piemēram: “Šis izgudrojums attiecas ne tikai uz racemātu, bet arī uz tā optiski aktīviem (+) un (-) izomēriem” un

- ir dota pietiekama informācija, lai lietpratējs varētu iegūt enantiomērus (iespējams ņemot vērā vispārējās zināšanas): piemēram, dots paņēmiens, kura neizbēgams rezultāts ir attiecīgais enantiomērs, vai,

- papildus aprakstītajam jāizmanto tikai attiecīgajā datumā (prioritātes datumā) pastāvošās vispārējās zināšanas.



Kīrijas (farmārijas) patentu īpatnības

Īpaši gadījumi farmaceitisko izgudrojumu jomā:

- enantiomēri

Enantiomēri IR jauni, ja tie nav viennozīmīgi atklāti tehnikas līmenī:

- Ja savienojumam ir vairāki asimetriski oglekļa atomi un tehnikas līmenī nav ziņu par katru konkrēto konfigurāciju;

- Ja tehnikas līmenī, runājot par racēmisku maisījumu, ir tikai pieminētas optiski aktīvas formas bez papildus informācijas par tām (jo termins “optiski aktīvs” apzīmē gan enantiomērus, gan ietver arī maisījumus, kuros viens no enantiomēriem ir pārkumā).

Enantiomēru novitāte

Tehnikas līmeņa informācija	Atsevišķu enantiomēru novitāte
Tikai racemāts	JĀ
Racemāts un pieminēti (+) un (-) enantiomēri	NĒ
Racemāts un tikai vispārīgi minētas optiski aktīvas formas	JĀ
Individuāli enantiomēri (ķīmiskais nosaukums, struktūrformula)	NĒ
Informācija, kas ļauj iegūt vai izdalīt atsaevišķus enantiomērus	NĒ



Kīīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

Enantiomēru izgudrojuma līmenis

Novērtējot izgudrojuma līmeni pieteikumiem, kuros ir pretenzijas uz enantiomēriem, piemēro vispārējos noteikumus, kas ir spēkā izgudrojumiem visās jomās.

Izgudrojuma līmeni novērtē, analizējot acīmredzamību ar problēmas-risinājuma pieeju.

Enantiomēriem NAV izgudrojuma līmeņa, ja tiem piemīt tāda pat aktivitāte kā jau zināmajam racēmiskajam maisījumam un nav parādīts nekāds negaidīts efekts.

Ja ir atklāts, ka enantiomēram piemīt mazāk blakusefektu nekā racēmiskajam maisījumam, tas vien neliecina par izgudrojuma līmeņa esamību, jo šajā gadījumā ir bijis mājiens tehnikas līmenī un vispārējās zināšanās.

Enantiomēru izgudrojuma līmenis: speciālas īpašības (1)

1. enantiomēra jauna terapeitiska izmantošana:

- ja tiek parādīts, ka enantiomēram ir cita terapeitiska izmantošana nekā racemātam, izgudrojums var būt patentspējīgs atkarībā no tehnikas līmeņa informācijas par savienojuma struktūru, kā arī atkarībā no enantiomēra un racemāta iedarbības veida (*mode of action*).

2. selekcija no neacīmredzamiem diastereoizomēriem:

- ja enantiomēru jāizvēlas no diastereoizomēru kopuma (savienojumiem ar vairāk par vienu asimetrisku oglekļa atomu), un tehnikas līmenī nav norāžu uz šo konkrēto enantiomēru, tad izgudrojums var būt patentspējīgs.

Enantiomēru izgudrojuma līmenis: speciālās īpašības (2)

3. aizspriedumu pārvarēšana (overcoming disincentive):

- tehnikas līmeņa aizspriedumu (piem. abiem enantiomēriem ir kvantitatīvi līdzīga aktivitāte un nav zināmas atšķirības blakusefektu izraisīšanā) pārvarēšana var dot selektīvi izolētam enantiomēram izgudrojuma līmeni atsevišķos gadījumos, ar nosacījumu, ka negaidītais efekts ir ticams.

4. reversā sinerģisma negaidīta pārvarēšana:

- ja divi enantiomēri pretdarbojas viens otram, un viena enantiomēra izdalīšana dod negaidīti labākus terapeitisko rādītājus, tam var būt izgudrojuma līmenis. Patentējams izgudrojums var būt arī aktīvā enantiomēra identificēšana terapeitiski neaktīvā racemātā.

5. ar enantiomēru bagātināts maisījums:

- ja diviem enantiomēriem ir dažādi efekti, bet lietojot to racemātā vai izdalītā veidā, kompozīcijai, kas satur ne-stehiometrisku abu savienojumu maisījumu un kam ir labāki terapeitiskie rādītāji, var būt izgudrojuma līmenis (piem. EP1146865 (+,-)-sotalols; EP1168920, EP0896530). Šādos gadījumos enantiomēru augstākā un zemākā procentuālā attiecība ir precīzi jānorāda, jo tāds definējums, ka “augstāks par 90%” ietver arī tīru enantiomēru.



Ķīmijas (farmācijas) patentu īpatnības

Jauni izgudrojumu objekti ķīmijā, kur patentspējas vērtēšanas prakse vēl tikai top:

- kombinatorās ķīmijas metodes un savienojumu bibliotēkas; (ja viela ir modelēta tikai ar datorsimulāciju, bet netiek sniegta informācija par konkrētu iedarbību un efektu, nav patentējama)
- "tālejošās" pretenzijas jeb pretenzijas uz vēl nezināmiem savienojumiem (*reach-through claims*) (ja ir zināma skrīninga metode jaunu vielu meklējumiem un tiek definētas vēl reāli neiegūtas vielas, kuras iztur šo skrīningu, šādas pretenzijas nav patentējamas)