

Палата по патентным спорам Роспатента (далее – Палата по патентным спорам) в соответствии с Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56 и зарегистрированными в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение компании KRKA, Словения (далее – лицо, подавшее возражение) против выдачи патента РФ № 2203054, при этом установлено следующее.

Патент РФ № 2203054 на изобретение "Твердые оральные дозируемые формы на основе вальсартана" выдан по заявке №99101056/14 с приоритетом от 27.01.1999 на имя НОВАРТИС АГ, Швейцария со следующей формулой изобретения:

"1. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма, отличающаяся тем, что включает: а) действующее вещество, содержащее эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, и б) фармацевтически приемлемые добавки, пригодные для изготовления твердых оральных дозируемых форм прессованием, при этом количество действующего вещества составляет более 35 мас.% в пересчете на общую массу твердой оральной дозируемой формы.

2. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по п.1, где количество действующего вещества составляет более 50 мас.%.

3. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по п.1 или 2, где количество действующего вещества составляет от 57 до 62 мас.%.

4. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из предыдущих пунктов, где действующее вещество полностью состоит из вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли в дозе приблизительно от 10 до 250 мг.

5. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из предыдущих пунктов, где диапазон доз составляет до 40 до 160 мг.

6. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из предыдущих пунктов, где доза равна 40 мг, 80 мг или 160 мг.

7. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из пп.1-3, где действующее вещество состоит из эффективного количества вальсартана или

его фармацевтически приемлемой соли и эффективного количества гидрохлортиазида (ГХТА).

8. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма, отличающаяся тем, что включает в качестве терапевтических агентов эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, эффективное количество гидрохлортиазида (ГХТА) и фармацевтически приемлемые добавки, пригодные для изготовления твердых оральных дозируемых форм прессованием.

9. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по п.7 или 8, включающая стандартную дозу вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, составляющую приблизительно от 10 до 250 мг, и стандартную дозу ГХТА, составляющую приблизительно от 6 до 60 мг.

10. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из пп.7-9, включающая стандартную дозу вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, составляющую приблизительно от 50 до 100 мг, и стандартную дозу ГХТА, составляющую приблизительно от 10 до 30 мг.

11. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из пп.7-9, включающая стандартную дозу вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, составляющую приблизительно от 80 до 160 мг, и стандартную дозу ГХТА, составляющую 12,5 мг или 25 мг.

12. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из предыдущих пунктов, которая включает микрокристаллическую целлюлозу в качестве фармацевтически приемлемой добавки.

13. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из предыдущих пунктов, которая включает сшитый поливинилпирролидон (ПВП) в качестве фармацевтически приемлемой добавки.

14. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по п.12, где количество микрокристаллической целлюлозы составляет от 15 до 25 мас. %.

15. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по п.13, где количество сшитого ПВП составляет от 10 до 30 мас. %.

16. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из

предыдущих пунктов в форме таблетки.

17. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма по любому из предыдущих пунктов в форме драже.

18. Способ изготовления твердой оральной дозируемой формы по любому из предыдущих пунктов, отличающийся тем, что включает следующие этапы: I) действующее вещество и фармацевтически приемлемые добавки измельчают; II) смесь измельченного действующего вещества и добавок прессуют с получением компримата; III) компримат превращают в гранулят и IV) гранулят прессуют с получением твердой оральной дозируемой формы.

19. Способ по п.18, где прессование II) осуществляют с использованием методов валкового уплотнения или штамповки.

20. Способ по п.18 или 19, где стадию III) осуществляют путем просеивания или размалывания компримата.

21. Способ по любому из пп.18-20, где гранулят прессуют без предварительной классификации по размерам.

22. Способ по любому из пп.18-21, где гранулят изготавливают под давлением от 25 до 65 кН.

23. Комприматы, полученные путем валкового уплотнения или штамповки по п.19.

24. Гранулят, полученный способом по п.18.

25. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма, изготовленная способом по любому из пп.18-22.

26. Спрессованная твердая оральная дозируемая форма, как она определена со ссылкой на любой из примеров".

