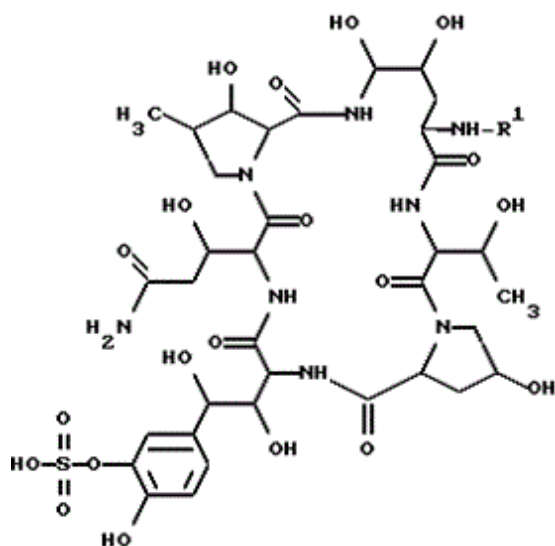


**ЗАКЛЮЧЕНИЕ**  
**коллегии по результатам**  
**рассмотрения  возражения  заявления**

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01.01.2008 Федеральным законом от 18.12.2006 № 321-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации» (далее – Кодекс), и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2165423, поступившее 31.07.2018 от Герасимовой Ю.П. (далее – лицо, подавшее возражение), при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2165423 на группу изобретений «Полипептидное соединение, способ его получения и фармацевтическая композиция», выдан по заявке №97107338/04 с приоритетом от 07.10.1994 на имя Фудзисава Фармасьютикал Ко., ЛТД. (Япония). В настоящее время согласно внесенным изменениям, опубликованным 20.04.2006 в Бюллетене Изобретений №11, 2006 патентообладателем является Астеллас Фарма Инк., (Япония), (далее – патентообладатель). Патент действует со следующей формулой:

«1. Полипептидное соединение, имеющее следующую общую формулу I



где  $R^1$  обозначает низший алканоил, замещенный пиридилем или пиридазинилом, каждый из которых может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкокси, высший алкокси(низший)алкил; фенил, имеющий высший алкокси; фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; пиперазинил, замещенный фенилом, имеющим высший алкокси; пиперазинил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси(высший)алкокси; и пиперазинил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; низший алканоил, замещенный 1,2,3,4-тетрагидроизохинолином, имеющим высший алкокси и низший алкоксикарбонил; низший алканоил, замещенный кумарином, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкокси и оксогруппу; низший алканоил, замещенный бензотиофенилом, который может иметь 1-3 высших алкокси; низший алканоил, замещенный бензо[b]фуранилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкокси и низший алкил; низший алканоил, замещенный бензооксазолилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкил; фенил, имеющий низший алкокси; фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил; и пиридил, имеющий высший алкокси; низший алканоил, замещенный бензимидазолилом, который может иметь 1-3 заместителя,

выбранных из группы, включающей высший алкил и фенил, имеющий низший алкокси; низший алканоил, замещенный пиперидилом или пиперазинилом, каждый из которых может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей фенил, имеющий высший алкокси, и нафтоил, имеющий высший алкокси; фенил(низший)алканоил, замещенный фенилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей низший алкокси, низший алкил, высший алкил, низший алкокси(высший)алкил, галоген(низший)алкокси, низший алкенилокси, галоген(высший)алкокси, и низший алкокси(высший)алкокси; нафтил(низший)алканоил, который может иметь 1-3 высших алкокси; низший алкиноил, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей нафтил, имеющий высший алкокси, и фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил; фенил(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алканоил, замещенный фенилом, который имеет 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей низший алкокси, высший алкокси, низший алкил, высший алкил и фенил, имеющий низший алкокси(низший)алкил; где указанный фенил(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алканоил может иметь гидроксо-, оксо-, защищенную амино-, или аминогруппу; (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алканоил, замещенный нафтилом, имеющим высший алкокси; фенилокси(низший)алканоил, который может иметь 1-3 высших алкокси; фенил(низший)алкокси(низший)алканоил, который может иметь 1-3 высших алкокси; фениламино(низший)алканоил, который может иметь 1-3 высших алкокси; бензоил, замещенный пиперазинилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей фенил, имеющий низший алкокси; фенил, имеющий высший алкокси; фенил, имеющий низший алкил; фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси; фенил, имеющий высший алкенилокси; пиперидил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; цикло(низший)алкил, имеющий фенил; фенил, имеющий цикло(низший)алкил; и фенил, замещенный триазилолом, имеющим оксо и

