



**KFIR** Klagenemnda for  
industrielle rettigheter

**AVGJØRELSE**  
**19. august 2014**  
**Sak PAT 13/010**

Klager: **Sepracor Inc**

Representert ved: Zacco Norway AS

Klagenemnda for industrielle rettigheter sammensatt av følgende utvalg:

Lill Anita Grimstad, Tom Kristensen og Pål Rongved

har kommet frem til følgende

## Avgjørelse

### 1 Kort fremstilling av saken:

- 2 Saken gjelder klage over Patentstyrets avgjørelse av 22. mai 2012, hvor patentsøknad nr. 20110077 ble avslått.
- 3 Spørsmålet i saken er om kravene 1-4 omhandler noe som er patenterbart, jf. § 2.
- 4 Søknaden vedrører anvendelser av deskarboetoksyloretadin eller salt derav for fremstilling av et medikament for behandling av urticaria.
- 5 Ved søknadens avgjørelse i Patentstyret gjaldt følgende krav, inngitt den 18. januar 2011:

1. Anvendelse av deskarboetoksyloretadin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for fremstilling av et medikament for behandling av urticaria.
2. Anvendelse ifølge krav 1, hvor medikamentet er tilpasset for administrering av 0,1 til mindre enn 10 mg deskarboetoksyloretadin pr. dag.
3. Anvendelse ifølge krav 1, hvor medikamentet er tilpasset for administrering av 0,1 til 5 mg pr. dag.
4. Anvendelse ifølge krav 1, hvor DCL eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er til stede i en farmasøytisk akseptabel bærer."

Krav 1 er et selvstendig krav. Kravene 2 til 4 er uselvstendige krav tilknyttet krav 1.

- 6 Under søknadsbehandlingen ble følgende publikasjoner anført av Patentstyrets Første avdeling:

**D1:** WO 85/03707 A1  
**D2:** US 3,326,924 A  
**D3:** NO 121949 B (norsk utlegningsskrift)

- 7 I henhold til overgangsregler til lov 22. juni 2012 nr 58 om Patentstyret og Klagenemnda for industrielle rettar nr 5 overtar Klagenemnda alle saker fra Patentstyrets annen avdeling fra 1. april 2013.

### 8 Grunnene for Patentstyrets vedtak er oppsummert som følger:

- Deskarboetoksyloretadin (DCL) er et metabolsk derivat av loratadin og forbindelsen er terapeutisk aktiv.
- Det er videre kjent at loratadin er effektiv for bruk ved kronisk urticaria, men at forbindelsen innehar visse kardiovaskulære bivirkninger og kan

promotere tumorvekst.

- Urticaria er ifølge beskrivelsen klassifisert som en allergisk forstyrrelse relatert til histaminfrigivelse.
- D1 – kjent at DCL innehar antihistamineffekt uten sedative egenskaper og at forbindelsen derved kan benyttes ved behandling av allergiske tilstander. Behandling av urticaria er ikke spesifikt nevnt. Men det at DCL har antihistaminaktivitet og benyttes ved allergiske tilstander vil i seg selv lede en fagmann til å undersøke om DCL kan benyttes innen behandling av spesifikke allergier som f.eks urticaria.
- D2 – kjent av visse derivater innehar antihistamin- antiserotonin- og antianafylaktisk virkning. Forbindelsene anses dermed å være nyttige ved behandling av allergiske sykdommer som urticaria, sesongbetenget rhinitt og pollenallergi. Forbindelsen DCL skiller seg fra forbindelsen ifølge krav 8 ved at piperindinylderingsen er usubstituert på N-atomet.
- D3 – i det vesentlige samme opplysninger som D2. Forbindelsen DCL skiller seg fra forbindelsen ifølge krav 8 ved at piperindinylderingsen er usubstituert på N-atomet. I følge D3 er en foretrukket forbindelse 4-aza-5-(N-metyl-4-piperidyliden)-10,11-dihydrodibenzo[ a,d]cyklohepten og denne er testet på mus, viser at forbindelsen er meget sikker som legemiddel.
- Patentstyret finner at oppfinnelsen har nyhet jf. patentloven § 3.
- Det objektive tekniske problem som søkes løst ved oppfinnelsen kan i lys av den nærmest nærliggende teknikkens stilling, her definert som D2 eller D3, defineres som hvordan tilveiebringe en alternativ metode for behandling av urticaria.
- Både D2 og D3 beskriver bruk av strukturmessig svært nærliggende forbindelser til behandling av urticaria. Fra D3 er det kjent at slike forbindelser er sikre som legemiddel.
- Forbindelsen DCL til bruk ved behandling av allergiske lidelser er beskrevet i D1.
- En fagmann vil med kjennskap til D2 eller D3, eventuelt kombinert med D1, lett komme frem til forbindelsen DCL med forventning om at denne vil ha virkning ved behandling av urticaria og at forbindelsen vil være sikker som legemiddel.
- Patentstyret kan heller ikke se at de uselvstendige kravene 2–4 omhandler patenterbare trekk. Kravene 2 og 3 angir foretrukne doseringsmengder. Krav 4 krever at DCL er tilstede i en farmasøytisk akseptabel bærer. Det objektive tekniske problem som søkes løst for gjenstandene ifølge kravene 2–4 er det samme som for oppfinnelsen ifølge krav 1. Det å finne frem til passende doseringsmengder anses som en rutinemessig utprøving for en medisinsk fagkyndig. Doseringsmengdene angitt i kravene 2 og 3 anses å