Против выдачи указанного патента в соответствии с подпунктом 1) пункта 1 статьи 29 Патентного закона Российской Федерации от 23.09.92 №3517-I (далее – Закон) в Палату по патентным спорам было подано возражение, поступившее в федеральный орган исполнительной власти по интеллектуальной собственности 02.09.2005, мотивированное несоответствием группы изобретений условиям патентоспособности "новизна" и "изобретательский уровень".

К возражению в качестве подтверждения данных доводов приложены следующие источники информации:

- патент US 5399578 (дата выдачи 21.03.1995) (далее - [1]);
- Fujimura, Yoko et al., Yakuri to Chiryō, 1995, 23 (12), 3241-7; опубликована в Chemical Abstract, 124: 220073; 1996 (далее - [2]);
- Grun et al, Euriopean Heart Journal Supplements, Vol.16, p.61; 1995 (далее - [3]);
- Pharmaceutical Dosage Forms: Tablets Vol. 1, pp.239, 241; 1989 (далее - [4]);
- Технология лекарств, Муравьев И.А., М., 1980, Том 1, с. 334, 375-377, 385 (далее - [5]);
- Технология лекарственных форм, под ред. Л.А.Ивановой, М., 1991, Том 2, с. 142, 157-159 (далее - [6]);
- Англо-русский словарь по химии и химической технологии, под ред. В.В.Кафарова, с. 332, 398, 470 (далее - [7]);
- Англо-русский химико-технологический словарь, под ред. В.В.Михайлова, с. 433, 592 (далее - [8]).

Лицом, подавшим возражение, в отношении независимого пункта 1 формулы изобретения отмечено, что из патента [1] известны твердые фармацевтические дозируемые формы вальсартана. В патенте [1] описано получение таблеток, которые представляют собой спрессованную твердую оральную дозируемую форму, массой 145 мг, содержащих 50 мг активного вещества, в частности вальсартана - (S)-N-(1-карбокси-2-метил-проп-1-ил)-N-[2'-1H-тетразол-5-ил)бифенил-4-ил-метил]аминa, количество которого составляет 35,33 % - 35,71 % в пересчете на общую массу твердой оральной дозируемой формы. В указанном патенте [1] раскрыты также и способ приготовления упомянутых твердых спрессованных оральных дозированных форм.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, из приведенного источника информации следует, что изобретение по независимому пункту 1 формулы изобретения не соответствует условию патентоспособности "новизна". Соответственно, и зависимые пункты 2-5 формулы изобретения также, по мнению лица, подавшего возражение, не соответствуют условию патентоспособности "новизна".

Дополнительно в возражении обращается внимание и на то, что под техническим результатом изобретения по оспариваемому патенту подразумевается само получение таблеток вальсартана. Однако, по мнению лица, подавшего возражение, спрессованная оральная дозированная форма, охарактеризованная в общем виде как содержащая вальсартан (в п.8 – дополнительно ГХТА), с указанием количества активного веществ (в п.1 количество указано, а независимом пункте 8 количество активного вещества не указано) и любые подходящие добавки, является очевидной из уровня техники, поскольку для специалиста явным образом следует то, что «при наличии в арсенале фармации приемов и методов приготовления таблеток, рассчитанных на субстанции с разнообразными свойствами, и широкого ряда вспомогательных добавок, из которых можно выбирать любые, возможно приготовить таблетки вальсартана».

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, спрессованная оральная дозируемая форма, охарактеризованная как в независимом пункте 1, так и в независимом пункте 8 формулы изобретения по оспариваемому патенту в общем виде, явным образом следует для специалиста из уровня техники и не соответствует условию патентоспособности "изобретательский уровень".

В возражении также проанализирована известность из уровня техники влияния отличительных признаков изобретения на технический результат и отмечено следующее:

- влияние отличительного признака "действующее вещество, содержащее эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли" на возможность получения таблеток, содержащих вальсартан, очевидно;

- конкретные добавки в независимых пунктах формулы изобретения по оспариваемому патенту не указаны, а влияние "фармацевтических добавок, пригодных для изготовления дозируемых форм прессованием", на технический результат – получение спрессованных форм, также известно из уровня техники.

