

# Особенности патентной охраны химических соединений и способов их получения в Евразийском патентном ведомстве

М. Игнатов  
(г. Москва)  
MIgnatov@EAPO.ORG



М. Серова  
(г. Москва)  
MSerova@EAPO.ORG



В статье специалистов ЕАПВ – к.х.н.,  
начальника отдела химии и медицины  
М.Е. Игнатова и к.ю.н., зам. начальника  
отдела химии и медицины М.А. Серовой  
рассматриваются вопросы, связанные  
с патентной охраной химических  
соединений и способов их получения в ЕАПВ.  
Особое внимание авторы статьи уделяют  
требованиям к составлению формулы  
изобретения, относящегося к химическому  
соединению различной природы, и оценке  
патентоспособности такого изобретения  
в свете нормативных документов ЕАПВ.

Experts of the Eurasian patenting authority –  
head of Chemistry&Medicine Department  
M. E. Ignatov (Ph. D. in Chemistry) and his  
deputy head M. Serova (Ph. D. in Law) – review  
the issues related to patenting protection  
of chemical compounds and methods of their  
production with the Eurasian patenting authority.  
They pay specific attention to the requirements  
to the formula of the invention related  
to the chemical compound, and the evaluation  
of patentability of this invention in the view  
of the Eurasian patenting authority regulations.

## Ключевые слова:

Евразийское патентное ведомство, химическое соединение, патентоспособность, формула Маркуша, селективное изобретение, кристаллическая форма, энантиомеры, соли, метаболиты, полимеры, комплексные соединения, библиотека химических соединений.

## Keywords:

Eurasian patenting authority, chemical compound, patentability, Marcush formula, selective invention, crystal, enantiomers, salts, metabolites, polymers, complex compounds, library of chemical compounds.

## 1. Общие положения

Объект изобретения «вещество» включен в патентные законодательства всех промышленно развитых стран мира. К веществам традиционно относятся химические соединения, композиции (составы, смеси) и продукты ядерного превращения. В патентном законодательстве США принят термин «композиция вещества».

Подобно другим техническим решениям, предложения, относящиеся к веществу, должны соответствовать условиям патентоспособности, которые являются общими для всех изобретений, а именно промышленной применимости, новизне и изобретательскому уровню.

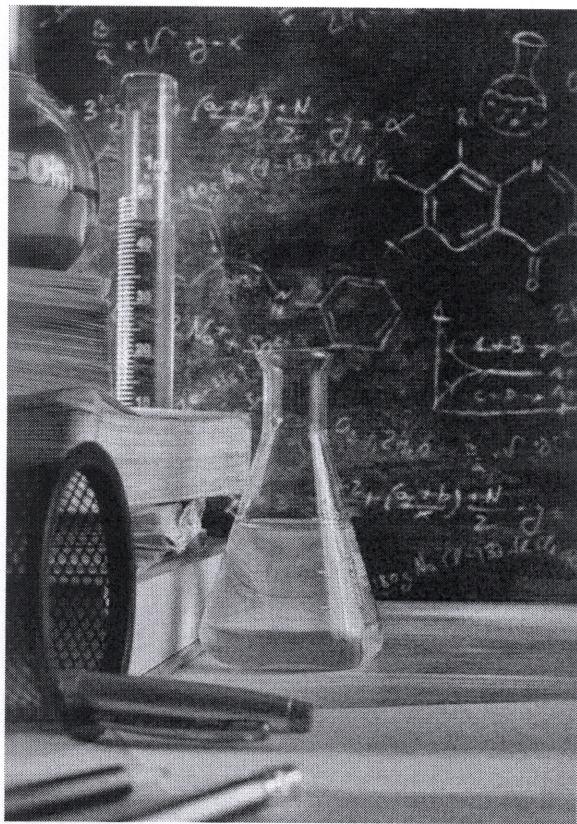
Эти критерии подробно изложены в правиле 3(1) Патентной инструкции к Евразийской патентной конвенции (ЕАПК) (Инструкция) [1] и пп. 5.5.–5.8. Правил составления, подачи и рассмотрения евразийских заявок в Евразийском патентном ведомстве (Правила ЕАПВ) [2]. Однако оценка патентоспособности вещества в силу специфики этого объекта изобретения имеет некоторые особенности, которые будут рассмотрены далее.