ligge innenfor vanlige benyttede doseringsmengder for administrasjon av antihistaminer. Bruk av bærere i legemiddelformuleringer er en alminnelig benyttet teknikk.

## 9 Klager har for Klagenemnda i korte trekk gjort gjeldende:

- Klager anfører at oppfinnelsen som omsøkt har oppfinneshøyde i lys av de aktuelle mothold D1-D3, og ber om at avgjørelsen fra Patentstyret oppheves og at patent meddeles.
- Motholdene viser ikke at DCL er en selektiv antagonist, en egenskap som er signifikant for en forbindelses evne til å behandle urticaria.
- Ved tidspunktet for inngivelse av søknaden ville en fagperson ikke ha valgt anvendelse av DCL ved behandlingen av de angitte lidelsene på grunn av faren for bivirkninger forbundet med antagonister.
- Beskrivelsen presenterer uventede resultater som ytterligere beviser at kravene innehar oppfinneshøyde.
- D1 tilveiebringer ingen antydning om at DCL er en effektiv H1 antagonist.
- D2 og D3 bemerker tilfeldig at forbindelsene beskrevet deri er "useful in the treatment of allergic disorders such as urticaria, seasonal rhinitis and pollen sensitivity" (D2, kolonne 3, linje 60-62). Både D2 og D3 mangler fullstendig data som viser at forbindelsene virkelig er "virksomme" ved behandling av slike lidelser. På bakgrunn av den fullstendige mangelen på data verken lærer eller antyder D2 og D3 at noen av forbindelsene beskrevet deri ville ha virkelig anti-allergisk aktivitet, og langt mindre være nyttige ved behandling av urticaria.
- Tatt i betraktning at de generelle angivelsene i D2 og D3 kan omfatte hundrevis av forbindelser, og at DCL ikke en gang er spesifikt eksemplifisert i D2 og D3, er vi av den oppfatning at fremgangsmåten ifølge oppfinnelsen ikke kan være en "utvalgsoppfinnelse" siden beskrivelsen i D2 og D3 er fullstendig inadekvat å velge fra for å nå frem til foreliggende oppfinnelse.
- Patentstyret ignorerer helt de uventede overlegne egenskaper av DCL sammenlignet med loratadin (forbindelsen som er beskrevet i D1). I patentsøknaden er det demonstrert i eksempel 3 og 4 at DCL viser en høyere potens for histaminreseptorer enn loratadin og DCL er 5-7 ganger mindre potent enn loratadin ved fremmelse av tumorvekst. I eksempel 5 i beskrivelsen viser man at DCL er mindre aktiv enn terfenadin i inhibering av forsinket likeretting i hjertet hvilket underbygger den reduserte tilbøyeligheten av DCL til å forårsake hjertebivirkninger. Disse funnene er signifikante og overraskende.
- Det anføres at Patentstyret ikke har vektlagt i tilstrekkelig grad de fremlagte resultatene, og at forliggende søknad oppviser tilstrekkelig

uventede egenskaper til at fremgangsmåten i følge oppfinnelsen må sies å oppfylle kravet til oppfinneshøyde overfor motholdene D1-D3.

