

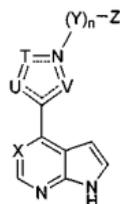
ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии палаты по патентным спорам
по результатам рассмотрения возражения заявления

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 Общества с ограниченной ответственностью «Аксельфарм» (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее 25.03.2024, против действия на территории Российской Федерации евразийского патента на изобретение ЕА № 019504, при этом установлено следующее.

Евразийский патент ЕА № 019504 на группу изобретений «ГЕТЕРОАРИЛЗАМЕЩЕННЫЕ ПИРРОЛО[2,3-*b*]ПИРИДИНЫ И ПИРРОЛО[2,3-*b*]ПИРИМИДИНЫ В КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ ЯНУСКИНАЗЫ», выдан по заявке ЕА №200870048 на имя ИНСАЙТ КОРПОРЕЙШН, (США) (далее – патентообладатель) с приоритетами от 2005.12.13, 2006.06.02, 2006.10.10, 2006.11.03, 2006.11.16, установленными по заявкам № 60/749,905, №60/810,231, №60/850,625, №60/856,872, №60/859,404, поданным в Патентное ведомство США.

Патент действует со следующей формулой:

1. Соединение формулы



или его фармацевтически приемлемая соль, где
T, U и V независимо выбирают из O, S, N, CR⁵ и NR⁶;

где 5-членное кольцо, образованное атомом углерода, атомом азота, U, T и V, является ароматическим;

X представляет собой N или CR⁴;

n равно 0 или

n равно 1 и Y представляет собой C₁₋₈ алкилен, C₂₋₈ алкенилен, (CR¹¹R¹²)_pC(O)(CR¹¹R¹²)_q, (CR¹¹R¹²)_pC(O)NR^c(CR¹¹R¹²)_q, (CR¹¹R¹²)_pC(O)O(CR¹¹R¹²)_q или (CR¹¹R¹²)_pOC(O)(CR¹¹R¹²)_q, где указанные C₁₋₈ алкилен или C₂₋₈ алкенилен необязательно замещены 1, 2 или 3 заместителями, выбранными из галогена, OH, CN, amino, C₁₋₄ алкиламино или C₂₋₈ диалкиламино;

Z представляет собой арил, циклоалкил, гетероарил или гетероациклоалкил, каждый из которых необязательно замещен 1, 2, 3, 4, 5 или 6 заместителями, выбранными из галогена, C₁₋₄ алкила, C₂₋₄ алкенила, C₂₋₄ алкинила, C₁₋₄ галогеналкила, C₁₋₄ гидроксильного алкила, C₁₋₄ цианоалкила, Cy¹, CN, NO₂, OR^a, SR^a, C(O)R^b, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, OC(O)R^b, OC(O)NR^cR^d, NR^cR^d, NR^cC(O)R^b, NR^cC(O)NR^cR^d, NR^cC(O)OR^a, S(O)R^b, S(O)NR^cR^d, S(O)₂R^b, NR^cS(O)₂R^b и S(O)₂NR^cR^d;

Cy¹ независимо выбирают из арила, гетероарила, циклоалкила и гетероциклоалкила, каждый из которых необязательно является замещенным 1, 2, 3, 4 или 5 заместителями, независимо выбранными из галогена, C₁₋₄ алкила, C₂₋₄ алкенила, C₂₋₄ алкинила, C₁₋₄ галогеналкила, CN, NO₂, OR^a, SR^a, C(O)R^b, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, OC(O)R^b, OC(O)NR^cR^d, NR^cR^d, NR^cC(O)R^b, NR^cC(O)OR^a, S(O)R^b, S(O)NR^cR^d, S(O)₂R^b и S(O)₂NR^cR^d;

R⁴ независимо выбирают из H;

R⁵ представляет собой H, галоген, C₁₋₄ алкил, C₂₋₄ алкенил, C₂₋₄ алкинил, C₁₋₄ галогеналкил, CN, NO₂, OR⁷, SR⁷, C(O)R⁸, C(O)NR⁹R¹⁰, C(O)OR⁷, OC(O)R⁸, OC(O)NR⁹R¹⁰, NR⁹R¹⁰, NR⁹C(O)R⁸, NR⁹C(O)OR⁷, S(O)R⁸, S(O)NR⁹R¹⁰, S(O)₂R⁸, NR⁹S(O)₂R⁸ и S(O)₂NR⁹R¹⁰;

R⁶ представляет собой H, C₁₋₄ алкил, C₂₋₄ алкенил, C₂₋₄ алкинил, C₁₋₄ галогеналкил, OR⁷, C(O)R⁸, C(O)NR⁹R¹⁰, C(O)OR⁷, S(O)R⁸, S(O)NR⁹R¹⁰, S(O)₂R⁸ или S(O)₂NR⁹R¹⁰;

R⁶ представляет собой H, C₁₋₄ алкил, C₂₋₄ алкенил, C₂₋₄ алкинил, C₁₋₄ галогеналкил, OR⁷, C(O)R⁸, C(O)NR⁹R¹⁰, C(O)OR⁷, S(O)R⁸, S(O)NR⁹R¹⁰, S(O)₂R⁸ или S(O)₂NR⁹R¹⁰;

R⁷ представляет собой H, C₁₋₆ алкил, C₁₋₆ галогеналкил, C₂₋₆ алкенил, C₂₋₆ алкинил, арил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил, арилалкил, гетероарилалкил, циклоалкилалкил или гетероциклоалкилалкил;

R⁸ представляет собой H, C₁₋₆ алкил, C₁₋₆ галогеналкил, C₂₋₆ алкенил, C₂₋₆ алкинил, арил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил, арилалкил, гетероарилалкил, циклоалкилалкил или гетероциклоалкилалкил;

R⁹ и R¹⁰ независимо выбирают из H, C₁₋₁₀ алкила, C₁₋₆ галогеналкила, C₂₋₆ алкенила, C₂₋₆ алкинила, C₁₋₆ алкилкарбонила, арилкарбонила, C₁₋₆ алкилсульфонила, арилсульфонила, арила, гетероарила, циклоалкила, гетероциклоалкила, арилалкила, гетероарилалкила, циклоалкилалкила и гетероциклоалкилалкила;

или R⁹ и R¹⁰ вместе с атомом N, к которому они присоединены, образуют 4-, 5-, 6- или 7-членную гетероциклоалкильную группу;

R¹¹ и R¹² независимо выбирают из H, галогена, OH, CN, H, C₁₋₄ алкила, C₁₋₄ галогеналкила, C₂₋₄ алкенила, C₂₋₄ алкинила, C₁₋₄ гидроксильного алкила, C₁₋₄ цианоалкила, арила, гетероарила, циклоалкила и гетероциклоалкила;

R^a и $R^{a'}$ представляют собой H, C_{1-6} алкил, C_{1-6} галогеналкил, C_{2-6} алкенил, C_{2-6} алкинил, арил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил, арилалкил, гетероарилалкил, циклоалкилалкил и гетероциклоалкилалкил,

где указанный C_{1-6} алкил, C_{1-6} галогеналкил, C_{2-6} алкенил или C_{2-6} алкинил, арил, циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил, арилалкил, гетероарилалкил, циклоалкилалкил и гетероциклоалкилалкил являются необязательно замещенными 1, 2 или 3 заместителями, независимо выбранными из OH, CN, amino, галогена, C_{1-6} алкила, C_{1-6} галогеналкила, галогенсульфанила, арила, арилалкила, гетероарила, гетероарилалкила, циклоалкила и гетероциклоалкила;

R^b и $R^{b'}$ независимо выбирают из H, C_{1-6} алкила, C_{1-6} галогеналкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, арила, циклоалкила, гетероарила, гетероциклоалкила, арилалкила, гетероарилалкила, циклоалкилалкила и гетероциклоалкилалкила, где указанный C_{1-6} алкил, C_{1-6} галогеналкил, C_{2-6} алкенил, C_{2-6} алкинил, арил,

циклоалкил, гетероарил, гетероциклоалкил, арилалкил, гетероарилалкил, циклоалкилалкил или гетероциклоалкилалкил необязательно является замещенным 1, 2 или 3 заместителями, независимо выбранными из OH, CN, amino, галогена, C_{1-6} алкила, C_{1-6} галогеналкила, галогенсульфанила, арила, арилалкила, гетероарила, гетероарилалкила, циклоалкила и гетероциклоалкила;

R^c и R^d независимо выбирают из H, C_{1-10} алкила, C_{1-6} галогеналкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, где указанный C_{1-10} алкил, C_{1-6} галогеналкил, C_{2-6} алкенил или C_{2-6} алкинил необязательно является замещенным 1, 2 или 3 заместителями, независимо выбранными из Cy^1 , $-(C_{1-6}$ алкил)- Cy^1 , OH, CN, amino, галогена, C_{1-6} алкила, C_{1-6} галогеналкила, C_{1-6} галогеналкила, арила, аралкила, гетероарила, гетероарилалкила, циклоалкила или гетероциклоалкила;

или R^c и R^d вместе с атомом N, к которому они присоединены, образуют 4-, 5-, 6- или 7-членную гетероциклоалкильную группу, необязательно замещенную 1, 2 или 3 заместителями, независимо выбранными из OH, CN, amino, галогена, C_{1-6} алкила, C_{1-6} галогеналкила, арила, аралкила, гетероарила, гетероарилалкила, циклоалкила и гетероциклоалкила;