В формуле и описании изобретения, относящегося к веществу, оно должно быть охарактеризовано с помощью признаков, позволяющих его идентифицировать. При этом набор признаков будет зависеть от природы вещества. Согласно п. 1.1. Правил ЕАПВ, к веществам как объектам изобретения относятся химические соединения (с установленной или неустановленной структурой), к которым также отнесены высокомолекулярные соединения, а также композиции (составы, смеси) и продукты ядерного превращения.

Низкомолекулярные соединения с установленной структурой обычно характеризуются качественным и количественным составом (атомы определенных элементов и число атомов каждого элемента), связями между атомами и взаимным расположением атомов в молекуле, что выражается с помощью структурной формулы. Для описания высокомолекулярных соединений с установленной структурой используются такие признаки, как структурная формула элементарного звена макромолекулы, структура макромолекулы в целом, количество элементарных звеньев или молекулярная масса, молекулярно-массовое распределение, геометрия и стереометрия молекулы, ее концевые и боковые группы (для сополимеров дополнительно указывается соотношение сомономерных звеньев и их периодичность).

Соединения с неустановленной структурой характеризуются физико-химическими и иными параметрами (в том числе признаками способа получения), позволяющими идентифицировать данное соединение и отличить его от других аналогичных соединений, известных из предшествующего уровня техники.

Композиции характеризуются качественным и количественным составом, структурой композиции и структурой входящих в ее состав ингредиентов. Для характеристики композиции неустановленного состава могут использоваться ее физико-химические, физические и утилитарные показатели и признаки, описывающие способ получения композиции. Эти требования отражены в пп. 2.5.4.3, 2.5.4.4 и 2.6.7. Правил ЕАПВ и ниже рассмотрены более подробно применительно к различным категориям, на которые условно подразделяется вещество как объект изобретения.



© istockphoto.com/Davizro

2. Признаки, используемые для характеристики химических веществ в формуле и описании изобретения к евразийской заявке. Раскрытие соответствующих изобретений в материалах евразийской заявки и оценка их патентоспособности

### 2.1. Соединения с установленной структурой

#### 2.1.1. Индивидуальные соединения и группа соединений, описываемых общей структурной формулой

К этой категории относятся как индивидуальное химическое соединение, так и группа соединений, имеющих общий существенный структурный элемент, описываемых так называемой формулой Маркуша. В формулу изобретения, характеризующую соединение с установленной структурой, включаются его наименование по одной из общепринятых номенклатур, обычно IUPAC, или обозначение и/или структурная формула (формула Маркуша для групп-

ы соединений). Формула Маркуша должна содержать указания на все возможные значения радикалов и заместителей, входящих в общую структурную формулу химического соединения.

**Пример 1.** Формула изобретения, относящаяся к индивидуальному химическому соединению с установленной структурой.

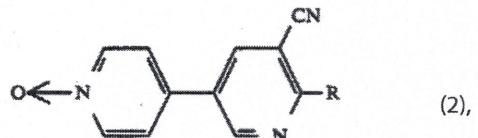
6-хлор-5,5-диметил-4-окса-1-гексин формулы:



проявляющий антимикробную активность в смазочных маслах.

**Пример 2.** Формула изобретения на группу соединений, обладающих общей фармакологической активностью, объединяемых формулой Маркуша.

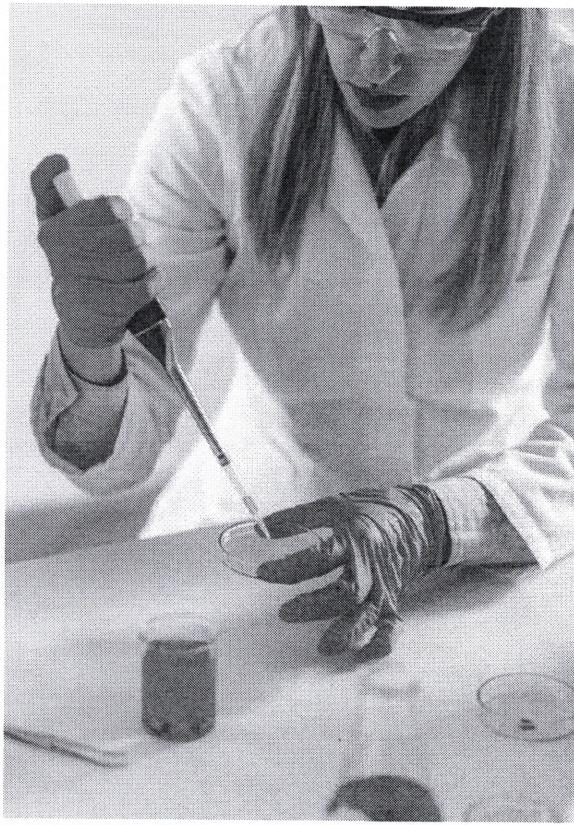
Производные 3-циан-5,4'-бипиридин-1'-оксида общей формулы:



где R представляет собой амино,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -моноалкиламино,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -диалкиламино, амино- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкиламин, ди-( $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкил)-амино- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкиламино, морфолино- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкиламино, окси- $\text{C}_2\text{-C}_4$ -алкиламино, ди-(окси- $\text{C}_2\text{-C}_4$ -алкил)-амино,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -аллокси- $\text{C}_2\text{-C}_4$ -алкиламино, морфолино,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -аллокси, диокси- $\text{C}_3\text{-C}_4$ -аллокси группу или хлор, обладающие кардиотонической и сосудорасширяющей активностью.

2. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что R представляет собой метиламино, этиламино, диметиламино, диэтиламино, 2-оксиэтиламино, 3-гидрокси-пропиламино, метокси, этокси, 2,3-диоксипропокси, морфолиногруппу или хлор.

В приведенных выше формулах изобретения указано назначение соединений. В настоящее время в мире принята практика так называемой абсолютной охраны вещества, когда в формуле изобретения, относящейся к веществу, может не приводиться его назначение. Однако такое назначение



© istockphoto.com/microgen

должно быть обязательно указано в материалах заявки и, кроме того, в них должны быть приведены сведения, подтверждающие возможность использования указанного соединения по этому назначению. Для биологически активных веществ приводятся показатели их активности (при необходимости – токсичности и/или избирательности действия). Также в материалах заявки должен быть раскрыт способ получения соединения. Эти требования являются общими для всех веществ, однако поскольку формула Маркуша не соответствует какому-либо одному определенному соединению, а удобным образом обобщает большое число конкретных структур, то требования, предъявляемые евразийским патентным законодательством к характеристике соответствующего изобретения, имеют свои специфические особенности.

Если изобретение относится к группе (ряду) новых химических соединений с установленной структурой, описываемых формулой Маркуша, то, согласно п. 2.5.6.3. Правил ЕАПВ, материалами заявки под-

тверждается возможность получения всех соединений группы (ряда) путем приведения сведений, включающих общую схему способа получения соединений, а также примера получения, по меньшей мере, одного соединения группы (ряда) и, кроме того, показывается возможность реализации по указанному назначению, по меньшей мере, одного соединения группы (ряда).

Если группа (ряд) новых химических соединений с общим существенным структурным элементом включает (представляет собой) соединения с разными по химической природе радикалами, то приводятся примеры, достаточные для подтверждения возможности получения соединений с этими разными радикалами, и обоснования возможности реализации всех таких соединений по заявленному назначению.

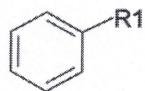
В примерах осуществления изобретения раскрывается способ получения определенного соединения с указанием его выхода (в граммах и/или процентах) и физико-химических констант, подтверждающих факт получения данного соединения, и приводятся результаты анализа, доказывающие структуру полученного соединения (это могут быть данные ЯМР, ИК-спектроскопии, дифференциально-термического анализа и т.д.). Для высокомолекулярных соединений обычно используются специфические характеристики – молекулярно-массовое распределение ( $M_w/M_n$ ), количество полимера, растворимого в ксиоле (XS) и т. д.

Вопрос достаточности приведенных в описании к заявке примеров, подтверждающих объем притязаний, в каждом конкретном случае должен решаться отдельно в зависимости от того, сколько заместителей имеет заявленное соединение и какова их природа. Наиболее простые случаи относятся к соединениям, имеющим один или более заместителей одинаковой химической природы. Под одинаковыми по химической природе радикалами обычно понимаются радикалы-гомологи (скажем, отличающиеся только количеством групп –  $\text{CH}_2-$ , галогены, металлы одной группы периодической таблицы элементов (например, щелочные или щелочно-земельные металлы) и т. д.

При этом в качестве общего правила следует отметить, что не требуются примеры для каждого

заявленного значения радикала, если этот радикал относится к конкретной группе определенной химической природы. Например, если заявлено химическое соединение, содержащее в качестве одного из радикалов группу –(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>–, где n=1–10, достаточно приведения одного примера получения соединения, в котором n будет иметь одно из значений от 1 до 10. Для арильных заместителей обычно бывает достаточно привести пример получения соединения, содержащего фенил в качестве одного из значений радикалов. Если в структуре заявленного соединения присутствует фрагмент, содержащий гетероатом (в алкильной цепочке или в цикле), следует представить примеры получения соединений, в которых, по меньшей мере, один из заместителей содержит соответствующий гетероатом в алкильной цепочке или гетероцикле.