низший алкил; где указанный бензоил может иметь галоген; бензоил, замещенный изоксазолилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкил; фенил, имеющий низший алкокси; фенил, имеющий высший алкокси; фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси; и фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси(высший)алкокси; бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил; бензоил, замещенный фенилом, имеющим высший алкил; фенил(низший)алкеноил, замещенный фенилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей низший алкокси, низший алкил, высший алкил; низший алкокси(низший)алкил, галоген(низший)алкокси, низший алкенилокси, галоген(высший)алкокси и низший алкокси(высший)алкокси; бензоил, замещенный триадиазолилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей фенил, имеющий низший алкокси; фенил, имеющий высший алкокси; цикло(низший)алкил, имеющий низший алкил; фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; фенил, имеющий цикло(низший)алкил; фенил, имеющий пиперидил; и фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси; или бензоил, замещенный оксадиазолилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей фенил, имеющий низший алкокси; фенил, имеющий высший алкокси; фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси; высший алкил и фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси, или его фармацевтически приемлемая соль.

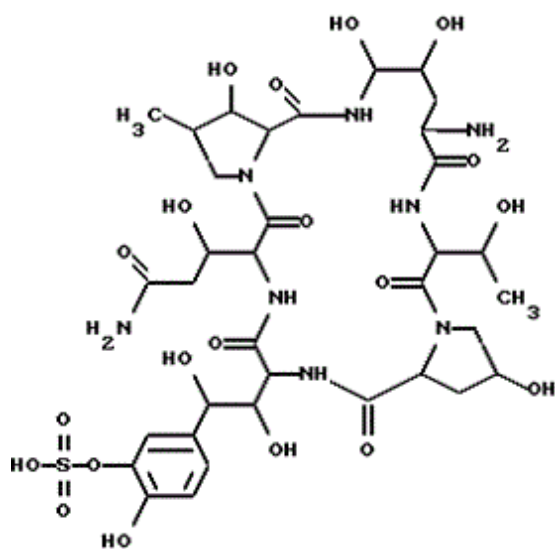
2. Соединение по п.1, где  $R^1$  обозначает бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси(высший)алкокси, или бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил.

3. Соединение по п.1, где  $R^1$  обозначает бензоил, замещенный пиперазином, который может иметь фенил, имеющий низший алкокси; бензоил, замещенный изоксазолилом, который может иметь фенил,

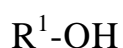
имеющий низший алкокси; бензоил, замещенный триадиазолиллом, который может иметь фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси, или бензоил, замещенный оксадиазолиллом, который может иметь фенил, имеющий низший алкокси.

4. Соединение по п.1, где  $R^1$  обозначает фенил(низший)алкеноил, замещенный фенилом, который может иметь низший алкокси.

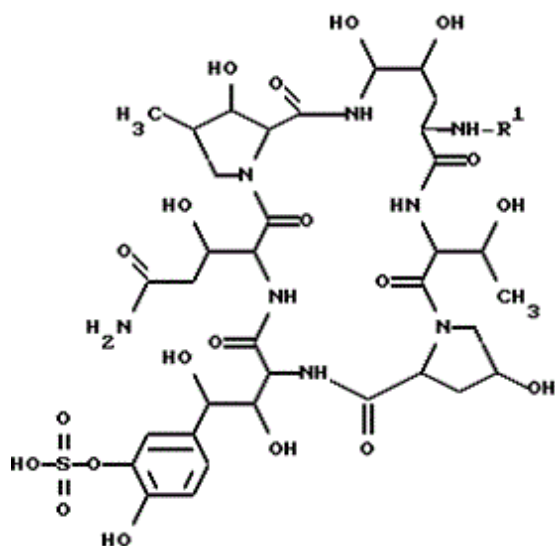
5. Способ получения полипептидного соединения формулы I по п.1, заключающийся в том, что соединение формулы II



или его производное, реакционноспособное по аминогруппе, или его соль подвергают взаимодействию с соединением формулы III



где  $R^1$  определен в п.1, или с его производным, реакционноспособным по карбоксигруппе, или с его солью, в результате чего получают соединение формулы I



где  $R^1$  определен, как указано в п.1,  
или его соль.

