

Патентные исследования по лекарственному средству Биктегравир

Выполнил Лалаев Борис Юрьевич, к.х.н., заведующий кафедрой химической
технологии лекарственных веществ ФГБОУ ВО СПХФУ Минздрава России,
магистр права СПбГУ

Дата начала исследования – 09.01.2023

Дата окончания исследования – 29.01.2023

Предмет исследования: Проведение патентных исследований для следующих веществ: биктегравир, его формы и ЛФ, применение, комбинации;

Объект исследования: Лекарственное средство Биктегравир

Задачи патентного поиска:

- 1) поиск патентов на субстанцию биктегравир, соль биктегравира, способы получения субстанции, фармацевтические композиции (составы лекарственных форм), способы их получения;
- 2) выявление блокирующих патентов и исследование патентной чистоты на территории РФ и ЕАЭС;
- 3) определение сроков выхода из-под патентной защиты для субстанции и лекарственной формы на территории РФ и ЕАЭС;

Источники патентного поиска:

- 1) патентный поиск осуществлялся в патентных базах РФ, ЕАЭС, ЕС, США и др (Patentoscope, ЕАПО, Espcaenet, USPTO и др.), а также в непатентных базах;

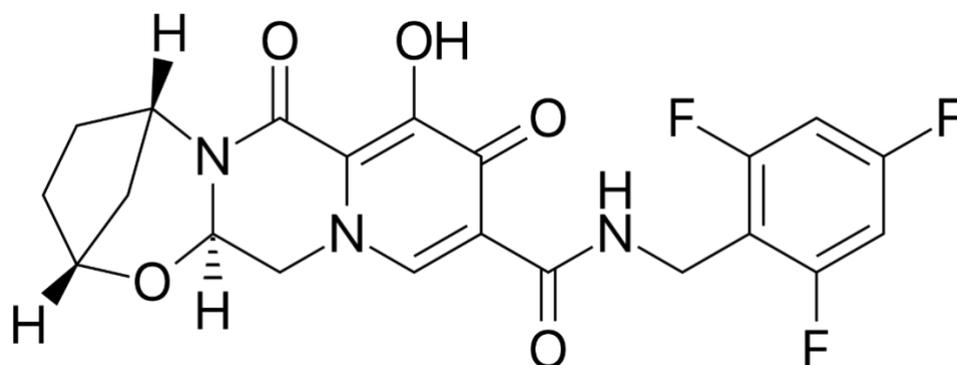
Объектом настоящих патентных исследований является лекарственное средство Биктегавир.

Биктегавир (МНН; ВИС, ранее известный как **GS-9883**) – противовирусный препарат класса ингибиторов интегразы, структурно полученный из более раннего соединения долутегавира учеными биофармацевтической компании «Gilead Sciences»; *in vitro* и клинические результаты были представлены компанией Gilead Sciences летом 2016 года. В 2016 году биктегавир проходил 3-ю фазу исследования как часть режима приема одной таблетки в комбинации с тенофовир алафенамидом (ТАФ) и эмтрицитабином (FTC) для лечения ВИЧ-1 инфекции, а комбинированный препарат биктегавир / эмтрицитабин / тенофовир алафенамид (Biktarvy) был одобрен для использования в США в 2018 году.

Химические названия Биктегавира:

(1*S*,11*R*,13*R*)-5-Гидрокси-3,6-диоксо-*N*-(2,4,6-трифторбензил)-12-окса-2,9-дiazатетрацикло[11.2.1.0-2,11-.0-4,9]гексадека-4,7-диен-7-карбоксамид

Структура Биктегавира показана на рисунке 1.



Наименование изобретения Номер патента	Патентообладатель ь	Срок действия	Правовая охрана	
			Р Ф	ЕАЭС

Патент ЕА 030003 ПОЛИЦИКЛИЧЕСКОЕ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВОЕ СОЕДИНЕНИЕ И ЕГО ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЕ ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ВИЧ-ИНФЕКЦИИ	ДЖИЛИД САЙЭНС, ИНК. (US)	19.12.2013 - 22.01.2035	+	Армения, Россия, Беларусь, Казахстан , Киргизия
Патент 030967 (2R,5S,13aR)-7,9-ДИОКСО- 10-((2,4,6- ТРИФТОРБЕНЗИЛ)КАРБАМОИЛ)- 2,3,4,5,7,9,13,13a-ОКТАГИДРО-2,5- МЕТАНОПИРИДО[1',2':4,5]ПИРАЗИНО[2, 1-b][1,3]ОКСАЗЕПИН-8-ОЛАТ НАТРИЯ	ДЖИЛИД САЙЭНС, ИНК. (US)	19.06.2015	+	Армения, Россия, Беларусь, Казахстан , Киргизия

Наименование изобретения Номер патента	Объект правовой охраны (вещество, композиция, применение, ЛФ)
Патент ЕА 030003 ПОЛИЦИКЛИЧЕСКОЕ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВОЕ СОЕДИНЕНИЕ И ЕГО ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЕ ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ВИЧ- ИНФЕКЦИИ	Молекула (вещество, АФС) Применение Композиция (состав) Способ получения Способ лечения
Патент 030967 (2R,5S,13aR)-7,9-ДИОКСО-10- ((2,4,6-ТРИФТОРБЕНЗИЛ)КАРБАМОИЛ)- 2,3,4,5,7,9,13,13a-ОКТАГИДРО-2,5- МЕТАНОПИРИДО[1',2':4,5]ПИРАЗИНО[2,1- b][1,3]ОКСАЗЕПИН-8-ОЛАТ НАТРИЯ	Молекула (вещество, АФС) Применение Композиция (состав) Способ получения Способ лечения

Заключение:

В настоящее время лекарственное средство с международным непатентованным наименованием Биктегривир является одним из эффективных лекарственных средств для лечения ВИЧ-инфекции.