## 10 Klagenemnda skal uttale:

- 11 Klagenemnda skal vurdere og ta stilling til om det omsøkte patentet har tilstrekkelig nyhet og oppfinneshøyde. Metoden for bedømmelse av oppfinneshøyde skal ta utgangspunkt i den såkalte «problem og løsning»-tilnærmingen. Det vises til Klagenemndas syn på saken nedenfor.
- 12 Ved vurderingen av både nyhet og oppfinneshøyde skal en gjennomsnittlig fagperson brukes som målestokk. Fagpersonen er en tenkt gjennomsnittsfagperson på området. Fagpersonen er fullt ut kjent med teknikkens stand på området på søknadstidspunktet og har evne til å utnytte alt kjent materiale på en fagmessig måte. Herunder kan fagpersonen foreta nærliggende nye konstruksjoner, men er ikke i besittelse av innovative evner. Fagpersonen evner å prøve ut på en god fagmessig måte alle kombinasjonsmuligheter som både var nærliggende og ga en rimelig forventning om å lykkes.
- 13 Fagmannen utgjør her et tverrfaglig team med adekvat utdanningsnivå som behersker både farmakologi, legemiddelkjemi og medisin.
- 14 Etter patentloven § 2 første ledd kan patent bare meddeles på oppfinnelser som er nye i forhold til hva som var kjent før patentsøknadens prioritetsdag. Vurderingen foretas ut fra patentkravene, som har som oppgave å skille oppfinnelsen fra kjent teknikk.
- 15 I D1 er det kjent at DCL innehar antihistaminefekt uten sedative egenskaper og at forbindelsen derved kan benyttes ved behandling av allergiske tilstander. Behandling av urticaria er ikke spesifikt nevnt.
- 16 I D2 og D3 er det kjent at visse derivater innehar antihistamin- antiserotonin- og antianafylaktisk virkning, og er dermed nyttig ved behandling av allergiske sykdommer som f.eks urticaria. Forbindelsen DCL skiller seg fra forbindelsen ifølge krav 8 ved at piperindinylideringen er usubstituert på N-atomet.
- 17 Klagenemnda anser at kravet til nyhet er oppfylt fordi anvendelse av deskarboetoksylostatadin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for fremstilling av et medikament for behandling av urticaria, som angitt i søknadens krav 1, ikke er beskrevet i D1, D2 eller D3.
- 18 Patentloven § 2 første ledd krever videre at oppfinnelsen «skiller seg vesentlig fra» det som var kjent før patentsøknadens prioritetsdag; det må foreligge oppfinneshøyde. Dette innebærer at oppfinnelsen ikke må ha vært nærliggende for en gjennomsnittlig fagperson som var kjent med teknikkens stand, jf. NU 1963:6 s- 127. Ved vurderingen av om kravet til oppfinneshøyde er oppfylt, skal teknikkens stand i sin helhet tas i betraktning, og flere mothold kan kombineres. Vurderingen av oppfinneshøyde skal foretas ut fra patentkravene.

- 19 En oppfinnelse anses i henhold til fast praksis for å ha vært nærliggende dersom det må legges til grunn at en fagperson som var kjent med teknikkens stand forut for søknadsdagen, ville ha forsøkt å løse problemet på den i patentkravene angitte måte med en rimelig forventning om å lykkes.
- 20 I den europeiske patentkonvensjonen (EPC) er dette i artikkel 56 første punktum formulert slik: En oppfinnelse anses å ha oppfinneshøyde når den for en fagmann ikke fremstår som nærliggende i forhold til teknikkens stand.
- 21 Teknikkens stilling på dette området fremgår av de mothold som er fremlagt i saken.
- 22 Det objektive tekniske problem som oppfinnelsen løser i forhold til D2/D3 er hvordan tilveiebringe en alternativ metode for behandling av urticaria.
- 23 Klagenemnda er av den oppfatning at en fagperson med kjennskap til D2 og D3, eventuelt kombinert med D1, lett ville komme frem til forbindelsen DCL med forventning om at denne vil ha virkning ved behandling av urticaria og at forbindelsen vil være sikker som legemiddel.
- 24 D1 angir at DCL, som er den farmakologiske og oralt aktive hovedmetabolitt av H1-antihistaminmedikamentet loratidin, har antihistaminegenskaper med i det vesentlige ingen sedative virkninger ved en klinisk anvendbar antihistamindose (s. 6 til s. 9). D1 angir også at antihistaminegenskapene til DCL gjør forbindelsen anvendbar for behandling av allergiske reaksjoner i et pattedyr.
- 25 I skrevet til Klagenemnda angir klager blant annet at "Patentstyret helt overser de uventede overlegne egenskaper av DCL sammenlignet med loratadin (forbindelsen som er beskrevet i D1)." Dette er ikke riktig, siden D1 beskriver DCL og ikke loratadin.
- 26 Klager antyder også at fagpersonen nærmest ville ha en fordom mot å utprøve DCL for behandling av urticaria, siden D1 ikke viser at DCL er en effektiv H1-antagonist og på grunn av faren for bivirkninger forbundet med antagonister. Klagenemnda finner det ikke sannsynliggjort at en slik fordom faktisk forelå. Snarere mener Klagenemnda at det faktum at loratadin var vist å være effektivt for behandling av urticaria, kombinert med kunnskapen om at DCL er et nedbrytningsprodukt av loratadin som selv har antihistaminaktivitet og som i tillegg ikke virker sedativt, begge deler kjent fra D1, ville gjøre det naturlig for fagpersonen å prøve ut DCL i behandling av urticaria.
- 27 Mot denne bakgrunn har Klagenemnda kommet til at patentlovens krav til oppfinneshøyde etter dette ikke er oppfylt, og Patentstyrets avgjørelse om å avslå søknaden blir å stadfeste.

**På dette grunnlag stemmer vi for følgende**

## **Slutning**

Patentstyrets avgjørelse stadfestes.

Lill Anita Grimstad  
(sign.)

Tom Kristensen  
(sign.)

Pål Rognved  
(sign.)