6. Фармацевтическая композиция, проявляющая противогрибковую активность, отличающаяся тем, что в качестве активного ингредиента она содержит терапевтически эффективное количество соединения по п.1 или его фармацевтически приемлемой соли в смеси с фармацевтически приемлемыми носителями или наполнителями.

7. Соединения по п.1, обладающие противогрибковой активностью.

8. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, пригодные для применения в качестве лекарственного средства».

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса поступило возражение, мотивированное несоответствием запатентованной группы изобретений условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень».

К возражению приложены копии следующих материалов:

- заявка ЕР № 062531 А2, дата публикации 27.12.1991 (далее – [1]);
- учебник Беликов В.Г., Фармацевтическая химия, часть 1- Общая фармацевтическая химия, М.: Высшая школа, 1993, с.44-45 (далее – [2]);
- монография под редакцией Егорова Н.С. Антибиотики-Полипептиды, издательство МГУ, 1987, с.3,140-143 (далее – [3]);

- международная заявка WO 94/13631, дата публикации 23.06.1994

(далее – [4]).

По мнению лица, подавшего возражение, независимый п.1 формулы по оспариваемому патенту, характеризует объект – группу соединений, выраженную с использованием общей структурной формулы I, включающий неопределенное количество соединений благодаря многообразию различных комбинаций радикалов-заместителей. Данное обстоятельство, по мнению лица, подавшего возражение, не позволяет идентифицировать однозначно структуру всех соединений, попадающих под эту формулу. В частности, лицо, подавшее возражение, подчеркивает, что все радикалы охарактеризованы с помощью терминов «низший» или «высший» при этом, в описании нет «единого раскрытия» для таких терминов. В возражении отмечено, что в уровне техники встречаются разные трактовки упомянутых терминов, например, как раскрыто в заявке [4] радикалы C1-C8 относятся к понятию «низший», а в оспариваемом патенте радикал C7 может относиться к понятию «высший». В возражении, подчеркнуто, что структура соединений в ряде альтернатив не ясна и отсутствуют сведения, о том, какие соединения могут быть получены. Также, по мнению лица, подавшего возражение, из формулы изобретения не ясно какие радикалы непосредственно являются заместителями радикала R1, а какие относятся к заместителям в них. Кроме того, лицо, подавшее возражение, отмечает, что отсутствуют примеры соединений, описанных в зависимых п.п.2-4.

Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что в описании к оспариваемому патенту не приведены примеры получения «всех различных по химической природе групп радикалов» и подчеркнуто, что «средства и методы не раскрыты в достаточной степени».

В отношении фармацевтической композиции по п.6 формулы оспариваемого патента и в отношении зависимых п.п. 7-8 в возражении отмечено, что «нельзя сделать вывод о достижении назначения по п.6-8 формулы изобретения оспариваемого патента». По мнению лица, подавшего

возражение, данные по биологической активности, представленные в описании к оспариваемому патенту в таблице 2 нельзя распространить на весь объем притязаний, т.к. из уровня техники известно, что введение разных групп в формулу может привести к изменению или полному отсутствию активности. Так, по мнению лица, подавшего возражение из учебника [2] известно, что введение альдегидной группы усиливает фармакологический эффект. Также из учебника [2] известно, что рост биологической активности в гомологических рядах не беспределен и «высшие» гомологи неэффективны. Кроме того, в возражении отмечено, что из монографии [3], на примере циклопентильного вещества, представляющего собой антибиотик грамицидин S, известны существенные недостатки циклопентильных соединений, которые ограничивают их ценность в качестве антибактериальных лекарственных средств.