На территории Российской Федерации и других стран – участниц Евразийской Патентной Конвенции на лекарственный препарат Биктегравир зарегистрированы несколько патентов, обеспечивающие правовую охрану изобретений, относящихся к молекуле Биктегравир, фармацевтически приемлемых солей, способа получения, фармацевтические композиции.

Наиболее крепким являлся патент Патент ЕА 030003 ПОЛИЦИКЛИЧЕСКОЕ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВОЕ СОЕДИНЕНИЕ И ЕГО ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЕ ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ВИЧ-ИНФЕКЦИИ.

Патент 030967 (2R,5S,13aR)-7,9-ДИОКСО-10-((2,4,6-ТРИФТОРБЕНЗИЛ)КАРБАМОИЛ)-2,3,4,5,7,9,13,13a-ОКТАГИДРО-2,5-МЕТАНОПИРИДО[1',2':4,5]ПИРАЗИНО[2,1-b][1,3]ОКСАЗЕПИН-8-ОЛАТ НАТРИЯ.

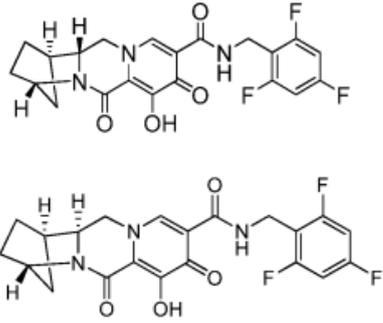
Патенты ЕА 030003 и ЕА 030967 могут быть аннулированы по несоответствию условию патентноспособности «изобретательский уровень»

Блокирующие патенты, которые могут быть признаны недействительными	Условия признания патентов недействительными
Патент ЕА 030003 ПОЛИЦИКЛИЧЕСКОЕ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВОЕ СОЕДИНЕНИЕ И ЕГО ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЕ ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ВИЧ-ИНФЕКЦИИ.	Изобретательский уровень
Патент 030967 (2R,5S,13aR)-7,9-ДИОКСО-10-((2,4,6-ТРИФТОРБЕНЗИЛ)КАРБАМОИЛ)-2,3,4,5,7,9,13,13a-ОКТАГИДРО-2,5-	Изобретательский уровень

МЕТАНОПИРИДО[1',2':4,5]ПИРАЗИНО[2,1-
б][1,3]ОКСАЗЕПИН-8-ОЛАТ НАТРИЯ.

**Дополнение к патентным исследованиям по анти-ВИЧ субстанции
Биктегравир**

Наименование изобретения Номер патента	Патентообладатель	Срок действия	Правовая охрана	
			РФ	ЕАЭС
ЕА 037633 (заявка 201890236) ПОЛИЦИКЛИЧЕСКИЕ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВ ЫЕ СОЕДИНЕНИЯ, ИХ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ И ПРИМЕНЕНИЕ	ДЖИЛИД САЙЭНС, ИНК. (US)	19.12.2013 - 19.12.2033	+	+
ЕА 034169 (заявка 201692412) СИНТЕЗ ПОЛИЦИКЛИЧЕСКИХ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВ ЫХ СОЕДИНЕНИЙ	ДЖИЛИД САЙЭНС, ИНК. (US)	16.06.2015 - 16.06.2035	+	+
ЕА 042082 (заявка 201992183) СИНТЕЗ ПОЛИЦИКЛИЧЕСКИХ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВ ЫХ СОЕДИНЕНИЙ	ДЖИЛИД САЙЭНС, ИНК. (US)			

Наименование изобретения Номер патента	Объект правовой охраны (вещество, композиция, применение, ЛФ)
ЕА 037633 ПОЛИЦИКЛИЧЕСКИЕ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВЫЕ СОЕДИНЕНИЯ, ИХ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ КОМПОЗИЦИИ И ПРИМЕНЕНИЕ	Молекула (вещество, АФС)  (не являются Биктегравиром) Композиция (состав) Применение композиции Способ лечения
ЕА 034169 СИНТЕЗ ПОЛИЦИКЛИЧЕСКИХ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВЫХ СОЕДИНЕНИЙ	Способ получения полупродуктов N,N-галогенбензилдиоксобутаноламинных производных (не являются Биктегравиром)
ЕА 042082 (заявка 201992183) СИНТЕЗ ПОЛИЦИКЛИЧЕСКИХ КАРБАМОИЛПИРИДОНОВЫХ СОЕДИНЕНИЙ	Способ получения Биктегравира

Заключение.

Данные патентные документы не являются блокирующими по отношению к веществу Биктегрвир, часть из них не относится напрямую к Биктегравиру.