При этом в описании изобретения по оспариваемому патенту (с.4, левая колонка, строки 48-66) раскрыто то, что специалист сам может выбирать любые добавки, руководствуясь известной в фармации информацией о том, какие добавки подходят для получения таблеток. То есть, известны спрессованные

твердые оральные дозируемые формы, которые приготовлены с добавками, способствующими приготовлению оральных дозируемых форм прессованием. "Таким образом, влияние признака пунктов 1 и 8 формулы изобретения по оспариваемому патенту, относящегося к добавкам, на достижение указанного технического результата известно, поэтому он не сообщает заявленному изобретению изобретательского уровня."

В возражении относительно отличительного признака "количество действующего вещества составляет более 35 мас.% в пересчете на общую массу твердой оральной дозируемой формы" пункта 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту отмечено то, что данный признак "как раскрыто в описании изобретения по оспариваемому патенту, не способствует достижению технического результата – возможности получения спрессованных оральных дозируемых форм".

Следовательно, независимый пункт 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту не соответствует и условию патентоспособности "изобретательский уровень".

Относительно независимого пункта 8 формулы изобретения по оспариваемому патенту в возражении отмечено то, что "дозირуемая форма, характеризующаяся такими признаками, как наличие вальсартана и гидрохлортиазида (ГХТА) в качестве действующих веществ, а также содержанием любых фармацевтически приемлемых добавок, пригодных для приготовления спрессованных дозируемых форм", также не соответствует условию патентоспособности "изобретательский уровень". То, что приготовление таблеток с гидрохлортиазидом (ГХТА) связано с трудностями, в оспариваемом патенте не упоминается. Поэтому, по мнению лица, подавшего возражение, вышесказанное об очевидности из уровня техники спрессованных форм по независимому пункту 1 формулы изобретения верно и для спрессованных форм по независимому пункту 8 формулы изобретения. Что касается изобретательского уровня лечения именно комбинацией вальсартана и ГХТА, то, по мнению лица, подавшего возражение, эффект этой комбинации известен из источника информации [2].

При этом при условии включения известных (источники информации [1], [3] и [5]) признаков зависимых пунктов 2 - 7 и 9 - 17 формулы изобретения в

независимые пункты 1 и 8 формулы изобретения, изобретение по оспариваемому патенту также не будет иметь изобретательского уровня.

Что касается независимого пункта 18 формулы изобретения по оспариваемому патенту, то в возражении отмечено следующее. Данный пункт "относится к способу изготовления твердой оральной дозируемой формы по любому из предыдущих пунктов и включает несколько этапов". Однако, способ, характеризуемый последовательностью стадий, указанных в данном пункте, является одним из традиционных путей получения таблеток и описан во многих источниках информации, в частности в источнике информации [6]. На схеме 9.1 источника информации [6] способ получения таблеток с сухим гранулированием содержит все стадии, которые указаны в пункте 18 формулы изобретения по оспариваемому патенту. Следовательно, по мнению лица, подавшего возражение, независимый пункт 18 формулы изобретения по оспариваемому патенту также не соответствует условию патентоспособности "изобретательский уровень".

В отношении пунктов 19 и 23 формулы изобретения по оспариваемому патенту в возражении отмечено то, что указанный в них признак "штамповка" отсутствовал в первоначальных материалах заявки. Термин "slugging", указанный на английском языке в первоначальных материалах заявки, согласно словарю [7] переводится как "комкование зерен (сыпучего материала)", или, согласно словарю [8] как "агрегирование зерен сыпучего материала", в то время как русский термин "штамповка" соответствует английским терминам "pressing" (словарь [7]) или "mo(u)lding" (словарь [8]). Данное обстоятельство, по мнению лица, подавшего возражение, является в соответствии со статьей 29 Закона причиной признания патента недействительным.

Приемы выполнения стадий заявленного способа, уточненные в зависимых пунктах 19 - 21, также "не сообщают запатентованному способу изобретательского уровня".

Признак "прессование (II) осуществляют с использованием методов валкового уплотнения или штамповки" зависимого пункта 19 формулы изобретения также известен, так как приемы уплотнения известны для уплотнения порошков при получении таблеток из источника информации [6]. Поскольку влияние признаков зависимого пункта 19 формулы изобретения на получение

таблетки лекарственного вещества известно, применение указанных приемов не сообщает запатентованному способу получения спрессованных форм вальсартана изобретательского уровня.