В отношении несоответствия условию патентоспособности «новизна» в возражении указано следующее. В решении по заявке [1], раскрыты соединения, подпадающие под объем формулы оспариваемого патента. Так, по мнению лица, подавшего возражение, характеристики радикалов химической формулы I по п.1 формулы оспариваемого патента «подпадают под понятия, характеризующие известные соединения». Также в возражении отмечено, что в заявке [1] (пункт 13 формулы) описан способ получения соединений, основанный на том, что соединение общей формулы Ia подвергают реакции ацилирования, где агентом ацилирования является соединение формулы  $R^1_a\text{-OH}$  с получением соединения общей формулы Ib. Кроме того, лицо, подавшее возражение, отмечает, что композиции на основе соединений с фармацевтически приемлемыми носителями и эксципиентами, а также их применение для лечения инфекционных заболеваний также известны из заявки [1]. Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что объекты по п.п.1-8 формулы оспариваемого патента не являются новыми.

Относительно несоответствия оспариваемой группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении



отмечено, что решение, известное из заявки [1] является ближайшим аналогом оспариваемого изобретения. При этом в возражении сделан вывод о том, что оспариваемое изобретение является селективным изобретением по отношению к известному уровню техники [1]. По мнению лица, подавшего возражение, в формуле изобретения по оспариваемому патенту «нет никаких конкретных индивидуальных соединений, все они описаны общими понятиями через общую формулу». При этом в описании к оспариваемому патенту «нет никаких данных о новых неизвестных для этой группы свойствах в качественном или количественном отношении, так как известные соединения также проявляют противогрибковые свойства». На основании изложенного лицо, подавшее возражение делает вывод о том, все изобретения группы по оспариваемому патенту не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Второй экземпляр возражения в установленном порядке был направлен в адрес патентообладателя, отзыв от которого поступил на заседании коллегии 28.11.2018.

В отзыве патентообладателем отмечено, что в описании к оспариваемому патенту приведены средства и методы, с помощью которых осуществляется изобретение по п.п.1-5 формулы. Так, в описании оспариваемого патента приведена общая схема синтеза соединений, охарактеризованных в п.1 формулы, а также приведены 124 примера получения конечных соединений с различными по химической природе радикалами. Патентообладатель не согласен с мнением лица, подавшего возражение о том, что структура соединений не ясна и отсутствуют сведения о получении ряда соединений формулы I. В подтверждение данной позиции в отзыве на возражение приведена таблица 1 (с.5-11 отзыва). По мнению патентообладателя, таблица 1 иллюстрирует, что для всех отмеченных в возражении значений радикала R1 представлены данные, подтверждающие их получение. Кроме того, в возражении отмечено, что в описании к оспариваемому патенту приведены четкие определения терминов «низший» и

«высший», которые понятны специалисту в данной области и соответствуют номенклатуре химических соединений. Заявка [4], по мнению патентообладателя приведена лишь в поддержку мнения лица, подавшего возражение что «в уровне встречаются разные трактовки этих понятий».

Патентообладатель, в своем отзыве, указывает на то, что соединения по п.2 формулы получены в примере 24 (основной продукт) и примерах 22 и 110. Соединения по п.3 формулы получены в примерах 23, 40, 41, 65 и 66, а также в примерах 25, 98, 90, 52 и 95. Соединения по п.4 формулы получены в примере 11, 85, 91 и 122.

Кроме того, по мнению патентообладателя, сведения о противогрибковой активности приведены для 31 соединения по оспариваемому патенту. Что является достаточным основанием для того, «чтобы убедиться в том, что при осуществлении изобретения возможна реализация указанного назначения» по п.п.6-8 формулы изобретения по оспариваемому патенту. По мнению патентообладателя учебник [2] отражает лишь общие тенденции в области фармакологии, которые могут нарушаться в случае тех или иных видов активности и «однозначное установление взаимосвязи между конкретной функциональной группой и ее влиянием на различные виды биологической активности вряд ли возможно». Патентообладатель счел необходимым представить монографию [3] в полном объеме, поскольку полагает, что релевантная часть, представленная в возражении позволяет трактовать информацию не так как она изложена в целом. А именно патентообладатель отмечает, в частности, отмечает, что в монографии [3] речь идет о полипептидах (грамицидин S), имеющих существенные структурные отличия по отношению к полипептидам по оспариваемому патенту, которые делает неправомерными какие-либо аналогии между этими различными представителями класса полипептидов. В усиление своей позиции, патентообладатель отмечает, что активность грамицидина, заключается в его эффективности в отношении грамположительных бактерий (стафилококков и стрептококков), в то время

как соединения по оспариваемому патенту обладают противогрибковой активностью, следовательно, отличаются и биологические мишени, и механизм воздействия на них.

