



## BREVET DANS LE DOMAINE PHARMACEUTIQUE PREMIÈRE PARTIE : COMMENT PROTÉGER UN MÉDICAMENT ?

DAMIEN CALVET ET LAURENCE BOURGET-MERLE\*  
**ROBIC**, S.E.N.C.R.L.  
AVOCATS, AGENTS DE BREVETS ET DE MARQUES

L'une des branches majeures de la chimie et de la biochimie demeure la mise au point de nouvelles molécules ou protéines entrant dans la fabrication de médicaments.

Au Canada, un seul brevet peut protéger différents aspects d'une même invention<sup>1</sup>. Dans le domaine pharmaceutique, les revendications peuvent couvrir:

- une molécule ou une famille de molécules chimiques possédant une même structure de base;
- le procédé de synthèse de cette molécule ou la famille de molécules;
- un intermédiaire réactionnel entrant dans le procédé, dans la mesure où la structure de cet intermédiaire est proche de la structure du produit final;
- une composition pharmaceutique comprenant la molécule; et
- l'utilisation de la molécule ou de la composition pharmaceutique pour le traitement spécifique d'une ou plusieurs maladies.

Nous présentons ici les différentes façons de protéger une nouvelle molécule ou une famille de molécules. Il est important de mentionner que l'obtention d'un brevet ne donne aucun droit sur la commercialisation d'un médicament breveté, mais sert seulement à conférer au propriétaire du brevet un monopole commercial. Les lois et les règlements régissant la commercialisation des médicaments au Canada seront décrits dans un futur article.

Dans le cas d'une molécule chimique, un droit de propriété sur celle-ci peut être revendiqué si la molécule rencontre les critères de brevetabilité<sup>2</sup>. La description du brevet doit divulguer une définition claire et précise de la molécule (idéalement pas sa structure chimique), au moins un procédé de synthèse permettant d'obtenir cette molécule, et bien entendu un usage commercial de celle-ci. Si l'usage commercial est

---

© CIPS, 2008.

\*De ROBIC, S.E.N.C.R.L., un cabinet multidisciplinaire d'avocats, d'agents de brevets et d'agents de marques de commerce. Publié à (Hiver 2008), 22:4 Chimiste. Publication 060.010F.

<sup>1</sup> Article 36 des Règles sur les brevets.

<sup>2</sup> « *Le Chimiste* » Vol. 20, N°4 (Hiver 2006) pages 18-19.

ROBIC, SENCRL  
1001, Square-Victoria - Bloc E - 8<sup>e</sup> étage  
Montréal (Québec) Canada H2Z 2B7  
Tél. : 514 987-6242 Fax : 514 845-7874  
[www.robic.ca](http://www.robic.ca) [info@robic.com](mailto:info@robic.com)

un traitement médical, le brevet doit démontrer l'efficacité thérapeutique de la molécule, par exemple en indiquant des résultats de tests biologiques.

L'absence de telles preuves de synthèse et d'efficacité entraînera un rejet de l'Examinateur en charge d'examiner la demande de brevet, sous un motif qu'on appelle « absence de prédiction valable ». Ce type de rejet est relativement fréquent quand le composé étudié est une nouvelle molécule jamais synthétisée auparavant. En effet, la demande de brevet couvrant la molécule est habituellement déposée très tôt dans le processus de mise au point d'un médicament. Plusieurs années (et quelques millions de dollars) sont généralement nécessaires et parfois même avant d'avoir obtenu des résultats expérimentaux prouvant l'efficacité de la molécule. C'est pourquoi, il est préférable, dans la mesure du possible, de ne pas déposer de demande de brevet et de garder secrète la découverte d'une nouvelle molécule jusqu'à ce que les inventeurs possèdent assez d'éléments prouvant son efficacité thérapeutique dans le traitement d'une maladie. Pour résumer, il ne suffit pas d'appeler une molécule « médicament » pour qu'elle en soit un.

La façon la plus directe de revendiquer une nouvelle molécule est de la nommer par son nom chimique (la nomenclature IUPAC<sup>3</sup> est à privilégier) ou de donner sa structure chimique semi développée. Mais généralement, les inventeurs tenteront d'obtenir une protection, non pas pour une seule molécule en particulier, mais pour une famille de molécules ayant en commun une partie seulement de sa structure.

Prenons comme exemple le citrate de Sildénafil, un composé chimique dont la structure chimique est détaillée dans le Tableau ci-joint sous la Figure 1, et qui entre dans la composition d'un médicament mieux connu par sa marque commerciale *Viagra*® de la société Pfizer. Le brevet canadien 2,044,748, délivré le 3 février 1998, couvre en fait une famille de molécules dont la formule de base est donnée dans le Tableau sous la Figure 2. Dans cette formule, les radicaux identifiés R<sub>1</sub> à R<sub>5</sub> sont en fait définis dans la revendication de façon à ce que celle-ci couvre une multitude de molécules ayant en commun la structure de base représentée. Ce type de revendication est appelé « revendication Markush », du nom de l'inventeur américain qui, dans les années 1920, utilisa pour la première fois, et avec succès, cette technique de rédaction<sup>4</sup>. Pour qu'une « revendication Markush » soit acceptée lors de l'examen de la demande, il n'est pas nécessaire que la description donne un exemple pour chacune des molécules revendiquées, toutefois un certain nombre d'exemples concrets est nécessaire pour éviter un rejet pour manque de prédication valable.