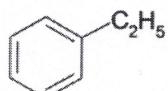
*Пример 3.* Заявлена группа соединений следующей формулы:



(3),

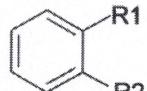
где R1 представляет собой C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>-алкил.

В данном случае нет необходимости в приведении примеров для каждого числового значения указанного радикала. Для подтверждения объема притязаний достаточно одного примера, подтверждающего получение и свойства соединения, содержащего любое от одного до шести число атомов углерода в алкильном заместителе, например, этилбензола:



(4).

*Пример 4.* Заявлена группа соединений следующей формулы:



(5),

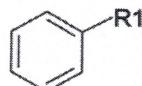
где R1 представляет собой C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>-алкил и R2 представляет собой галоген.

В данном случае для подтверждения объема притязаний также достаточно приведения одного примера, подтверждающего получение и свойства соединения, содержащего любое от одного до шести числовых значений радикалов группы –(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>–, где n=1–10.

нения, содержащего любое от одного до шести числовых значений радикалов группы –(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>–, где n=1–10, достаточно приведения одного примера получения соединения, в котором n будет иметь одно из значений от 1 до 10. Для арильных заместителей обычно бывает достаточно привести пример получения соединения, содержащего фенил в качестве одного из значений радикалов. Если в структуре заявленного соединения присутствует фрагмент, содержащий гетероатом (в алкильной цепочке или в цикле), следует представить примеры получения соединений, в которых, по меньшей мере, один из заместителей содержит соответствующий гетероатом в алкильной цепочке или гетероцикле.

Если заявленная группа химических соединений включает соединения, имеющие заместители с разной по химической природе радикалами, то в материалах заявки должны быть приведены примеры, подтверждающие получение, по меньшей мере, одного соединения, относящегося к каждой из групп соединений с этими разными радикалами.

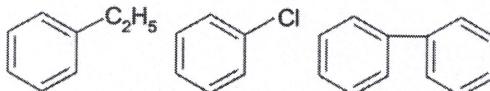
*Пример 5.* Заявлена группа соединений следующей формулы:



(7),

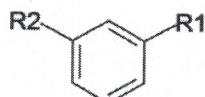
где R1 представляет собой C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>-алкил, галоген или C<sub>6</sub>–C<sub>10</sub>-арил.

В данном случае для подтверждения объема притязаний следует представить, по меньшей мере, три примера, раскрывающие получение трех соединений, в которых R1 будет представлять собой, например, этил (C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), хлор (Cl) и фенил (C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>), соответственно:



(8).

*Пример 6.* Заявлена группа химических соединений следующей формулы:

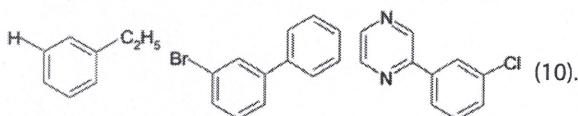


(9),

где R1 представляет собой C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>-алкил, галоген или C<sub>6</sub>–C<sub>10</sub>-арил и R2 представляет собой H, Br или 6-членный гетероцикл, содержащий два атома азота.

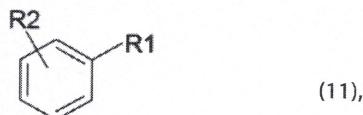
В данном случае для подтверждения объема притязаний достаточно представить три примера, раскрывающие получение трех соединений, в которых R1 будет представлять собой, например, этил (C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>),

хлор (Cl) и фенил ( $C_6H_5$ ), а R2 – H, Br и указанный гетероцикл, в частности, пиразин, соответственно:



В рассматриваемом примере, где в бензольном кольце имеются два заместителя в разных положениях цикла относительно друг друга (в данном случае – в метаположении), в приводимых сведениях о получении соединений, подтверждающих объем притязаний, соответствующие заместители R1 и R2 также должны находиться в метаположении по отношению друг к другу.