Патентообладатель не согласен с мнением лица, подавшего возражение о том, что заявка [1] раскрывает соединения, подпадающие под объем формулы оспариваемого патента. В подтверждение данного мнения патентообладатель приводит таблицу 2, в которой представляет сравнительный анализ признаков независимого п.1 формулы по оспариваемому патенту, которые согласно возражению попадают под понятия, характеризующие известные соединения. По мнению патентообладателя результаты анализа подтверждают отсутствие перекрывания признаков общих структурных формул. В возражении также подчеркнута, что зависимые п.п. 2-4 и 7-8 формулы включают все признаки независимого п.1, которому они подчинены и также соответствуют условию патентоспособности «новизна».

В отзыве отмечено, что изобретения по независимым п.п.5 и 6 основаны на соединениях по п.1, следовательно, как и п.1 формулы, изобретения являются новыми.

Относительно не соответствия заявленной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень», в возражении отмечено следующее.

Соединения по оспариваемому патенту существенным образом отличаются по структуре ацильного радикала (радикал R1) от соединений, описанных в заявке [1], о чем, по мнению патентообладателя, свидетельствует сравнительная таблица 2. Кроме того, наличие у соединений по оспариваемому патенту противогрибковой активности, тем более, в узком диапазоне для всего спектра ацильных радикалов по оспариваемому патенту (31 экспериментальный пример) не может с очевидностью вытекать из известного уровня техники заявки [1]. Пункты 2-8 формулы оспариваемой группы изобретений основаны на соединениях по независимому п.1.

следовательно, также соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В качестве дополнительного подтверждения своей позиции, патентообладатель представил заключение специалиста Куликова А.В. (далее – [5]) в качестве дополнительного подтверждения соответствия оспариваемого патента условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень».

На заседании коллегии 04.12.2018 лицо, подавшее возражение представило письменный комментарий на отзыв патентообладателя, в котором доводы по существу повторяют доводы, изложенные в возражении.

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

С учетом даты подачи заявки (29.09.1995), по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности группы изобретений по данному патенту включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 № 3517-1 (далее – Закон) и Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные Роспатентом 20 сентября 1993 года, зарегистрированные в Минюсте РФ 05 ноября 1993 года, рег. № 386, (далее – Правила).

Согласно пункту 1 статьи 4 Закона изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники.

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

Уровень техники включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.1 Правил при установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.1 Правил проверяется описаны ли в первичных материалах заявки средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в независимом пункте формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в материалах заявки допустимо, чтобы указанные средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения.

В соответствии с подпунктом (3) пункта 3.2.4.5 Правил если изобретение относится к группе (ряду) новых индивидуальных химических соединений с установленной структурой, описываемых общей структурной формулой, подтверждается возможность получения всех соединений группы (ряда) путем приведения общей схемы способа получения, а также примера получения конкретного соединения группы (ряда), а если группа (ряд) включает соединения с разными по химической природе радикалами - примеров, достаточных для подтверждения возможности получения соединений с этими разными радикалами.

Для полученных соединений приводятся также их структурные формулы, подтвержденные известными методами, физико-химические константы, доказательства возможности реализации указанного назначения с подтверждением такой возможности в отношении некоторых соединений с разными по химической природе радикалами.

Если новые соединения являются биологически активными, приводятся показатели активности и токсичности для этих соединений, а в случае необходимости - избирательности действия и другие показатели.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.1 Правил следует убедиться в том, что в случае осуществления изобретения по любому из пунктов формулы действительно возможна реализация указанного заявителем

назначения.