Cela peut sembler pour beaucoup un monopole bien trop grand que de conférer à un seul propriétaire le droit sur plusieurs centaines, voir des milliers de molécules, alors qu'en réalité seule une dizaine d'entre elles ont été réellement synthétisées au

---

<sup>3</sup> IUPAC: International Union of Pure and Applied Chemistry « *Recommendations 1993* » R. Panico et al. Blackwell Science Ltd.

<sup>4</sup> Brevet N°US 1,506,316 (26 août 1924).

laboratoire. C'est pourquoi, il existe en Droit canadien de brevets, ce que l'on appelle « un brevet de sélection ». Ce type de brevet peut revendiquer une molécule déjà couverte dans une « revendication Markush » d'un brevet antérieur. Pour se faire, la molécule sélectionnée ne doit toutefois pas avoir été décrite en détail dans la description de celui-ci ou dans un autre document public, et avoir un avantage ou des propriétés inattendus vis-à-vis des autres molécules de la famille décrites dans le brevet antérieur. Le brevet de sélection devra donc exposer de façon claire les avantages et les propriétés inattendus de la molécule sélectionnée, et surtout dans le cas où cette molécule sélectionnée aura une utilité similaire.

Un exemple important en chimie de ce qui peut être revendiqué dans un brevet de sélection concerne la protection d'un énantiomère spécifique d'une molécule racémique. Bien que la molécule racémique ait été déjà revendiquée dans un brevet d'origine, et dans la mesure où ce brevet d'origine ne donnait aucune méthode claire d'obtention de cet énantiomère, via par exemple une synthèse asymétrique contrôlée ou une méthode de séparation, il est possible d'obtenir un brevet sur cet énantiomère. Cet exemple est important car il est bien connu dans le domaine pharmaceutique qu'un énantiomère pur peut avoir de meilleures propriétés thérapeutiques que le mélange racémique correspondant<sup>5</sup>.

Les molécules jouant le rôle d'intermédiaires réactionnels dans la synthèse d'une molécule peuvent également être revendiquées dans le même brevet. Pour ce faire, et tel que nous l'avons mentionné au début de cet article, la structure des intermédiaires doit être proche de la structure du produit final. Le brevet ne peut pas revendiquer pour cet intermédiaire autre chose que son usage intrinsèque d'intermédiaire et, s'il y a lieu, un usage équivalent à l'usage du produit final.

Finalement, une autre façon de protéger une nouvelle molécule est de la revendiquer par son procédé de fabrication. Dans ce cas, le procédé est avant tout l'objet principal du brevet. La protection par brevet d'un procédé de synthèse fera l'objet de la deuxième partie de cet article.

---

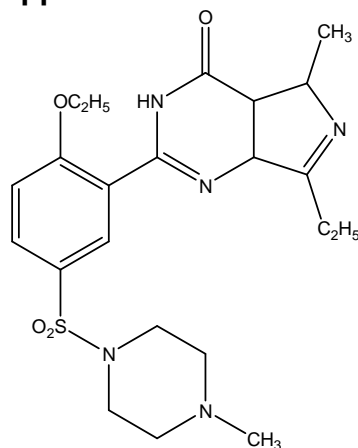
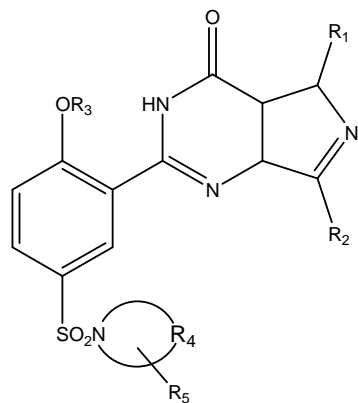
<sup>5</sup> Décision "Sanofi-Synthélabo Canada Inc. c. Apotex Inc. Ministère de la santé"; 2005 CF 390.

**Nom Commercial :***Viagra®* ou *Revatio®***Nom générique :**

Citrate de Sildénafil

**Nom chimique :**

Citrate de 1-[4-éthoxy-3-(6,7-dihydro-1-méthyl-7-oxo-3-propyl-1H-pyrazolo[4,3-d]pyrimidin-5-yl)-phénylesulfonyl]-4-méthylpipérazine

**Formule semi-développée du Sidénafil :****Figure 1****Structure de type Markush (Revendication 1 du brevet canadien 2,044,748)****Figure 2**

# ROBIC

+ DROIT  
+ AFFAIRES  
+ SCIENCES  
+ ARTS

ROBIC, SENCRL  
1001, Square-Victoria - Bloc E - 8<sup>e</sup> étage  
Montréal (Québec) Canada H2Z 2B7  
Tél. : 514 987-6242 Fax : 514 845-7874

[www.robic.ca](http://www.robic.ca) [info@robic.com](mailto:info@robic.com)