Если же формула изобретения представлена следующим образом:



это указывает на то, что в заявленной группе соединений, описываемых формулой Маркуша, положение заместителя R1 строго фиксировано (он расположен у атома  $C_2$  бензольного кольца), тогда как второй заместитель R2 может располагаться при любом другом атоме С бензольного кольца. В данном случае следует привести примеры, подтверждающие получение соединений, в которых радикал R2 находится в разных положениях бензольного кольца.

Когда в формуле изобретения, относящегося к химическому соединению с установленной структурой и представленного формулой Маркуша, при характеристике значений органических радикалов, входящих в тот или иной заместитель, отсутствует указание на количество атомов углерода и/или гетероатомов, содержащихся в этом заместителе, например, указано на «алкил», «арил», «гетероцикль» и т. д., то такая формула изобретения противоречит правилу 21<sup>1</sup>(4) Инструкции, поскольку не является ясной и точной и не позволяет однозначно определить объем притязаний. В этой ситуации заявителю следует включить в формулу изобретения необхо-

димые сведения из материалов заявки, указав на количество атомов углерода и/или гетероатомов в соответствующих значениях заместителей (например, в описании отмечено, что алкил представляет собой  $C_1-C_{10}$ ), или, если таковые отсутствуют, ограничить свои притязания на основании имеющихся примеров (так, если в материалах заявки показано только получение соединений, где алкил представляет собой  $C_2$ - и  $C_{10}$ -алкил, то в формулу изобретения можно включить значения этого заместителя только как  $C_2-C_{10}$ -алкил).

Аналогичные требования касаются и таких выражений, используемых в формуле изобретения, как «низший алкил», «низший алcoxси», «низший циклоалкил» и т.д. Признак «низший» в данном случае не является точным, поскольку не находит четкого и однозначного отражения в научной литературе. Так, одни специалисты относят к низшим алкилам соединения, содержащие от 1 до 4 атомов углерода [3], тогда как другие считают «низшими»  $C_1-C_{12}$  алкилы<sup>1</sup>.

Если в первоначальных материалах заявки (в формуле и описании изобретения) значение одного из радикалов в формуле Маркуша было представлено как  $C_1-C_{10}$ -алкил, но в описании отсутствуют сведения, подтверждающие возможность получения соединений, в которых в качестве алкильного заместителя использованы, например, пропил ( $C_3$ -алкил) или пентил ( $C_5$ -алкил), то включение в формулу изобретений таких значений указанного радикала, как  $C_3-C_{10}$ -алкил или  $C_5-C_{10}$ -алкил, неправомерно, поскольку такие признаки ( $C_3$ - и  $C_5$ -алкил) отсутствовали в первоначальных материалах заявки (п. 5.4. Правил ЕАПВ).

Количество приводимых примеров также зависит от уже известных закономерностей для соединений известного класса. Например, в некоторых ситуациях эти закономерности позволяют распространить свойства одного или нескольких представителей на всю группу соединений, в других – такая возможность отсутствует, и количество примеров должно обеспечить правомерность вывода о сходстве свойств для всей группы (всего ряда) заявленных соединений. Обычно достаточным является

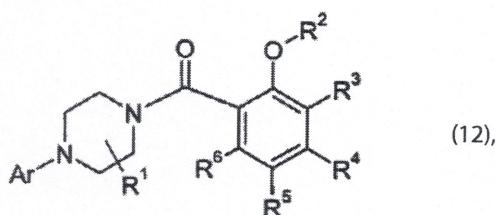
<sup>1</sup> Международная заявка WO 97/33881.

приведение одного примера получения соединения, относящегося к каждой из групп соединений с радикалами разной химической природы.

В случае отсутствия в материалах заявки примеров получения соединений с радикалом определенной химической природы заявителю направляется уведомление с предложением представить соответствующий пример или ограничить свои притязания, исключив из формулы изобретения данное значение радикала.

Приведенные выше примеры 3–6 могут служить лишь иллюстрацией общего подхода к анализу достаточности приводимых в материалах заявки сведений для подтверждения возможности осуществления изобретения, относящегося к химическому соединению с установленной структурой, в полном объеме, поскольку на практике такие «простые» в структурном отношении соединения крайне редко становятся объектами изобретения. Обычно в одной заявке патентная охрана испрашивается на такое число химических соединений, описываемых формулой Маркуша, которое иногда даже трудно оценить без привлечения принципов комбинаторики, не говоря уже о количестве примеров, необходимых для подтверждения всего объема притязаний. Обусловлено это чрезвычайным разнообразием функциональных групп и радикалов в органической химии и желанием заявителей охватить в рамках одной химической формулы как можно большее количество соединений, многие из которых реально даже не были получены.