$R^{c'}$ и $R^{d'}$ независимо выбирают из H, C_{1-10} алкила, C_{1-6} галогеналкила, C_{2-6} алкенила, C_{2-6} алкинила, арила, гетероарила, циклоалкила, гетероциклоалкила, арилалкила, гетероарилалкила, циклоалкилалкила и гетероциклоалкилалкила, где указанный C_{1-10} алкил, C_{1-6} галогеналкил, C_{2-6} алкенил, C_{2-6} алкинил, арил, гетероарил, циклоалкил, гетероциклоалкил, арилалкил, гетероарилалкил, циклоалкилалкил или гетероциклоалкилалкил необязательно является замещенным 1, 2 или 3 заместителями, независимо выбранными из OH, CN, amino, галогена, C_{1-6} алкила, C_{1-6} галогеналкила, галогенсульфанила, C_{1-6} галогеналкила, арила, арилалкила, гетероарила, гетероарилалкила, циклоалкила и гетероциклоалкила;

или $R^{c'}$ и $R^{d'}$ вместе с атомом N, к которому они присоединены, образуют 4-, 5-, 6- или 7-членную гетероциклоалкильную группу, необязательно замещенную 1, 2 или 3 заместителями, независимо выбранными из OH, CN, amino, галогена, C_{1-6} алкила, C_{1-6} галогеналкила, C_{1-6} галогеналкила, арила, арилалкила, гетероарила, гетероарилалкила, циклоалкила и гетероциклоалкила;

p равно 0, 1, 2, 3, 4, 5 или 6; и

q равно 0, 1, 2, 3, 4, 5 или 6;

где "арил" относится к моноциклическим или полициклическим ароматическим углеводородам, которые содержат от 6 до примерно 20 атомов углерода;

"гетероарил" относится к моноциклическому или полициклическому ароматическому гетероциклу, имеющему от 1 до 4 гетероатомов в кольце, выбранных из серы, кислорода или азота, содержащему от 1 до примерно 20 атомов углерода;

"циклоалкил" относится к моно- или полициклическим неароматическим циклическим углеводородам, которые включают циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил, циклопентенил, циклогексенил, циклогексаденил, циклогептатриенил, норборнил, норпинил, норкарнил или адамантил;

"гетероциклоалкил" относится к моноциклическим или полициклическим неароматическим гетероциклам, имеющим от 1 до 4 гетероатомов в кольце и включающим от 3 до 20 атомов углерода;

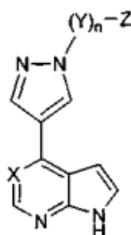
"арилалкил" относится к алкилу, замещенному арилом, при этом алкил содержит от 1 до 6 атомов углерода;

"циклоалкилалкил" относится к алкилу, замещенному циклоалкилом, при этом алкил содержит от 1 до 6 атомов углерода;

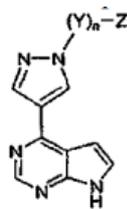
"гетероарилалкил" относится к алкилу, замещенному гетероарилом, имеющему от 1 до 4 гетероатомов в кольце, выбранных из серы, кислорода или азота, при этом алкил содержит от 1 до 6 атомов углерода; и

"гетероциклоалкилалкил" относится к алкилу, замещенному гетероциклоалкилом, при этом алкил содержит от 1 до 6 атомов углерода.

2. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где X представляет собой N.
3. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где X представляет собой CR⁴.
4. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где 5-членное кольцо, образованное атомом углерода, атомом азота, U, T и V, представляет собой пирролил, пиразолил или имидазолил.
5. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где n равно 0.
6. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где n равно 1.
7. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где n равно 1 и Y представляет собой C₁₋₈ алкилен, (CR¹¹R¹²)_pC(O)(CR¹¹R¹²)_q, (CR¹¹R¹²)_pC(O)NR^c(CR¹¹R¹²)_q или (CR¹¹R¹²)_pC(O)O(CR¹¹R¹²)_q, где указанный C₁₋₈ алкилен необязательно является замещенным 1, 2 или 3 галогенами, OH, CN, amino, C₁₋₄ алкиламино или C₂₋₈ диалкиламино.
8. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где n равно 1 и Y представляет собой C₁₋₈ алкилен, необязательно замещенный 1, 2 или 3 галогенами, OH, CN, amino, C₁₋₄ алкиламино или C₂₋₈ диалкиламино.
9. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где n равно 1 и Y представляет собой ((CR¹¹R¹²)_pC(O)(CR¹¹R¹²)_q, (CR¹¹R¹²)_pC(O)NR^c(CR¹¹R¹²)_q или ((CR¹¹R¹²)_pC(O)O(CR¹¹R¹²)_q.
10. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где r равно 0.
11. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где r равно 1.
12. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где r равно 2.
13. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где q равно 0.
14. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где q равно 1.
15. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где q равно 2.
16. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где один из r и q равен 0, а другой из r и q равен 1, 2 или 3.
17. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где Z представляет собой циклоалкил, который необязательно замещен 1, 2, 3, 4, 5 или 6 заместителями, выбранными из галогена, C₁₋₄ алкила, C₂₋₄ алкенила, C₂₋₄ алкинила, C₁₋₄ галогеналкила, C₁₋₄ гидроксилалкила, C₁₋₄ цианоалкила, Cy¹, CN, NO₂, OR^a, SR^a, C(O)R^b, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, OC(O)R^b, OC(O)NR^cR^d, NR^cR^d, NR^cC(O)R^b, NR^cC(O)NR^cR^d, NR^cC(O)OR^a, S(O)R^b, S(O)NR^cR^d, S(O)₂R^b, NR^cS(O)₂R^b и S(O)₂NR^cR^d.
18. Соединение по п.17 или его фармацевтически приемлемая соль, где n равно 1.
19. Соединение по п.17 или его фармацевтически приемлемая соль, где n равно 0.
20. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где Z представляет собой гетероциклоалкил, который необязательно замещен 1, 2, 3, 4, 5 или 6 заместителями, выбранными из галогена, C₁₋₄ алкила, C₂₋₄ алкенила, C₂₋₄ алкинила, C₁₋₄ галогеналкила, C₁₋₄ гидроксилалкила, C₁₋₄ цианоалкила, Cy¹, CN, NO₂, OR^a, SR^a, C(O)R^b, C(O)NR^cR^d, C(O)OR^a, OC(O)R^b, OC(O)NR^cR^d, NR^cR^d, NR^cC(O)R^b, NR^cC(O)NR^cR^d, NR^cC(O)OR^a, S(O)R^b, S(O)NR^cR^d, S(O)₂R^b, NR^cS(O)₂R^b и S(O)₂NR^cR^d.
21. Соединение по п.20 или его фармацевтически приемлемая соль, где n равно 1.
22. Соединение по п.20 или его фармацевтически приемлемая соль, где n равно 0.
23. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где Z является замещенным по крайней мере одним заместителем, включающим по крайней мере одну CN группу.
24. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где R⁵ представляет собой H, галоген, C₁₋₄ алкил, C₁₋₄ галогеналкил, CN или NR⁹R¹⁰.
25. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где R⁵ представляет собой H.
26. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где R⁶ представляет собой H или C₁₋₄ алкил.
27. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, где R⁶ представляет собой H.
28. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, имеющее формулу



29. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, имеющее формулу IV



IV.

30. Соединение по п.1, выбранное из
- 4-[1-(1-метил-3-пиразол-1-илпропил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-[1-(3-имидазол-1-ил-1-метилпропил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-циклопентил-4-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)пиразол-1-ил]бутиронитрила;
 - 3-циклопентил-3-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
 - 3-циклогексил-3-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
 - 3-циклогексил-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-д]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
 - 4-циклопропил-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-д]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бутаннитрила;
 - 3-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-д]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]циклопропилпропаннитрила;
 - 1-[4-(7Н-пирроло[2,3-д]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]циклопропилацетонитрила;
 - 4-1-[пирролидин-2-илметил]-1Н-пиразол-4-ил-7Н-пирроло[2,3-д]пиримидина;
 - 4-(1-[1-(метилсульфонил)пирролидин-2-ил]метил-1Н-пиразол-4-2-ил)-7Н-пирроло[2,3-д]пиримидина;
 - 3-циклопентил-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-д]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]акрилонитрила;
 - 3-(2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-д]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил)циклопентанкарбонитрила;
 - 3-[3-(гидроксиметил)циклопентил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-д]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
 - 4-(1-бензил-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-[1-(2-нафтилметил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-(1-фенил-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 3-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензонитрила;
 - 4-{1-[1-метилбутил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-метил-3-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензонитрила;
 - 4-[1-(3,5-диметоксибензил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-[1-(1-фенилэтил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-[1-(циклогексилметил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 3-{[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]метил}бензонитрила;
 - 2-{[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]метил}бензонитрила;
 - 4-{[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]метил}бензонитрила;
 - 1-фенил-2-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этанона;
 - 4-{1-[(5-метилизоксазол-3-ил)метил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-[1-(тетрагидро-2Н-пиран-2-илметил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-(1-циклогекс-2-ен-1-ил-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-(1-циклогексил-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4'-{[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]метил}бифенил-2-карбонитрила;
 - 4-[1-(2-нитробензил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-{1-[2,6-дихлор-4-(трифторметил)фенил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-[1-(3-нитробензил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - 4-[1-(2-бромбензил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
 - Н-фенил-2-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропанамида;