В возражении также отмечено то, что указанное в зависимом пункте 20 формулы изобретения осуществление "стадии (III)" "путем просеивания или размалывания компримата" также известно из уровня техники (источник информации [6]) и является очевидным для получения таблеток вальсартана.

Прессование гранулята "без предварительной классификации по размерам" в зависимом пункте 21 формулы изобретения также явным образом следует для специалистов, поскольку очевидно пробовать прессовать гранулят без просеивания, чтобы сэкономить время и мощности на этой операции.

Относительно признака "гранулят изготавливают под давлением от 25 до 65 кН" зависимого пункта 22 формулы изобретения в возражении отмечено, что в описании изобретения указано на то, что в данном интервале "следует использовать минимальную уплотняющую силу". Однако указанный интервал сил не сообщает предложенному способу изобретательского уровня. В патенте "не идентифицирован, какое разложение таблеток достигается", поскольку указание, что "разложение происходит в шесть раз быстрее" без указания, с чем сравнивают, не дает такой информации, и, в оспариваемом патенте не приведены данные, подтверждающие разложение полученных таким способом таблеток. Более того, таблетки не обладающие разложением, которое в шесть раз быстрее какого-то другого значения времени разложения, но показывающие разложение, достаточное для того, чтобы таблетка удовлетворяла требованиям Фармакопеи, в той же степени пригодны для лечения. В самом оспариваемом патенте также указано, что упомянутый интервал сил назван "предпочтительным", то есть можно применять и другие значения силы уплотнения, не говоря уже о традиционных добавках-разрыхлителях, для получения таблеток с фармакологически приемлемой скоростью разложения. Таким образом, данный признак не влияет на достижение технического результата – получение таблеток вальсартана.

В возражении также отмечено то, что в оспариваемом патенте предлагается подбирать минимальную силу в указанном интервале, хотя конкретные минимальные значения силы уплотнения для получения всех вариантов



заявленной дозируемой формы в оспариваемом патенте не предложено. Тем не менее, поскольку "специалистам известно как подбирать минимальную силу уплотнения, чтобы получить таблетки с желаемой распадаемостью (источник информации [5]), подбор подходящего значения силы уплотнения, и в частности нахождение интервала, указанного в пункте 23 формулы изобретения, является рутинной процедурой при приготовлении таблеток". Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, при условии включения пункта 23 формулы изобретения в независимый пункт 18 формулы изобретения, "не сообщил бы изобретению по пункту 18 формулы изобретения изобретательского уровня".

Пункт 23 формулы изобретения относится к комприматам, полученным путем валкового уплотнения или штамповки по пункту 19 формулы изобретения. Поскольку приготовление комприматов вальсартана, охарактеризованное в пункте 19 формулы изобретения, явным образом следует из уровня техники и не имеет изобретательского уровня, полученный продукт очевиден из уровня техники и не соответствует критерию патентоспособности "изобретательский уровень".

Пункт 24 формулы изобретения относится к грануляту, полученному способом по пункту 18 формулы изобретения. Ввиду того, что получение гранулятов, содержащих вальсартан, как охарактеризовано в пункте 18 формулы изобретения, явным образом следует из уровня техники и не имеет изобретательского уровня, полученный таким способом гранулят не соответствует критерию "изобретательский уровень".

Пункт 25 формулы изобретения относится к спрессованной твердой оральной дозируемой форме, изготовленной способом по любому из пунктов 18-22 формулы изобретения. Поскольку указанный способ явным образом следует из уровня техники и не имеет изобретательского уровня, изготовленная этим способом твердая оральная дозируемая форма также не соответствует критерию патентоспособности "изобретательский уровень".

Пункт 26 формулы изобретения представляет собой "сводный пункт, который характеризует объект лишь ссылкой на множество примеров. такая характеристика объекта в формуле изобретения запрещена Правилами ИЗ". Кроме того, как показано выше, дозируемые формы, полученные в примерах, не соответствуют критерию патентоспособности "изобретательский уровень".

На основании вышеизложенного лицо, подавшее возражение, просит признать патент РФ №2203054 на изобретение недействительным полностью ввиду несоответствия его критериям патентоспособности "новизна" и "изобретательский уровень".

Копия возражения была направлена в установленном порядке патентообладателю.