В качестве примера можно привести следующую структурную формулу:



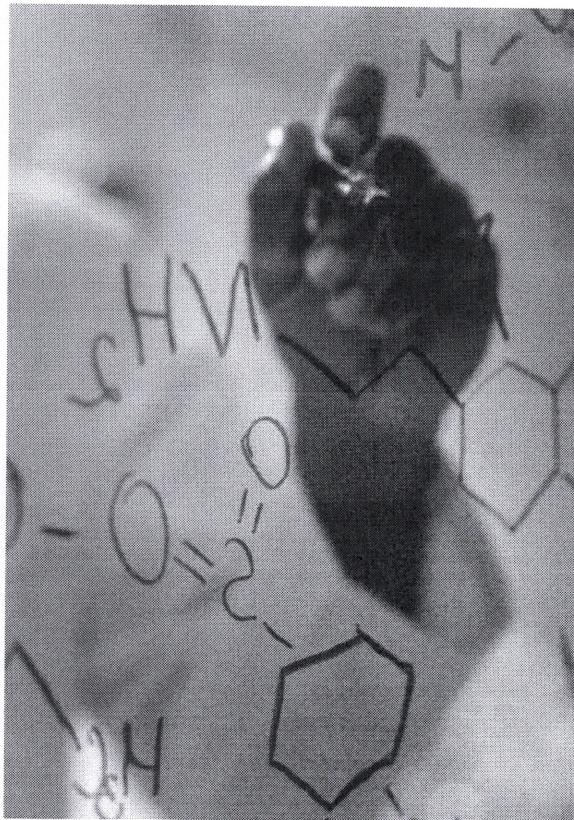
где указанные радикалы не только не имеют одинаковой химической природы, но содержат так называемые «подрадикалы», которые, в свою очередь, также могут быть функциональными группами принципиально различного строения.

Так, например, Ar представляет собой незамещенный или замещенный арил или 6-членный гетероарил, содержащий один, два или три атома азота, причем арильная или гетероарильная группы могут быть замещены одним или более заместителями, выбранными из группы, включающей гидрокси, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, необязательно замещенный галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, необязательно замещенный галогеном, NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, COR<sup>9</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>10</sup> или 5–6-членным ароматическим гетероциклом, содержащим 1–4 гетероатома, выбранных из N, O или S, который необязательно замещен C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилом. При этом, например, R<sup>9</sup> представляет собой водород, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси или NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, а R<sup>10</sup> – C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, необязательно замещенный галогеном, (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкилом, (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси, (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-гетероциклоалкилом или NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>.

Количество пунктов формулы изобретения, относящихся к группе химических соединений, описываемых формулой Маркуша, нормативными документами ЕАПВ не ограничено. Такая формула изобретения может содержать один независимый пункт, в котором приведена общая структурная формула заявленной группы соединений, и достаточно большое количество зависимых пунктов, в которых представлены «более узкие» группы соединений, вплоть до перечисления конкретных соединений, подпадающих под общую структурную формулу. Например, зависимый пункт может быть изложен следующим образом: «Соединение по п. 1, выбранное из группы, включающей... (далее следует перечисление отдельных соединений)».

При этом в зависимые пункты, относящиеся к конкретным соединениям, следует включать только те соединения, которые были действительно получены и охарактеризованы.

Возможно также включение в формулу изобретения наряду с независимым п. 1, содержащим общую структурную формулу всех заявленных соединений, других независимых пунктов, относящихся к «более узким» группам соединений или вообще к отдельным соединениям, так же как и указано выше, подпадающим под общую структурную формулу, приведенную в п. 1. Такая практика обычно используется заявителем в том случае, когда он считает соединения, включенные в «дополнительные» независимые



© istockphoto.com/Zinkevych

пункты, наиболее перспективными для их дальнейшего производства, изучения и использования.

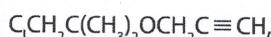
Следует отметить, что общие требования к зависимым пунктам формулы изобретения изложены в правиле 24(6) Инструкции и в п. 2.6.4. Правил ЕАПВ. Зависимый пункт формулы изобретения содержит развитие и/или уточнение совокупности признаков изобретения, содержащихся в соответствующем независимом и/или зависимом пункте. Развитие и/или уточнение в зависимом пункте признака, представляющего собой родовое понятие, отражающее назначение изобретения, может быть осуществлено только конкретизацией или уточнением назначения, содержащегося в независимом пункте формулы изобретения. Как отмечалось выше, формула на химическое соединение может не содержать указания на его назначение. В этом случае зависимые пункты, если таковые имеются в формуле изобретения, должны относиться только к конкретным соединениям или группе соединений, подпадающих под общую структурную формулу, приведенную в соот-

ветствующем независимом пункте, и не содержать каких-либо указаний на их назначение.