4-{1-[3-(трифторметокси)бензил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-{1-[2-фтор-5-(трифторметил)бензил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-{1-[3-(трифторметил)бензил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(пиридин-3-илметил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-{1-[1-фенилбутил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
1-фенил-2-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропан-1-она;
4-[1-(2,6-дихлорбензил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(2,6-диметилфенил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
2-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-5-(трифторметил)бензонитрила;
4-[1-(4-бром-3,5,6-трифторпиридин-2-ил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(циклопропилметил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(2,5-диметилфенил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(2-метилфенил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(2-метоксифенил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло [2,3-б]пиридина;
3-{1-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} бензонитрила;
3-хлор-4-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензонитрила;
4-[1-(1-циклогексилэтил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-фтор-2-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензонитрила;
2-фтор-4-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензонитрила;
3-фтор-4-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензонитрила;
4-(1-{1-[3-(трифторметил)фенил]этил}-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(3,5-диметилфенил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензонитрила;
{4-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]фенил}ацетонитрила;
4-[1-(1-фенилпропил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-(1-{1-[4-(метилсульфонил)фенил]этил}-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-{1-[1-(3-фтор-4-метоксифенил)этил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина,
4-(1-{1-[2-(трифторметил)фенил]этил}-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-(1-{1-[3,5-бис(трифторметил)фенил]этил}-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-{1-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} бензонитрила;
4-{1-[4-нитро-2-(трифторметил)фенил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
3-метил-4-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензонитрила;
4-[1-(2-хлорфенил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
3-бром-4-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензонитрила;
этил 4-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бензоата;
4-{1-[2-хлор-6-нитро-4-(трифторметил)фенил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-(1-{1-[4-(трифторметил)фенил]этил}-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(2,3-дигидро-1Н-инден-1-ил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(1,2,3,4-тетрагидронафталин-1-ил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-(1-{1-[2-хлор-5-(трифторметил)фенил]этил}-1Н-пиразол-4-ил)-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-{1-[1-(2,4-дихлор-5-фторфенил)этил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(1-циклопентилэтил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(1-метил-3-фенилпропил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
4-[1-(1-циклобутилэтил)-1Н-пиразол-4-ил]-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
[2-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-5-(трифторметил)фенил]ацетонитрила;
[5-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-2-(трифторметил)фенил]ацетонитрила;
4-{1-[4-фенилбут-3-ен-1-ил]-1Н-пиразол-4-ил}-1Н-пирроло[2,3-б]пиридина;
[3-хлор-2-[4-(1Н-пирроло[2,3-б]пиридин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-5-(трифторметил)фенил]ацетонитрила;

5-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]-2-(трифторметил)бензонитрила;
4-{1-[2-хлор-4-(трифторметил)фенил]-1H-пиразол-4-ил}-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
4-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]-2-(трифторметил)бензонитрила;
2-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]бензонитрила;
3-хлор-2-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]бензонитрила;
4-амино-5,6-дифтор-2-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]изофталонитрила;
1-{[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]метил} циклопропанкарбонитрила;
5-бром-2-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]бензонитрила;
3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]-4-(трифторметил)бензонитрила;
2-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]-3-(трифторметил)бензонитрила;
3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]-4-(трифторметил)бензамида;
3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]циклогексанона;
2-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]циклогексанола;
4-(1-{[1-(метилсульфонил)пиперидин-4-ил]метил}-1H-пиразол-4-ил)-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
2-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]циклогексанкарбонитрила;
4-{1-[2-(трифторметил)фенил]-1H-пиразол-4-ил}-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
4-[1-(2,6-дихлорфенил)-1H-пиразол-4-ил]-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
(4-{[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]метил} циклогексил)метанола;
4-[1-(тетрагидрофуран-2-илметил)-1H-пиразол-4-ил]-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
4-[1-(1-циклопентилпропил)-1H-пиразол-4-ил]-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
4-[1-(тетрагидрофуран-3-илметил)-1H-пиразол-4-ил]-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
2-хлор-3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]бензонитрила;
3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]-3-(1,3-тиазол-5-ил)пропаннитрила;
3-(1-метил-1H-имидазол-5-ил)-3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]-3-(3-тиенил)пропаннитрила;
{1-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]циклопентил} ацетонитрила;
4-хлор-3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]бензонитрила;
4-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]фталонитрила;
3-метил-4-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]бензальдегида;
4-[1-(2-метил-4-нитрофенил)-1H-пиразол-4-ил]-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]циклопентанона;
4-[1-(3-фурилметил)-1H-пиразол-4-ил]-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
4-[1-(2-фурилметил)-1H-пиразол-4-ил]-1H-пирроло[2,3-b]пиридина;
3-{2-циано-1-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]этил} бензонитрила;
{3-метил-4-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]фенил} метанола;
3-(1-бензофуран-2-ил)-3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(3-фурил)-3-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
{3-метил-4-[4-(1H-пирроло[2,3-b]пиридин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]фенил} ацетонитрила;
4-метил-3-[4-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]бензонитрила;
4-[1-(1-циклопентилпропил)-1H-пиразол-4-ил]-7H-пирроло[2,3-d]пиримидина;
{1-[4-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]циклопентил} ацетонитрила;
3-{2-циано-1-[4-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]этил} бензонитрила;
3-[4-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]-3-(3-тиенил)пропаннитрила;
4-хлор-3-[4-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]бензонитрила;
3-(3-фурил)-3-[4-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-{1-[4-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]циклопентил} пропаннитрила;
{1-[4-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]циклогексил} ацетонитрила;
{3-метил-4-[4-(7H-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1H-пиразол-1-ил]фенил} метанола;
или его фармацевтически приемлемая соль.

31. Соединение по п.1, выбранное из

3-[2-бром-5-(цианометокси)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
4-(цианометокси)-2-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}бензонитрила;
3-пиримидин-5-ил-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(2-бромпиридин-4-ил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
4-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}пиридин-2-карбонитрила;
3-(5-метоксипиридин-3-ил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(3-хлорфенил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-3-[3-(трифторметил)фенил]пропаннитрила;
3-(3-феноксифенил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-3-[3-(трифторметокси)фенил]пропаннитрила;
метил 3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}бензоата;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}бензойной кислоты;
3-[3-(1Н-пиразол-4-ил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(3-аминофенил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
N-(3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}фенил)ацетамида;
N-(3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}фенил)метансульфонамида;
4-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}тиофен-2-карбонитрила;
5-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}тиофен-2-карбонитрила;
3-[3-(морфолин-4-илкарбонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
N-(2-аминоэтил)-3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}бензамида;
3-(5-формил-3-тиенил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-метилбензамида;
2-циано-N-(3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}фенил)ацетамида;
N-(3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}фенил)никотинамида;
N-(3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}фенил)-N'-изопропилмочевины;
изопропил (3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}фенил)карбамата;
3-(5-фенилпиридин-3-ил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(3,3'-бипиридин-5-ил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(5-пиримидин-5-илпиридин-3-ил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[5-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(5-этинилпиридин-3-ил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила; или его фармацевтически приемлемая соль.

32. Соединение по п. 1, выбранное из
3-[5-(фенилтио)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(2-бром-1,3-тиазол-5-ил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(5-морфолин-4-илпиридин-3-ил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(3-пиридин-3-илфенил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[5-(фенилсульфинил)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[5-(фенилсульфонил)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-3-[5-(1,3-тиазол-2-илтио)пиридин-3-ил]пропаннитрила;
3-[5-(этилтио)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
4-{1-[1-метил-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-ил)этил]-1Н-пиразол-4-ил}-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
1-фенил-2-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропан-1-она;
3-[5-(этилсульфинил)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[5-(этилсульфонил)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[5-(циклогексилтио)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
1-фенил-2-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропан-1-ола;
3-[3-(этилтио)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[3-(этилсульфинил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[3-(этилсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[5-(циклогексилсульфонил)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[5-(циклогексилсульфинил)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
4-[1-(1-метил-2-фенилэтил)-1Н-пиразол-4-ил]-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-{1-[1-метил-2-(3-тиенил)этил]-1Н-пиразол-4-ил}-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
3-{1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}бензонитрила;
4-{1-[2-(1Н-имидазол-1-ил)-1-метилэтил]-1Н-пиразол-4-ил}-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-{1-[1-метил-2-(3-метил-1,2,4-оксадиазол-5-ил)этил]-1Н-пиразол-4-ил}-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
3-[3-(метилсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-(3-пиридин-4-илфенил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[5-(изопропилтио)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[5-(изопропилсульфинил)пиридин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

N-(3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} фенил)бензамида;
N-(3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} фенил)-4-(трифторметил)бензамида;
N-(3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} фенил)-N'-фенилмочевины;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-[4-(трифторметил)фенил]бензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(4-метилфенил) бензамида;
N-(4-цианофенил)-3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} бензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-2-нафтилбензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-1-нафтилбензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N,N-диметилбензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-пиридин-3-илбензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-метил-N-фенилбензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-циклогексилбензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(4-феноксифенил)бензамида;
N-(3-цианофенил)-3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} бензамида;
N-бифенил-4-ил-3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} бензамида;
N-(4-хлорфенил)-3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} бензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(3,4-диметилфенил)бензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(3-метоксифенил)бензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(4-метоксифенил)бензамида;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-изоксазол-3-илбензамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-метил-N-фенилбензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-пропилбензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-фенилбензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-2-нафтилбензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-циклопропилбензолсульфонамида;

3-[3-(пиперидин-1-илсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

3-[3-(морфолин-4-илсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(4-метилфенил)бензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(3,4-диметилфенил)бензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(3-метоксифенил)бензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(4-метоксифенил)бензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(3,5-диметоксифенил)бензамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-[4-(диметиламино)фенил]бензамида;