В соответствии с подпунктом (3) пункта 19.5.1 Правил если установлено, что на дату приоритета изобретения соблюдены все указанные требования, изобретение признается соответствующим условию промышленной применимости. При несоблюдении хотя бы одного из указанных требований делается вывод о несоответствии изобретения условию промышленной применимости.

В соответствии с подпунктом (1) пункта 3.3.1. Правил формула изобретения предназначается для определения объема правовой охраны, предоставляемой патентом.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 3.3.1. Правил формула изобретения должна быть полностью основана на описании, т.е. характеризовать изобретение понятиями, содержащимися в его описании.

В соответствии с подпунктом (3) пункта 3.3.1. Правил формула изобретения признается выражающей его сущность, если она содержит совокупность его существенных признаков, достаточную для достижения указанного заявителем технического результата.

В соответствии с подпунктом (4) пункта 3.3.1. Правил признаки изобретения выражаются в формуле изобретения таким образом, чтобы обеспечить возможность их идентифицирования, т.е. однозначного понимания специалистом на основании известного уровня техники смыслового содержания понятий, которыми эти признаки охарактеризованы.

В соответствии с подпунктом (4) пункта 19.4 Правил если формула изобретения включает признак, выраженный общим понятием, устанавливается правомерность его использования в соответствии с подпунктом (6) пункта 3.3.1 настоящих Правил.

В соответствии с подпунктом (6) пункта 3.3.1. Правил если возможно несколько форм реализации признака, обеспечивающих в совокупности с другими существенными признаками получение одного и того же технического результата, признак целесообразно выражать общим понятием, охватывающим

выявленные формы реализации. Если такое понятие отсутствует или оно охватывает и такие формы реализации признака, которые не обеспечивают получение указанного технического результата, что делает обобщение неправомерным, то признак может быть выражен в виде альтернативных понятий, характеризующих разные формы реализации признака.

В соответствии с подпунктом (4) пункта 19.5.2 Правил проверка новизны изобретения проводится в отношении всей совокупности признаков, содержащихся в независимом пункте формулы изобретения.

В соответствии с подпунктом (3) пункта 19.5.2 Правил изобретение не признается соответствующим условию новизны, если в уровне техники выявлено средство, которому присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в предложенной заявителем формуле изобретения.

В соответствии с подпунктом (5) пункта 19.5.2 Правил если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, содержащей зависимые пункты, соответствует условию новизны, то анализ уровня техники в отношении зависимых пунктов не проводится.

В соответствии с подпунктом (1) пункта 19.5.3 Правил изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

Проверка изобретательского уровня проводится в отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте формулы, и включает:

- определение наиболее близкого аналога в соответствии с пунктом 3.2.4.2 настоящих Правил;
- выявление признаков, которыми отличается заявленное изобретение от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);
- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения.

В соответствии с пунктом 3.2.4.2 Правил в качестве аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений,

ставших общедоступными до даты приоритета изобретения, характеризуемое совокупностью признаков, сходной с совокупностью существенных признаков изобретения. При описании группы изобретений сведения об аналогах приводятся для каждого изобретения в отдельности.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.3 Правил изобретение признается соответствующим условию изобретательского уровня, если не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

В соответствии с подпунктом (4) пункта 19.5.3 Правил условию изобретательского уровня соответствуют, в частности:

- способы получения новых индивидуальных соединений (класса, группы) с установленной структурой;

- индивидуальное соединение, подпадающее под общую структурную формулу группы известных соединений, но не описанное как специально полученное и исследованное, и при этом проявляющее новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении (селективное изобретение).

В соответствии с подпунктом (8) пункта 19.5.3 Правил если заявленное изобретение, охарактеризованное в многозвенной формуле, содержащей зависимые пункты, признано соответствующим условию изобретательского уровня в отношении независимого пункта, дальнейшая проверка в отношении зависимых пунктов формулы не проводится.

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

Анализ доводов возражения и отзыва патентообладателя, касающихся соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условиям



патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень» показал следующее.