Если независимый пункт формулы изобретения, относящегося к химическому соединению, содержит указание на его назначение (см. примеры 1 и 2), то в зависимых пунктах формулы могут быть представлены сведения, уточняющие или развивающие это назначение.

#### Пример 7.

1. 6-хлор-5,5-диметил-4-окса-1-гексин формулы:

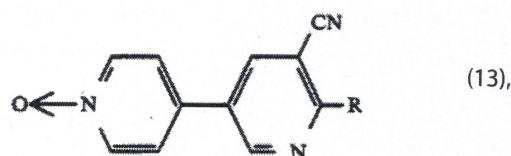


проявляющий антимикробную активность в смазочных маслах.

2. Соединение по п. 1, проявляющее антимикробную активность в смазочных маслах в отношении грибов рода Fusarium.

#### Пример 8.

1. Производные 3-циан-5,4'-бипиридин-1'-оксида общей формулы:



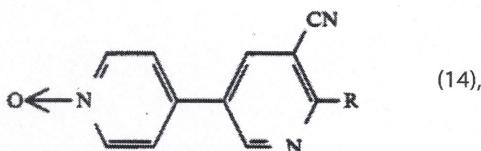
где R представляет собой амино,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -моноалкиламино,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -диалкиламино, амино- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкиламино, ди-( $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкил)-амино- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкиламино, морфолино- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -алкиламино, окси- $\text{C}_2\text{-C}_4$ -алкиламино, ди-(окси- $\text{C}_2\text{-C}_4$ -алкил)-амино,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -аллокси- $\text{C}_2\text{-C}_4$ -алкиламино, морфолино,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -аллокси, диокси- $\text{C}_3\text{-C}_4$ -аллокси группу или хлор, обладающие кардиотонической и сосудорасширяющей активностью.

2. Соединение по п. 1, отличающееся тем, что R представляет собой метиламино, этиламино, диметиламино, диэтиламино, 2-оксиэтиламино, 3-гидроксипропиламино, метокси, этокси, 2,3-диоксипропокси, морфолингруппу или хлор, обладающие сосудорасширяющей активностью при острой сердечной недостаточности.

Если в первом независимом пункте формулы изобретения, относящегося к группе химических соединений, не указано их назначение, заявитель может включить в формулу другой независимый пункт, характеризующий «более узкую» группу этих соединений, или даже одно из них, указав в этом пункте назначение соединений (соединения).

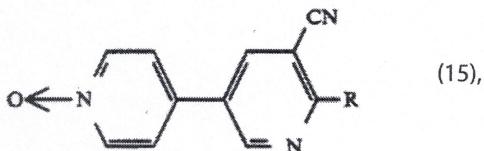
*Пример 9.*

1. Производные 3-циан-5,4'-бипиридин-1'-оксида общей формулы:



где R представляет собой амино,  $C_1$ - $C_4$ -моноалкиламино,  $C_1$ - $C_4$ -диалкиламино, амино- $C_1$ - $C_4$ -алкиламино, ди-( $C_1$ - $C_4$ -алкил)-амино- $C_1$ - $C_4$ -алкиламино, морфолино- $C_1$ - $C_4$ -алкиламино, окси- $C_2$ - $C_4$ -алкиламино, ди-(окси- $C_2$ - $C_4$ -алкил)-амино,  $C_1$ - $C_4$ -аллокси- $C_2$ - $C_4$ -алкиламино, морфолино,  $C_1$ - $C_4$ -аллокси, диокси- $C_3$ - $C_4$ -аллокси группу или хлор.

2. Производные 3-циан-5,4'-бипиридин-1'-оксида общей формулы:



где R представляет собой амино или хлор, обладающие кардиотонической и сосудорасширяющей активностью.

Изобретение, относящееся к индивидуальному химическому соединению или группе соединений, охарактеризованных формулой Маркуша, должно соответствовать всем условиям патентоспособности (правило 3(1) Инструкции).