3-[3-(бензилсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

3-[3-(бензилтио)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

4-[(3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} фенил)сульфонил]метил} бензонитрила;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-метилбензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-1-нафтилбензолсульфонамида;

N-бифенил-4-ил-3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} бензолсульфонамида;

3-[3-(бензилокси)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-циклогексилбензолсульфонамида;

3-[3-(3,4-дигидроизохинолин-2(1Н)-илсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(2-метоксиэтил)бензолсульфонамида;

3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N,N-диэтилбензолсульфонамида;

3-{3-[(4-этилпиперазин-1-ил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

N-1,3-бензодиоксол-5-ил-3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} бензолсульфонамида;

3-{3-[(2,6-диметилморфолин-4-ил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

3-{3-[(4-оксопиперидин-1-ил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

3-[3-(изопропилсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;

3-{3-[(циклогексилметил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[3-(октагидроизохинолин-2(1Н)-илсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(2-фенилэтил)бензолсульфонамида;
цис-4-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]циклогексилацетонитрила;
3-цис-4-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]циклогексилпропаннитрила;
цис-4-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]циклогексанкарбонитрила;
3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]циклогексилацетонитрила;
5-({цис-4-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]циклогексил}тио)-1Н-1,2,4-триазол-3-амина;
[цис-4-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-1-(1Н-1,2,4-триазол-1-ил)циклогексил]ацетонитрила;
и его фармацевтически приемлемой соли.
33. Соединение по п.1, выбранное из
3-[3-(пиперазин-1-илсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-3-[3-(тиоморфолин-4-илсульфонил)фенил]пропаннитрила;
3-{3-[(4-гидроксипиперидин-1-ил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[3-(изобутилсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]-3-{3-[(тетрагидро-2Н-пиран-4-илметил)сульфонил]фенил}пропаннитрила;
3-{3-[(3-фурилметил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-{3-[(1,1-диоксидотиоморфолин-4-ил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-{3-[(пиридин-4-илметил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
3-{3-гидрокси-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропил}-N,N-диметилбензолсульфонамида;
3-{1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бут-3-ен-1-ил}бензонитрила;
4-{1-[1-(3-бромфенил)бут-3-ен-1-ил]-1Н-пиразол-4-ил}-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
3-{4,4-дифтор-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бут-3-ен-1-ил}бензонитрила;
4-(1-{4,4-дифтор-1-[3-(морфолин-4-илсульфонил)фенил]бут-3-ен-1-ил}-1Н-пиразол-4-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-(1-{1-[3-(этилсульфонил)фенил]-4,4-дифторбут-3-ен-1-ил}-1Н-пиразол-4-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-(1-{1-[3-(бензилокси)фенил]-4,4-дифторбут-3-ен-1-ил}-1Н-пиразол-4-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-(1-{4,4-дифтор-1-[3-(метилсульфонил)фенил]бут-3-ен-1-ил}-1Н-пиразол-4-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
3-{[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]метил}бензонитрила;
3-{1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бутил}бензонитрила;
4-(1-{1-[3-(этилсульфонил)фенил]-4,4-дифторбутил}-1Н-пиразол-4-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-[1-(1-циклопентилбут-3-ен-1-ил)-1Н-пиразол-4-ил]-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-[1-(1-циклопентилбутил)-1Н-пиразол-4-ил]-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-[1-(1-циклопентил-4,4-дифторбут-3-ен-1-ил)-1Н-пиразол-4-ил]-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-[1-[4,4-дифтор-1-(тетрагидрофуран-3-ил)бут-3-ен-1-ил]-1Н-пиразол]-4-ил-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;

- 4-[1-(1-циклопропил-4,4-дифторбут-3-ен-1-ил)-1Н-пиразол-4-ил]-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-[1-(1-циклопентил-4,4-дифторбутил)-1Н-пиразол-4-ил]-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
3-(1-метилциклопентил)-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
1-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} циклопропанкарбонитрила;
3-[1-(метилсульфонил)пирролидин-3-ил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрила;
4-{1-[2,2,2-трифтор-1-(1Н-имидазол-2-илметил)этил]-1Н-пиразол-4-ил}-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-(1-(1R)-2,2,2-трифтор-1-[(4-метил-1,3-тиазол-2-ил)метил]этил-1Н-пиразол-4-ил)-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидина;
4-{1-[1-(5-бромпиридин-3-ил)-4,4-дифторбут-3-ен-1-ил]-1Н-пиразол-4-ил}-7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин;
5-{4,4-дифтор-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]бут-3-ен-1-ил} никотинонитрил;
3-[3-(пирролидин-1-илсульфонил)фенил]-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил;
N-бензил-3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-метилбензолсульфонамид;
3-[[3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил} фенил]сульфонил]метил} бензонитрил;
3-{3-[(2-нафтилметил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил;
3-{3-[(1-фенилэтил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(2-морфолин-4-илэтил)бензолсульфонамид;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-[(1S)-1-фенилэтил]бензолсульфонамид;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-фенилбензамид;
3-{2-циано-1-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]этил}-N-(тетрагидрофуран-2-илметил)бензолсульфонамид;
3-{3-[(циклопропилметил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил;
3-{3-[(4-метилпиперазин-1-ил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил; и
3-{3-[(1-оксидотиоморфолин-4-ил)сульфонил]фенил}-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил;
или его фармацевтически приемлемая соль.
34. Соединение, которое представляет собой 3-циклопентил-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил, или его фармацевтически приемлемая соль.
35. Соединение, которое представляет собой (R)-3-циклопентил-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил, или его фармацевтически приемлемая соль.
36. Соединение, которое представляет собой 3-циклопропил-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)пиразол-1-ил]пропионитрил, или его фармацевтически приемлемая соль.

Против действия на территории Российской Федерации евразийского патента ЕА № 019504 в соответствии с пунктом 1 статьи 13 Евразийской Патентной Конвенции от 09.09.1994, ратифицированной Российской Федерацией Федеральным законом от 01.06.1995 № 85-ФЗ и вступившей в силу для Российской Федерации с 27.09.1995 (далее – Конвенция), и пункта 1 Правила 54 Патентной инструкции к Евразийской патентной конвенции,

утверждённой Административным советом Евразийской патентной организации на втором (первом очередном) заседании 01.12.1995 с изменениями и дополнениями, утвержденными на девятнадцатом (четырнадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 13-15 ноября 2007 г., двадцать первом (шестом внеочередном) заседании Административного совета ЕАПО 30-31 марта 2009 г., двадцать третьем (семнадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 8-10 ноября 2010 г., двадцать шестом (девятнадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 20-22 ноября 2012 г., двадцать седьмом (двадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 6-8 ноября 2013 г., двадцать восьмом (двадцать первом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 11-13 ноября 2014 г., тридцать втором (двадцать третьем очередном) заседании Административного совета ЕАПО 1-3 ноября 2016 г., тридцать третьем (двадцать четвертом очередном) заседании 6-7 сентября 2017 г., тридцать четвертом (двадцать пятом очередном) заседании 22 – 23 октября 2018 г., тридцать шестом (двадцать седьмом очередном) заседании 10 – 11 сентября 2020 г. (далее – действующая Патентная инструкция), тридцать шестом (двадцать седьмом очередном) заседании 10 – 11 сентября 2020 г., тридцать седьмом (десятым внеочередном) заседании 12 апреля 2021 г., сороковым (двенадцатым внеочередном) заседании 11 – 12 апреля 2022 г., сорок первом (двадцать девятым очередном) заседании 20 – 21 сентября 2022 г., сорок третьем (тридцатым очередном) заседании 5 – 7 декабря 2023 г. поступило возражение, мотивированное несоответствием группы изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35, охарактеризованным в приведенной выше формуле оспариваемого патента, условиям патентоспособности «промышленная применимость», «изобретательский уровень» и «новизна».

К возражению, кроме копии оспариваемого патента, приложены копии следующих материалов:

- книга Х. Гюнтер. «Введение в курс спектроскопии ЯМР», Москва «Мир», 1984, с.1, 44-45, 47-48 (далее – [1]);

- патентный документ RU 2435769 С2, дата публикации 10.12.2011 (далее – [2]);

- патентный документ ЕА № 200001203 А1, дата публикации 25.06.2001 (далее – [3]).

Суть доводов возражения в отношении несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость» сводится к следующему.

По мнению лица, подавшего возражение, изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость», поскольку описание к оспариваемому патенту не содержит сведений о средствах и методах осуществления группы изобретений в том виде, как они охарактеризованы в формуле, а также достоверных данных, подтверждающих реализацию назначения группы изобретений.

При этом в возражении отмечено, что согласно с.1 описания «изобретение относится к гетероарилзамещенным пирроло [2,3-b]пиридинам и гетероарилзамещенным пирроло[2,3-b]пиримидинам, которые модулируют активность Янус-киназы и могут использоваться для лечения заболеваний, связанных с активностью Янус-киназ, включая, например, заболевания связанные с иммунной системой, кожные заболевания, миелоидные пролиферативные заболевания, рак и другие заболевания».

По мнению лица, подавшего возражение, в описании к оспариваемому патенту, а также в уровне техники до даты приоритета изобретений по оспариваемому патенту, не содержится достаточное количество сведений, использование которых позволяет осуществить изобретения в том виде, как они охарактеризованы в формуле.

Кроме того, в возражении внимание акцентировано на примерах 74 и 67 описания к оспариваемому патенту.

При этом в отношении сведений, приведенных в примере 74 описания, в возражении сделан вывод о том, что в спектре один сигнал (N-H) отсутствует, сигнал по двойной связи превратился в дублет (d), хотя должен являться синглетом (s), а также необъясним значительный химический сдвиг винилового протона в слабое поле, где протон при 5,21 м.д. появляется при 5,82 м.д.