Изобретение по независимому п.1 формулы оспариваемого патента относится к группе индивидуальных химических соединений, а именно к полипептидным соединениям с установленной структурой, описываемым общей структурной формулой I. В общей структурной формуле все заместители, кроме радикала R1 имеют конкретные значения, которые непосредственно отражены в самой структурной формуле. Заместитель R1 присоединен к циклическому пептидному ядру через аминогруппу (-NH-) образуя пептидную/амидную связь (-NH-CO-), при этом значения радикала R1 перечислены в вышеприведенной формуле группы изобретений.

Для определения значений радикала R1 используются термины «низший» и «высший» по отношению к химическим группам алкил, алкокси и их замещенным производным. Термины «низший» и «высший» по отношению к упомянутым группам с указанием их конкретных значений раскрыты в описании к оспариваемому патенту (с.6, левая колонка, строки 14-49). Так, термин «низший» предполагает содержание в радикале от 1 до 6 атомов углерода (C1-C6), а термин «высший» от 7 до 20 атомов углерода (C7-C20), при этом предпочтительным для «высшего алкокси» указано содержание атомов углерода C7-C14, более предпочтительно C7-C8, в случае «высшего алкила» более предпочтительно C7-C10.

Заявка [4] (см. реферат) описывает понятие «низший» как, содержащее от 1 до 8 атомов углерода. Однако, в заявке [4] упомянутая информация является трактовкой авторов заявленного в ней изобретения, не относится к научно-технической справочной информации и не опровергает иных трактовок номенклатуры химических соединений.

Значения радикала R1 приведены в независимом п.1 формулы, при этом значения заместителей выраженных с помощью обобщенных понятий раскрыты в описании к оспариваемому патенту (см. с. 5-16) и являются ясными для специалиста в данной области техники.

Что касается способа получения полипептидных соединений по независимому п.5 формулы, то он проиллюстрирован на общей схеме, раскрытой в описании к оспариваемому патенту (см. с.70) и подтверждён экспериментально. Так, в описании к оспариваемому патенту приведено 346 примеров получения промежуточных соединений, 117 примеров получения исходных соединений для синтеза конечного вещества и 124 примера получения конечного полипептидного соединения. Для каждого примера приведены физико-химические характеристики. Для полипептидных соединений по п.1 формулы группы изобретений приведены их структурные формулы (см. формула I, с.71-88 таблица 1).

Полипептидные соединения по оспариваемому патенту проявляют противомикробную, в частности противогрибковую активность. Так, в описании к оспариваемому патенту приведена методика испытаний на биологическую активность (см. с.17, 67), результаты испытаний представлены для 31 соединения группы с разными по химической природе радикалами (см. с.17 испытание 1, с.89 таблица 2). Назначение соединений по п.1 формулы оспариваемого патента отражено в независимом п.6 формулы, раскрывающем фармацевтическую композицию и в зависимых п.п.7-8 формулы. Фармацевтическая композиция, в частности, наполнители композиции, дозировка активного вещества и методы ее введения в организм пациента также раскрыты в описании к оспариваемому патенту (см. с.17 правая колонка строки 26-65, с.18 левая колонка строки 1-41).

Учебник [2] и монография [3] отражают общий уровень техники, так учебник [2] отражает общие тенденции в области фармакологии, а монография [3] описывает полипептидные соединения, имеющие существенные структурные отличия по отношению к полипептидам по оспариваемому патенту.

С учетом изложенного, можно констатировать, что в описании к оспариваемому патенту приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в

независимых п.п.1, 5 и 6 формулы группы изобретений с реализацией указанного назначения.

Кроме того, можно согласиться в утверждении патентообладателя о том, что в примерах 24, 22 и 110 получены полипептидные соединения соответствующие признакам, указанным в зависимом п.2 формулы группы изобретений. Соответственно, в примерах 23, 25, 40, 41, 52, 65, 66, 90, 95 и 98 получены полипептидные соединения соответствующие признакам, раскрытым в зависимом п.3 формулы, а в примерах 11, 85, 91 и 122 получены соединения соответствующие признакам, включенным в зависимый п.4 формулы группы изобретений.

В отношении соответствия оспариваемой группы изобретений условию патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень» установлено следующее.