Для установления соответствия изобретения, относящегося к химическому соединению, условию патентоспособности «промышленная применимость» необходимо, чтобы в описании изобретения были указаны его назначение и утилитарные свойства,

а также приведены физико-химические характеристики. Кроме того, в материалах заявки должен быть раскрыт способ получения соединения (если он не является для специалиста очевидным).

Для биологически активных соединений должны быть приведены данные по активности и, при необходимости, токсичности (п. 2.5.6.3. Правил ЕАПВ).

Простое указание в описании заявки на возможность использования предложенного соединения (группы соединений) в той или иной области техники, отрасли промышленности и т.п., не может служить основанием для подтверждения соответствия такого технического решения условию патентоспособности «промышленная применимость».

В этой ситуации заявителю направляется уведомление о необходимости представления указанных выше конкретных данных или приведения известных из уровня техники источников информации, которые однозначно позволяют экспертизе сделать вывод о соответствии заявленного изобретения указанному условию патентоспособности.

При оценке новизны химических соединений, независимо от того, включает ли формула изобретения указание на их назначение или нет, главную роль играет патентный поиск, направленный на выявление в известном уровне техники соединений, структурно идентичных заявленным. Наибольшие сложности возникают в том случае, когда объектом изобретения является группа химических соединений, описываемых формулой Маркуша, которая, как уже отмечалось, может включать практически неограниченное число соединений.

Необходимо отметить, что известность общей структурной формулы не порочит новизну конкретного соединения, подпадающего под эту формулу. Однако раскрытие конкретного соединения порочит новизну изобретения, охарактеризованного общей структурной формулой, включающей это соединение, но только в части данного соединения, и не порочит новизну других соединений, охватываемых этой общей формулой. Поэтому если часть заявленных соединений, описываемых общей структурной формулой, известна из уровня техники, эти соединения должны быть исключены из притязаний.

Такое уточнение формулы изобретения может быть сделано либо путем исключения из притязаний каких-либо конкретных значений радикалов, входящих в общую структурную формулу, либо исключением отдельных соединений в случае, если их количество невелико, либо включением в соответствующий пункт формулы изобретения так называемого «дисклеймера», например, в виде: «при условии, что когда R<sup>1</sup> представляет собой водород, R<sup>2</sup> не является C<sub>1-6</sub>-алкилом, C<sub>6-10</sub>-арилом или 5-членным гетероциклом, содержащим два атома азота».

При этом следует иметь в виду, что новизна химического соединения может быть опровергнута, если из уровня техники известна его структурная формула (или название в соответствии с одной из принятых номенклатур), а также известен способ получения, или известны сведения о фактическом получении и/или использовании соединения, или известно о возможности открытого доступа к этому соединению. Иными словами, «просто бумажная формула» не может быть противопоставлена заявленному химическому соединению по новизне.

Определение соответствия химического соединения условию патентоспособности «изобретательский уровень» основано на анализе структуры соединения с одновременной оценкой очевидности

проявления им утилитарного свойства, указанного в описании. Если химическое соединение является новым и не сходным по структуре с каким-либо известным соединением, оно признается также и соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень» и дополнительная оценка наличия у соединения «неочевидных» свойств не требуется.

Однако если известное и заявленное соединение или группа соединений имеют общий основной структурный элемент и различаются только характером заместителей, расположенных «на периферии» общего структурного элемента, требуется проведение дополнительного анализа на соответствие такого изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень». При этом следует учитывать, что чаще всего именно общий структурный элемент определяет свойства (химические, биологические) всей группы соединений, а упомянутые выше заместители обычно оказывают лишь незначительное влияние на эти свойства. Задача эксперта при рассмотрении таких изобретений заключается в том, чтобы на основании общих знаний в данной области, известного уровня техники и сведений, содержащихся в материалах заявки, установить очевидность или неочевидность заявленного технического решения. ■

(Окончание следует)

## ЛИТЕРАТУРА:

1. Патентная инструкция к Евразийской патентной конвенции [Электронный ресурс] / <http://www.eapo.org/ru/documents>.
2. Правила составления, подачи и рассмотрения евразийских заявок в Евразийском патентном ведомстве. Утв. приказом ЕАПВ от 15 февраля 2008 г. № 4 с изменениями и дополнениями, утвержденными приказом ЕАПВ от 19 декабря 2011 г. № 63, приказом ЕАПВ от 14 июня 2012 г. № 31. [Электронный ресурс] / <http://www.eapo.org/ru/documents>.
3. Химическая энциклопедия. – М.: Советская энциклопедия, 1998; Т. 3, с. 177.