Лицо, подавшее возражение, в поддержку своих доводов приводит источник информации [1] (с. 44-46), из которого известно, что причиной появления мультиплетов является спин-спиновое взаимодействие.

В отношении сведений, раскрытых в примере 67 описания, в возражении сделан вывод о том, что спектр ^1H ЯМР не соответствует структуре полученного соединения, поскольку данные ЯМР конечного продукта примера 67 (стадия 3) и защищенного с помощью SEM промежуточного соединения, использованного для получения продукта (стадия 2) различны. В частности, в возражении отмечено, что в спектре ^1H ЯМР защищенного с помощью SEM промежуточного соединения (стадия 2), протоны пиразола должны давать два отдельных пика, сигнал при 8,32 (с, 2H) должен исходить от протонов пиразольного фрагмента, но он не может выходить в виде одиночного синглета, поскольку молекула несимметрична, т.к. в положениях 1 и 4 пиразольного фрагмента присутствуют заместители и протоны пиразольного фрагмента неэквивалентны.

Кроме того, в возражении отмечено, что окружение протонов пиразольного фрагмента такое же, как и для SEM промежуточного соединения и что введение защитной группы в положение 1, столь удаленное от пиразола, не может повлиять на протоны пиразола таким образом, что они смещаются навстречу друг другу и сливаются в один синглет.

В возражении сделан вывод о том, что в примере 67 описания отсутствует подтверждение того, что исходная конфигурация хирального центра сохранилась в условиях деблокирования (удаления SEM-группы).

Суть доводов возражения в отношении несоответствия изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «новизна» сводится к следующему.

Из патентного документа [3] известны соединения из группы пирроло[2,3-d]пиримидина, проявляющие свойства ингибиторов Янус-киназ (JAK).

При этом из патентного документа [2] (независимый пункт 25) известен 4-(1-метил-1H-пиразол-4-ил)-1H-пирроло[2,3-b]пиридин (соединение 111). Соединение 111 «входит в химическое пространство, описываемое формулой Маркуша» по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента.

По мнению лица, подавшего возражение, близкими по молекулярной структуре к известному соединению 111, являются соединения по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента, а также входящее в объем независимого пункта 1 формулы оспариваемого патента соединение по примеру 60 (с.42 описания).

Между тем, по мнению лица, подавшего возражение, наличие в пиразольном кольце соединений по оспариваемому патенту алкильного заместителя с концевой нитрильной или амидной группой, который делает их отличными от известных соединений, является простой модификацией известного соединения с метильной группой в том же положении, осуществить которую не представляет сложности для специалиста в области органического синтеза.

Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что соединения по независимым пунктам 1, 34 и 35 не соответствуют условию патентоспособности «новизна».

Суть доводов возражения в отношении несоответствия изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «изобретательский уровень» сводится к следующему.

По мнению лица, подавшего возражение, в соответствии с описанием к оспариваемому патенту, техническим результатом можно считать способность предложенных соединений воздействовать на Янус-киназой (JAK) и их эффективное использование для лечения заболеваний, связанных с активностью этого фермента.

Из патентного документа [2] известны соединения из группы пирроло[2,3-d]пиримидина, проявляющие свойства ингибиторов Янус-киназ (JAK). В частности, соединение 111 (независимый пункт 25).

Поскольку из патентного документа [2] известно, что аналогичные соединения проявляют активность в отношении Янус-киназ, простая модификация (декорация) метильной группы соединения 111 не добавляет соединениям по оспариваемому патенту каких-либо новых неожиданных свойств.

Из патентного документа [3] известны пирроло[2,3-d]пиримидины, описываемые общей структурной формулой, проявляющие свойства ингибиторов Янус-киназы JAK-3.

Однако, по мнению лица, подавшего возражение, величина ингибирующей активности в отношении JAK $IC_{50} < 10$ мкМ следует рассматривать как установленный авторами изобретения критерии приемлемости, позволяющие отнести соединения к активным, но никак не технический результат, реально достигнутый в отношении конкретных соединений. При этом никакого нового свойства или улучшения характеристик известного свойства объекта с учетом сведений, раскрытых в патентных документах [2] и [3], проявляющегося при использовании изобретения, в описании к оспариваемому патенту не содержится.

Патентообладателем, ознакомленным с материалами возражения в установленном порядке, в корреспонденции, поступившей 27.05.2024, представлен отзыв по мотивам возражения.

К отзыву приложены копии следующих материалов:

- спектры ЯМР соединений по примерам 74 и 68 (далее – [4]);
- Jacobsen et al., NMR Data Interpretation Explained: Understanding 1D and 2D NMR Spectra of Organic Compounds and Natural Products, John Wiley & Sons:Canada, 2017, с. 74-75 (далее – [5]);
- Pretsch, et al., Structure Determination of Organic Compounds, Tables of Spectral Data, Springer, 4th ed, с. 165 (далее – [6]);
- Abraham, et al., "1H chemical shifts in NMR: Part 23, the effect of dimethyl sulphoxide versus chloroform solvent on 1H chemical shifts," Magnetic Resonance in Chemistry, 2006, 44, с. 591-509 (далее – [7]);
- Muchowski and Solas, Journal of Organic Chemistry, 49 (1), с. 203-205 (далее – [8]);
- Декларация доктора Стейси Шепард от 22.11.2022. на 100 л. (далее – [9]);
- постановление Президиума Суда по интеллектуальным правам по делу СИП-730/2022 от 18.12.2023 (далее – [10]).

В отношении соответствия условию патентоспособности «промышленная применимость» изобретений по оспариваемому патенту, патентообладатель отмечает следующее.

В отношении назначения изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента в описании к оспариваемому патенту указано, что изобретения относятся к гетероарилзамещенным пирроло[2,3-b]пиридинам и гетероарилзамещенным пирроло[2,3-b]пиримидинам, которые модулируют активность Янус-киназы и могут использоваться для лечения заболеваний, связанных с активностью Янус-киназ, включая, например, заболевания, связанные с иммунной системой, кожные заболевания,

миелоидные пролиферативные заболевания, рак и другие заболевания», а также в описании указано, что изобретения относятся к соединениям, которые модулируют активность одной или нескольких из JAK и могут использоваться, например, для лечения заболеваний, связанных с экспрессией или активностью JAK.

По мнению патентообладателя, в описании к оспариваемому патенту приведены сведения о средствах и методах, использование которых позволяет осуществить изобретения, в том виде, как они охарактеризованы в формуле (примеры 1-745, таблицы 1-14).

Кроме того, отмечено, что в описании к оспариваемому патенту, в соответствии с требованиями Евразийского патентного законодательства подтверждена реализация указанного назначения.

Дополнительно, патентообладатель представляет декларацию доктора Стейси Шепард [9], кандидата химических наук, автора изобретения по оспариваемому патенту, в которой приведены численные данные активности (IC_{50}) для соединений согласно примерам в патенте, на которые авторы ссылаются в описании оспариваемого патента (пример А).

В отношении 1H ЯМР спектров соединений, полученных в примерах 74 и 67 описания к оспариваемому патенту, патентообладатель отмечает следующее.

Патентообладатель утверждает, что спектр соединения 1H ЯМР из примера 74 (стадия 3) в действительности соответствует структуре молекулы из примера 74 (см. табл. 1, представленную в отзыве), поскольку все различия, отмеченные лицом, подавшим возражение, легко объясняются понятными принципами ЯМР-спектроскопии, различиями в ЯМР-растворителе ($CDCl_3$ против $DMCO-d_6$), использованном на стадиях 2 и 3 примера 74, а также напряженностью поля ЯМР, использованной на момент подачи заявки.

При этом отмечено, что, несмотря на то, что в оспариваемом патенте не указан пик в спектре ^1H ЯМР из примера 74 (стадия 3), соответствующий группе N-H, это не означает, что в молекуле отсутствовала группа N-H.

В уровне техники (см. источник информации [5]) хорошо известно, что присутствие воды в ЯМР-образце расширяет пики протонов NH из-за обмена между соединением NH и водой в ЯМР-растворителе. Специалисту в данной области будет понятно, что протоны NH склонны к такому типу уширения в растворителе ДМСО- d_6 . Когда уширение пика сильное, то сигнал от пика протона NH может быть неотличим от шума вдоль базовой линии, как это было в данном случае.

Кроме того, патентообладатель категорически не согласен с тем, что появление дублета при 5,82 м.д. для винила Н является каким-либо образом "необъяснимым". Дублет возникает из-за аллильного взаимодействия, возникающего из-за протона C-H на циклопентильном кольце. Этот тип аллильного взаимодействия хорошо документирован (см. источник информации [6]).

Кроме того, патентообладатель отмечает, что ЯМР-растворитель (CDCl_3) для промежуточного продукта, защищенного SEM (стадия 2), и растворитель ДМСО- d_6 для конечного продукта (стадия 3) и напряженность поля (МГц) ЯМР могут влиять на способность ЯМР-спектрометра различать виниловый протонный резонанс в виде дублета, в отличие от синглета. Это особенно актуально из-за небольшой константы аллильного взаимодействия.

Вместе с тем, движение пика винильного протона от 5,21 м.д. в защищенном с помощью SEM промежуточном продукте до 5,82 м.д. в конечном продукте также не является "необъяснимым". Это связано с тем, что спектр ^1H ЯМР защищенного с помощью SEM промежуточного соединения был получен в CDCl_3 , а спектр ^1H ЯМР конечного продукта был получен в ДМСО- d_6 .