В заявке [1], раскрыты полипептидные соединения общей формулы I, где радикалы могут иметь следующие значения:

- R1 представляет собой ацильную группу;
- R2 представляет собой гидроксильную группу;
- R3 представляет собой гидроксисульфонилокси группу;
- R4 представляет собой кабамоил,

при условии, что R1 не является пальмитоилом (см.п.1 формулы).

Здесь следует отметить, что значение радикала R1 в заявке [1] выражено в очень широкой степени обобщения признака (ацильная группа), характеризующего структуру соединений. Следовательно, можно констатировать, что полипептидные соединения по оспариваемому патенту подпадают под общую структурную формулу группы известных из заявки [1] соединений, в случае, когда значения радикалов R1-R4, такие как упомянуто выше.

Вместе с тем, при обращении к представленному описанию к заявке [1] установлено, что ацильные радикалы в значении R1 имеют принципиальные структурные отличия по отношению к указанным в независимом п.1 формулы

оспариваемого патента значениям соответствующего радикала. Все соединения по оспариваемому патенту получены посредством образования пептидной/амидной связи (...-NH-CO-...) между полипептидным циклом и радикалом R1 т.е. все соединения имеют в своей структуре C=O группу, в отличие от соединений известных из заявки [1].

Действительно, в заявке [1] соединения по оспариваемому патенту не описаны как специально полученные и исследованные, следовательно, оспариваемое изобретение является «селективным» по отношению к известному уровню техники.

Таким образом, можно сделать вывод, что соединения по независимому п.1 и зависимым п.п.2-4, 7-8 оспариваемого патента являются новыми. Следовательно, способ получения новых соединений по п.5 формулы оспариваемого патента и фармацевтическая композиция по п.6 формулы на основе таких соединений также являются новыми.

В отношении соответствия изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» необходимо отметить следующее.

Полипептидные соединения по оспариваемому патенту являются ингибиторами фермента  $\beta$ -1,3 глюкансинтазы, обладают противомикробной, в частности противогрибковой активностью и характеризуются минимальной ингибирующей концентрацией в отношении микроорганизма *Candida albicans* FP-633 (реферат, с.17, с.67, таблица 2) в диапазоне от 0,05 до 0,39 мкг/мл.

В решении по заявке [1] соединения обладают антимикробной активностью.

Так же установлено, что испытанию подвергалось только одно соединение, известное из заявки [1], а именно соединение из примера 12. Как уже указывалось, соединение по примеру 12 заявки [1] имеет существенные структурные отличия приведенные выше, по отношению к оспариваемым соединениям, и, кроме того, упомянутое соединение протестировано в иных условиях и в отношении иного штамма патогенного микроорганизма *Candida albicans* YU-1200. Следовательно, проведение такого сравнения некорректно в

силу использования различных методов исследования и различных штаммов микроорганизмов выбранных для проведения данных исследований.

Вместе с тем, близкими по структуре к соединению 12 согласно заявке [1] являются соединения по оспариваемому патенту полученные в примерах 81 и 82, которые в результате тестирования показывают значительно лучшую противогрибковую активность (в несколько раз).

Данные обстоятельства обуславливают вывод о том, что соединения по независимому п.1 и зависимым от него п.п. 2-4, 7-8 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту имеют преимущества как в качественном и количественном отношении по сравнению с известным уровнем техники [1].

Изобретение по п.5 раскрывает способ получения соединений формулы I по п.1, изобретение по п.6 раскрывает фармацевтическую композицию на основе соединений формулы I по п.1. Отличительным признаком объектов по п.п.5-6 формулы являются новые полипептидные соединения общей структурной формулы I.

Доводов о несоответствии изобретений по независимым п.5 и 6 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении не представлено. Вместе с тем, в возражении не приведено источников информации свидетельствующих об известности упомянутых выше отличительных признаков (иное строение полипептидных соединений) в уровне техники и, соответственно, известности их влияния на технический результат.

Таким образом, возражение не содержит доводов, позволяющих признать группу изобретений по оспариваемому патенту несоответствующей условиям патентоспособности (п. 1 ст. 4 Закона).

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

**отказать в удовлетворении возражения, поступившего 31.07.2018, патент Российской Федерации на изобретение № 2165423 оставить в силе.**