Патентообладатель утверждает, что спектр ^1H ЯМР из примера 67 (стадия 2) действительно соответствует структуре промежуточного защищенного с помощью SEM соединения (см. таблицу 2 в отзыве) поскольку все различия, отмеченные в возражении, легко можно отнести на счет ЯМР-растворителя (CDCl_3 для стадии 2 против с DMCO-d_6 для стадии 3) и напряженности поля (300 МГц для стадии 2 и 400 МГц для стадии 3) ЯМР, использованной в эксперименте на момент подачи заявки.

В то время как протоны пиразола неэквивалентны и должны давать два отдельных пика, это является простым примером совпадающих резонансов - т.е. пики случайно оказываются настолько близко друг к другу, что в спектре кажутся синглетом, хотя на самом деле это два пика, наложенных друг на друга. Кроме того, полярность ЯМР-растворителя сама по себе может вызывать и, по мнению патентообладателя, действительно вызывает химические сдвиги в спектрах ^1H ЯМР (см. источник информации [7]).

Патентообладатель утверждает, что из материалов патента ясно, что продукт, полученный в примере 67, представляет собой свободное основание руксолитиниба. Специалист в данной области поймет, что стадия снятия защиты представляет собой двухэтапный процесс с использованием трифторуксусной кислоты (TFA) для первого расщепления этил(трисилилметилового) фрагмента, а затем второй этап для удаления оставшегося фрагмента $-\text{CH}_2\text{OH}$ с использованием диэтиламинамина для поглощения образовавшегося формальдегида путем его удаления, а также нейтрализации кислоты TFA. Этот тип двухэтапного процесса снятия защиты был хорошо известен на дату подачи заявки (см. источник информации [8]).

В подтверждение своей позиции патентообладатель приводит спектр [4].

Кроме того, по мнению патентообладателя, выходы и масс-спектрометрия дополнительно подтверждают, что свободное основание руксолитиниба и его энантиомера действительно было выделено.

В отношении соответствия условию патентоспособности «новизна» изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента, патентообладатель отмечает следующее.

По мнению патентообладателя, соединение 111, известное из патентного документа [2] не подпадает под общую структурную формулу соединения по пункту 1 формулы оспариваемого патента.

Кроме того, из патентного документа [2] не известен способ получения соединений по оспариваемому патенту.

В отношении соответствия условию патентоспособности «изобретательский уровень» изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента, патентообладатель отмечает следующее.

Техническим результатом изобретений является расширение арсенала средств, то есть получение впервые новых соединений, которые модулируют активность JAK и могут быть применены для лечения заболеваний, связанных с активностью Янус-киназ.

Патентный документ [2] может быть противопоставлен только для оценки новизны, но не изобретательского уровня, поскольку он был опубликован позднее даты приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту.

Вместе с тем, отличие соединений известных из патентного документа [3] от соединений по пункту 1 формулы оспариваемого патента состоит по меньшей мере в том, что R1 представляет собой N, замещенный двумя группами R4 и R5, или R1 представляет собой O или S(O)_q замещенный одной группой, тогда как в соединении по оспариваемому патенту группа пирроло[2,3-d]пиримидина замещена через связь ароматическим пятичленным кольцом (в атоме углерода кольца), замещенным в свою

очередь группой $-(Y)_n-Z$, где Z выбрана из арила, циклоалкила, гетероарила или гетероциклоалкила.

Поскольку все соединения известные из патентного документа [3] имеют гетероатом (N, O или $S(O)_q$), присоединенный в 4-положении пирролопиридинового каркаса, то по мнению патентообладателя, в известном техническом решении нет ничего, что могло бы предполагать присоединение вместо этого 5-членного ароматического кольца через углеродный атом, не говоря уже о дальнейшем замещении 5-членного ароматического кольца специфическим заместителем $-(Y)_n-Z$.

Таким образом, в отзыве сделан вывод о том, что соединения, известные из патентного документа [3] имеют структуру, которая существенно отличается от структуры соединений по оспариваемому патенту, и для специалиста соединение по пункту 1 формулы, а также соединения по пунктам 34, 35 и 36 формулы оспариваемого патента никак не следуют из патентного документа [3]. Более того, не следует, что какая-либо модификация известного соединения приведет к сохранению биологической активности.

На заседании коллегии, состоявшемся 08.07.2024 (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии), лицом, подавшим возражение, было представлено письменное мнение в отношении позиции патентообладателя, изложенной в отзыве.

При этом лицо, подавшее возражение, в пояснениях отмечает, что не является достаточно убедительным мнение о том, что отсутствие сигнала N-H в спектре не доказывает отсутствие N-H группы в молекуле соединения, в данном случае N-H протон не является настолько кислым, чтобы бесследно пропасть, обменявшись на дейтерий.

В отношении довода патентообладателя о том, что присутствие воды в ЯМР-образце расширяет пики протонов N-H из-за обмена между соединением NH и водой в ЯМР-растворителе в пояснениях отмечено, что

специалисту очевидно, что данный эффект проявляется лишь тогда, когда протоны NH являются достаточно кислыми.

Также в пояснениях анализируется спектр [4], представленный с отзывом.

Кроме того, лицо, подавшее возражение, повторно приводит доводы о спин-спиновом взаимодействии, которые изложены в возражении. Лицо, подавшее возражение, также приводит свою позицию в отношении рабочей частоты спектрометра. В подтверждение своих доводов патентообладатель приводит статью Н.Э. Нифантьев, П.В. Ивченко «Практический курс спектроскопии ядерного магнитного резонанса», Москва 2006, с. 27-29 (далее – [11]).

В отношении несоответствия группы изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента в пояснениях отмечено, что специалисту в данной области техники очевидно, что есть базовый фармакофор замещенного пирроло[2,3-d]пиримидина, обеспечивающий биологическую активность, а есть заместители, которые лишь влияют на те или иные физико-химические свойства. Учитывая известность из предшествующего уровня техники [3] фармакофора в качестве ингибитора/модулятора JAK, технический результат в виде модулирования (ингибирования) активности JAK без указания конкретных величин констант ингибирования не создает необходимого изобретательского уровня для всей группы изобретений. Сама по себе модификация известного фармакофора новыми заместителями, не ведущая к изменению его известных свойств, не обеспечивает изобретательского уровня.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, отличительные признаки изобретений по оспариваемому патенту следует признать несущественными, а сущность технического решения не отличающейся от аналога, известного из патентного документа [3].

На заседании коллегии, состоявшемся 06.08.2024, лицом, подавшим возражение, было представлено ходатайство об отклонении доводов возражения, касающихся оспаривания новизны группы изобретений (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии).

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

С учетом даты подачи (12.12.2006) заявки, на основании которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности группы изобретений по указанному патенту включает упомянутую Конвенцию и Патентную инструкцию к Евразийской патентной конвенции, утвержденную Административным советом Евразийской патентной организации на втором (первом очередном) заседании 1 декабря 1995 г. с изменениями и дополнениями, утвержденными на шестом (четвертом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 25-26 ноября 1997 года, одиннадцатом (восьмом очередном) заседании 15-19 октября 2001 года, четырнадцатом (десятом очередном) заседании 17-21 ноября 2003 года, семнадцатом (двенадцатом очередном) заседании 14-18 ноября 2005 года (далее – Патентная инструкция).

В соответствии со статьей 6 Конвенции Евразийское ведомство выдает евразийский патент на изобретение, которое является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно статье 10 Конвенции объем правовой охраны, предоставляемой евразийским патентом, определяется формулой изобретения.

Согласно статье 13 пункта 1 Конвенции любой спор, касающийся действительности евразийского патента в конкретном Договаривающемся государстве разрешается национальными судами или другими компетентными органами этого государства на основании настоящей Конвенции и Патентной инструкции. Решение имеет силу лишь на

территории Договаривающегося государства.

Согласно правилу 54 Патентной инструкции, евразийский патент в соответствии со статьей 13 Конвенции с учетом правила 52 Инструкции может быть признан недействительным на территории Договаривающегося государства полностью или частично в течение всего срока его действия, в случаях:

неправомерной выдачи евразийского патента вследствие несоответствия охраняемого им изобретения условиям патентоспособности, установленным Конвенцией и Инструкцией;

наличия в формуле изобретения признаков, отсутствовавших в первоначальных материалах евразийской заявки;

неправильного указания в евразийском патенте изобретателя или патентовладельца.

Согласно правилу 3 (1) Патентной инструкции в соответствии со статьей 6 Конвенции евразийский патент выдается на изобретение, которое является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Изобретение признается новым, если оно не является частью предшествующего уровня техники.

Объекты, являющиеся частью предшествующего уровня техники, для определения новизны изобретения могут учитываться лишь отдельно.

Предшествующий уровень техники включает все сведения, ставшие общедоступными в мире до даты подачи евразийской заявки, а если испрашен приоритет, - до даты ее приоритета.

Изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста очевидным образом не следует из предшествующего уровня техники.

Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении

и других областях человеческой деятельности.

Согласно правилу 71(1) Инструкции, заявитель в отношении международной заявки, в которой указаны Договаривающиеся государства для целей получения евразийского патента, должен до истечения тридцати одного месяца с даты приоритета, указанной в статье 2(xi) Договора о патентной кооперации, представить в Евразийское ведомство:

заверенную в соответствующем получающем ведомстве копию международной заявки, если рассылка этой международной заявки, предусмотренная статьей 20 Договора о патентной кооперации, еще не была осуществлена;

документ об уплате единой процедурной пошлины, предусмотренной статьей 15(2) Конвенции;

перевод международной заявки на русский язык, если международная заявка была подана не на русском языке;

ходатайство о проведении экспертизы по существу, предусмотренное правилом 46 Инструкции.

Согласно правилу 47 (2) Патентной инструкции при проверке соответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость» устанавливается наличие в материалах евразийской заявки указания на назначение заявленного изобретения и наличие в материалах евразийской заявки или источниках информации, относящихся к предшествующему уровню техники, сведений о средствах и методах, использование которых позволяет осуществить изобретение в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения.

При проверке соответствия заявленного изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» определяется, является ли заявленное изобретение очевидным для специалиста, исходя из предшествующего уровня техники.

С целью толкования положений Конвенции и Патентной инструкции

используются Правила составления, подачи и рассмотрения заявок на выдачу евразийских патентов на изобретения, утверждены приказом ЕАПВ от 03 июня 2002 г. № 12, с изменениями, утвержденными приказом ЕАПВ от 11 апреля 2003 г. № 3 (далее – Правила ЕАПВ).

Группе изобретений по оспариваемому патенту представлена правовая охрана в объеме совокупности признаков, содержащихся в приведенной выше формуле.

Независимый пункт 1 формулы оспариваемого патента относится к группе соединений, конкретнее к гетероарилзамещенным пирроло[2,3-d]пиридинам и гетероарилзамещенным пирроло[2,3-d]пиримидинам, охарактеризованным общей структурной формулой I.

Независимый пункт 34 формулы относится к соединению 3-циклопентил-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d][пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил (свободное основание руксолитиниба).

Независимый пункт 35 формулы относятся к энантиомеру соединения, раскрытого в пункте 34, а именно к (R)- 3-циклопентил-3-[4-(7Н-пирроло[2,3-d]пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрилу (МНН – руксолитиниб).

Прежде всего, необходимо отметить, что поскольку лицом, подавшим возражение, были отклонены доводы, касающиеся несоответствия изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» (см. ходатайство в приложении №1 к протоколу заседания коллегии от 06.08.2024), то в настоящем заключении упомянутое основание анализироваться не будет.

Вместе с тем необходимо отметить, на основании Евразийского патентного законодательства, патентный документ [2], который опубликован 10.12.2011, т.е. после всех дат приоритета изобретений по оспариваемому патенту (13.12.2005, 02.06.2006, 10.10.2006, 03.11.2006, 16.11.2006) и после даты подачи соответствующей евразийской заявки (12.12.2006), не входит в уровень техники по смыслу правила 3(1) Инструкции.

Вместе с тем необходимо также отметить, что в соответствии с пояснениями представителя Евразийского патентного ведомства, данными в ходе рассмотрения спора, если рассматривать международную заявку PCT/US2006/019711, на основании которой выдан российский патент [2], то она была опубликована 30.11.2006 под номером WO 2006/127587 после всех дат приоритета евразийской заявки, по которой выдан оспариваемый патент, а поскольку указанная международная заявка не была переведена на евразийскую региональную фазу согласно правилу 71(1) Инструкции, она включается в уровень техники с даты ее публикации, которая является более поздней, чем даты приоритета оспариваемого патента. Соответственно, ни сам патент [2], ни международная заявка, на основании которой он выдан, не является частью предшествующего уровня техники по отношению к оспариваемому патенту согласно правилу 3(1) Инструкции.

Таким образом, патентный документ [2] не может быть привлечен к оценке патентоспособности группы изобретений по оспариваемому патенту.

Анализ доводов сторон, касающихся соответствия группы изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость» показал следующее.

Согласно пункту 5.5. Правил ЕАПВ при проверке соответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость» устанавливаются:

наличие в материалах заявки указания на назначение изобретения (для химических соединений — возможное их применение), то есть возможности выполнения им функции, характеризующей определенную общественную потребность;

наличие в материалах евразийской заявки или источниках информации, относящихся к предшествующему уровню техники, сведений о

средствах и методах, использование которых позволяет осуществить изобретение в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения.

Сведения об этих средствах должны либо содержаться в описании изобретения, либо, если они не раскрыты в описании, то в нем должны содержаться указание на их известность и известность их использования во взаимодействии с другими средствами, характеризующими изобретение, а также ссылка на источник информации, общедоступный на дату приоритета изобретения, в котором эти средства описаны достаточно подробно для их осуществления специалистом.

При анализе изобретения с точки зрения возможности достижения заявленного технического результата устанавливается наличие в формуле изобретения всех признаков, необходимых для обеспечения этого технического результата.

Если у экспертизы возникают сомнения в возможности достижения заявленного технического результата предложенными средствами, заявителю направляется запрос с соответствующими аргументами. Эти аргументы должны быть подкреплены либо ссылками на известные знания (сведения), либо обоснованы экспертизой с помощью приводимых доказательств.

При этом технический результат не должен указывать на какую-то абсолютную значимость изобретения. Ухудшение одних свойств объекта при улучшении других его свойств (или без улучшения) не может служить основанием для вывода о несоответствии изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость».

Экспертиза не может требовать от заявителя представления дополнительных материалов, подтверждающих достижение технического результата, без приведения обоснований их необходимости.

Невозможность достижения одного или нескольких результатов, перечисленных в описании, не означает несоответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость», если какой-либо

технический результат из числа перечисленных в описании изобретения может быть достигнут.

При рассмотрении заявок на вещества следует иметь в виду, что если в заявке не описан способ получения вещества и этот способ нельзя представить на основании сведений о самом веществе, то изобретение нельзя признать осуществимым, а следовательно, промышленно применимым.

В описании к оспариваемому патенту (см., например, с. 1, 5) указано, что изобретения относятся к гетероарилзамещенным пирроло[2,3-d]пиримидинам и гетероарилзамещенным пирроло[2,3-d]пиримидинам, которые модулируют активность Янус-киназ и могут использоваться для лечения заболеваний, связанных с активностью Янус-киназ, включая, например, заболевания, связанные с иммунной системой, кожные заболевания, миелоидные пролиферативные заболевания, рак и другие заболевания (с.1) а также в описании (с.5) указано, что изобретения относятся к соединениям, которые модулируют активность одной или нескольких из JAK и могут использоваться, например, для лечения заболеваний, связанных с экспрессией или активностью JAK.

В описании к оспариваемому патенту приведены сведения о средствах и методах, использование которых позволяет осуществить изобретения, в том виде, как они охарактеризованы в формуле.

Так, в описании к оспариваемому патенту (с. 13-23) приведены общие схемы синтеза соединений по независимому пункту 1 формулы. Кроме того, в описании к оспариваемому патенту (с. 29-149) приведено 745 примеров синтеза 750 конкретных соединений, соответствующих общей структурной формуле по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента, с приведением физико-химических констант, подтверждающих их структуру (см. также таблицы 1-14). Получение соединений по независимым пунктам 34 и 35 формулы оспариваемого патента раскрыто в примере 67 и примере 74 описания к оспариваемому патенту.

В отношении сохранения конфигурации хирального центра в продукте примера 67 следует отметить, что в возражении не приведены обоснования того, что в процессе деблокирования защитной группы может произойти обращение этой конфигурации, что обусловило бы необходимость ее подтверждения у конечного продукта.

Получение фармацевтически приемлемых солей не требует экспериментального подтверждения, поскольку специалист может легко получить соль соединения, имея в распоряжении свободное основание и подходящую кислоту.

Таким образом, представленных в описании к оспариваемому патенту сведений достаточно для того, чтобы специалист в данной области техники мог осуществить изобретение в том виде, как оно охарактеризовано в каждом из независимых пунктов 1, 34, 35 формулы оспариваемого патента.

Что касается реализации указанного назначения, то в описании к оспариваемому патенту приведены сведения о том, что предложенные соединения были протестированы на ингибирующую активность в отношении мишеней JAK, имели значение IC_{50} менее 10 мкМ и обладают ингибирующей активностью в отношении киназ JAK (с. 23, с. 149, пример А). Полученные соединения были также протестированы на пролиферационную активность, обусловленную киназами JAK (пример В).

В отношении соединения руксолитиниб, следует отметить, что в примере 67 также указано, что соединения (3R)- и (3S)-3-Циклопентил-3-[4-(7-[2-(триметилсилил)этокси]метил-7Н-пирроло[2,3- ϵ]-пиримидин-4-ил)-1Н-пиразол-1-ил]пропаннитрил обладают ингибирующей JAK активностью. При этом в описании (с. 45) отдельно отмечено, что было установлено, что конечные продукты (см. стадия 3 пример 67), происходящие из каждого из разделенных энантиомеров, являются активными ингибиторами JAK, однако конечный продукт, полученный из второго пика на препаративной ВЭЖХ, был более активен, чем его энантиомер.

Кроме того, в описании к оспариваемому патенту, а также в предшествующем уровне техники на дату приоритета изобретений по оспариваемому патенту, содержится достаточное количество сведений, использование которых позволяет осуществить изобретение в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения.

Что касается замечаний возражения относительно сведений, раскрытых в примерах 74 и 67 описания к оспариваемому патенту, необходимо отметить следующее.

Доводы лица, подавшего возражение, открывают научную дискуссию в отношении величин единичных химических сдвигов в спектре, однако при отсутствии замечаний в отношении остальных сигналов в спектре и обоснования невозможности протекания описанной в соответствующих примерах химической реакции, не может указывать на то, что соединение не получено (см. последний абзац пункта 5.5. Правил ЕАПВ). Таким образом, упомянутые доводы лица, подавшего возражение, не относятся к оценке соответствия изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость» в соответствии с нормами Евразийского патентного законодательства.

Вместе с тем, следует отметить, что сигнал винильного протона, может быть дублетом, поскольку возможно спин-спиновое взаимодействие (см., например, источник информации [1]) между ним и протоном, находящимся при третичном атоме углерода, опосредованное подвижностью электронов при двойной связи, а сигнал NH может не проявляться вследствие кислотной природы протона и возможности его обмена с протонами окружающей среды.

Кроме того, следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что хорошо известно (см. источник информации [5] (с.75)), что присутствие воды в ЯМР-образце расширяет пики протонов NH из-за обмена между соединением NH и водой в ЯМР-растворителе. Специалисту в данной

области понятно, что протоны NH склонны к такому типу уширения в растворителе ДМСО-d₆. Когда уширение пика сильное, то сигнал от пика протона NH может быть неотличим от шума вдоль базовой линии.

Кроме того, напряженность поля (его разные значения (МГц)) также может иметь значение (см., например, источник информации [11]).

С учетом сведений, раскрытых в статье [6] (с.165), также следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что появление дублета при 5,82 м.д. для винила Н очевидно возникает из-за аллильного взаимодействия, возникающего из-за протона С-Н на циклопентильном кольце.

Кроме того, с учетом сведений раскрытых в статье [7] на изменения химического сдвига протонов в различных соединениях сильно влияет выбор растворителя для ЯМР, причем наблюдаемые сдвиги варьируются от -0,3 м.д. до +4,6 м.д. Следовательно, изменение винилового протона на +0,41 м.д. при переходе от защищенного SEM промежуточного продукта (спектр ¹Н ЯМР получен в CDC1₃) к конечному продукту примера 74 (спектр получен в ДМСО-d₆) не будет неожиданным для специалиста в данной области.

С учетом известности (см. источник информации [8]) особенностей двухэтапного процесса снятия защиты, следует отметить, что продукт, полученный в примере 67, представляет собой свободное основание руксолитиниба.

В описании к оспариваемому патенту (4ый абзац на с. 46) приведены условия проведения ВЭЖХ как для получения продуктов в виде основания, так и в виде трифторацетатных солей. При этом масс-спектр трифторацетатной соли не покажет увеличения молекулярной массы по сравнению с основанием, поскольку соль - нековалентное соединение, трифторацетат – отрицательно заряженный ион, а сигналы в масс-спектре соответствуют положительно заряженным ионам.

Таким образом, спектры, не являющиеся частью описания к оспариваемому патенту, в частности [4] и не входящие в уровень техники не стали предметом анализа в данном рассмотрении.

В соответствии с требованиями Евразийского патентного законодательства в описании к оспариваемому патенту приведены сведения необходимые для признания группы изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента промышленно применимыми, поскольку они могут быть использованы в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других областях человеческой деятельности (правило 3 (1) Патентной инструкции, правило 47 (2) Патентной инструкции).

Что касается декларации [9] от 22.11.2022, то следует отметить, что приведенные сведения в ней не учитывались при формировании сделанного выше вывода.

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия группы изобретений по оспариваемому условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Привлекая с целью толкования положений Патентной инструкции, указанные в правовой базе Правила ЕАПВ, необходимо уточнить, что согласно пункту 5.8 Правил, проверка изобретения на соответствие условию патентоспособности «изобретательский уровень», как правило, включает:

- выявление наиболее близкого аналога (прототипа);
- выявление признаков, отличающих заявленное изобретение от прототипа;
- определение других решений, характеризуемых этими признаками;
- установление известности этих решений.

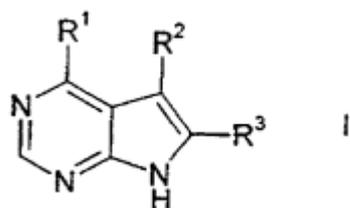
В результате анализа независимого пункта формулы изобретения может быть установлено, что:

все содержащиеся в нем признаки изобретения имеют отношение к достижению заявленного технического результата. В этом случае установление соответствия изобретения по этому пункту условию патентоспособности «новизна», как правило, одновременно означает соответствие этого изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Согласно пункту 2.5.4. Правил ЕАПВ под техническим результатом может также пониматься расширение арсенала средств, актуальных в какой-либо области деятельности, или получение таких средств впервые.

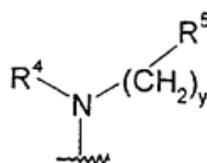
Поскольку изобретения по оспариваемому патенту относятся к новым гетероарилзамещенным пирроло[2,3-d]пиридинам и гетероарилзамещенным пирроло[2,3-d]пиримидинам, которые полезны для модулирования активности Янус-киназ (JAK), то следует согласиться с патентообладателем, что техническим результатом изобретения является расширение арсенала средств, то есть получение впервые новых соединений, которые модулируют активность JAK и могут быть применены для лечения заболеваний, связанных с активностью Янус-киназ.

Из патентного документа [3] известны соединения пирроло[2,3-d]пиримидина общей формулы (I),



, в которой

R¹ представляет группу формулы



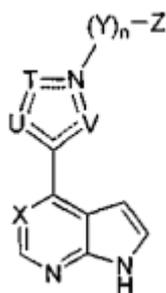
значения радикалов такие, как определено в патентном документе [3]

Известные из патентного документа [3] соединения являются ингибиторами Янус-киназы 3 (JAK-3).

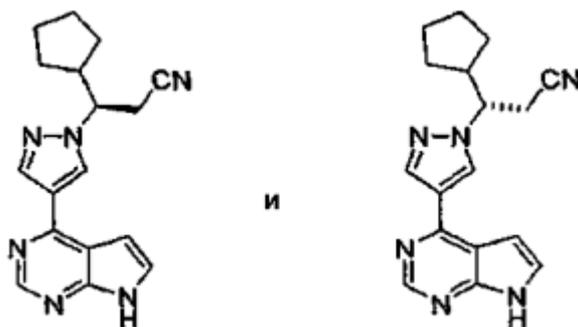
Таким образом, известные соединения содержат в 4-м положении пирроло[2,3-d]пиримидинового кольца замещенную аминогруппу.

Соединения согласно оспариваемому патенту содержат в 4-м положении пирроло[2,3-d]пиримидинового кольца замещенное пятичленное гетероциклическое кольцо, в частности, пиразол.

Так, соединения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента охарактеризованы следующей общей структурной формулой I:



Соединения по независимому пункту 35 формулы оспариваемого патента характеризуются наименованием согласно ИЮПАК и (для наглядности) могут быть охарактеризованы следующими структурными формулами (см. пример 67):



Соединение по независимому пункту 34 формулы оспариваемого патента представляет собой рацемическую смесь упомянутых выше структур.

Таким образом, соединения по независимым пунктам 1, 34 и 35 оспариваемого патента не только не подпадают под общую формулу соединений, раскрытых в патентном документе [3], но и имеют существенное структурное отличие. Как проиллюстрировано выше, все соединения известные из патентного документа [3] имеют гетероатом (N, O или S(O)q), присоединенный в 4-положении пирролопиридинового каркаса, вместо 5-членного ароматического кольца через углеродный атом и дальнейшем замещении 5-членного ароматического кольца специфическим заместителем $-(Y)_n-Z$.

Поскольку соединения по оспариваемому патенту не подпадают под известную общую формулу, представление данных, подтверждающих наличие у них новых свойств в качественном или количественном отношении по сравнению с известной группой соединений, не требуются.

Вместе с тем, общеизвестно, что для биологической активности низкомолекулярного соединения имеет значение его структура в целом, в патентном документе [3] не прослеживается очевидность такой структурной модификации, как раскрыто выше, с получением соединений с модулирующей активностью в отношении Янус киназ 1, 2 и 3, поскольку известно, что даже изменение пространственного расположения одних и тех же групп в молекуле может иметь столь же значительные последствия, как и изменение химической природы различных групп.

В отношении довода возражения о том, что фрагмент пирроло[2,3-d]пиримидина в структуре соединений, является фармакофором, ответственным за биологическую активность в отношении мишеней, представляющих собой Янус-киназы, что очевидно приведет к выявлению у аналогичных соединений активности в отношении тех же Янус-киназ, необходимо отметить следующее.

Соединения, известные из патентного документа [3] являются ингибиторами только одной киназы JAK3. Сведений о том, что любые

пирроло[2,3-d]пиримидины обладают ингибирующей активностью в отношении JAK3, и тем более в отношении киназ JAK1 или JAK2, в патентном документе [3] не приведено.

Между тем необходимо учесть, что согласно пункту 5.8. Правил ЕАПВ в результате анализа независимого пункта формулы изобретения может быть установлено, что все содержащиеся в нем признаки изобретения имеют отношение к достижению заявленного технического результата. В этом случае установление соответствия изобретения по этому пункту условию патентоспособности "новизна", как правило, одновременно означает соответствие этого изобретения условию патентоспособности "изобретательский уровень".

Таким образом, не выявлено препятствий для признания изобретений по независимым пунктам 1, 34 и 35 формулы оспариваемого патента соответствующими условию патентоспособности «изобретательский уровень» (правило 47 (2) Патентной инструкции, см. также пункт 5.8 Правил ЕАПВ).

Целесообразно отметить, что сделанный выше вывод не противоречит выводам, сделанным в постановлении президиума Суда по интеллектуальным правам [10].

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 24.03.2024, действие на территории Российской Федерации евразийского патента на группу изобретений № ЕА 019504 оставить в силе.