К заседанию коллегии, назначенному на 05.04.2006, патентообладателем был представлен отзыв, в котором было отмечено следующее:

- оспариваемое изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 1 формулы изобретения соответствует условию патентоспособности "новизна", так как в уровне техники не выявлено средство, которому присущи признаки, идентичные всем признакам оспариваемого изобретения;

- признаки, содержащиеся в зависимых пунктах 2 - 6 формулы изобретения, не являются функционально независимыми и должны быть рассмотрены только в совокупности с признаками, характеризующими действующее вещество, и, учитывая то, что активный компонент не выявлен в уровне техники, то охарактеризованные в пунктах 2 -6 частные формы выполнения изобретения по пункту 1 оспариваемого патента соответствуют условию патентоспособности "новизна";

- лицо, подавшее возражение, не установило и известность влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками охарактеризованных в независимых пунктах 1 и 8 формулы изобретения, на указанный в изобретении технический результат, следовательно независимый пункт 1 формулы изобретения соответствует условию патентоспособности "изобретательский уровень";

- признаки, содержащиеся в зависимых пунктах 2 - 7, 9 - 17 формулы изобретения, не являются функционально независимыми и должны быть рассмотрены только в совокупности с признаками, характеризующими действующее вещество, и, учитывая то, что активный компонент не выявлен в уровне техники, то охарактеризованные в указанных пунктах частные формы выполнения изобретения по пункту 1 оспариваемого патента соответствуют условию патентоспособности "изобретательский уровень";

- целый ряд признаков независимого пункта 18 формулы изобретения не

выявлен в возражении из уровня техники, в частности, состав и количественное содержание действующего компонента, и следовательно, в возражении отсутствует обоснование несоответствия независимого пункта 18 формулы изобретения условию патентоспособности "изобретательский уровень";

- признаки, охарактеризованные в пунктах 19 - 21 формулы изобретения не очевидны из уровня техники, так как они обеспечивают получение спрессованных оральных дозированных форм меньшего размера по сравнению с известными оральными формами с таким же действующим веществом;

- диапазон давлений для изготовления гранулята в зависимом пункте 22 формулы изобретения также не выявлен лицом, подавшим возражение;

- комприматы, гранулят и спрессованные твердые оральные дозируемые формы, охарактеризованные в пунктах 23 - 26 формулы изобретения, имеют изобретательский уровень ввиду того, что они изготовлены способом по пунктам 18 -22.

- действующее патентное законодательство не содержит специальных норм, запрещающих формулировку, указанную в пункте 26 формулы изобретения.

На основании изложенного, патентообладатель считает доводы, приведенные в возражении, необоснованными.

Коллегией Палаты по патентным спорам на заседании коллегии 05.04.2006 при рассмотрении возражения в отношении независимого пункта 1 формулы изобретения было установлено, что из патента [1] известны твердые фармацевтические дозируемые формы, включающие в качестве действующего вещества вальсартан в количестве более 35 мас% в пересчете на общую массу твердой оральной дозируемой формы (пример 93 из описания к патенту [1]), и фармацевтически приемлемые добавки, используемые для изготовления стандартных лекарственных форм.

При этом на с. 4 описания к изобретению по оспариваемому патенту указано, что действующее вещество представляет собой вальсартан, способ получения которого описан в противопоставляемом патенте [1].

Следовательно, изобретение по данному независимому пункту 1 формулы изобретения не соответствует условию патентоспособности "новизна".

Приняв во внимание то обстоятельство, что патентоспособность группы изобретений может быть констатирована только тогда, когда патентоспособны все изобретения группы, в соответствии с пунктом 4.9 Правил ППС заявителю была предоставлена возможность внести изменения в формулу изобретения.

Заседание коллегии по просьбе патентообладателя неоднократно переносилось, и было назначено на 15.08.2006.

К заседанию коллегии в корреспонденции от 17.05.2006 патентообладатель дополнительно представил измененную формулу изобретения и следующие соображения по мотивам возражения.

В пункты 1 и 8 формулы изобретения патентообладателем были добавлены признаки "спрессованная методом сухого гранулирования", и пункт 18 формулы изобретения (стадия II предложенного способа), в который добавлены следующие признаки "причем прессованию уплотнением подвергают сухую смесь измельченных компонентов".

На с.10 описания к изобретению указано, что "способ осуществляет в отсутствии воды, например, методом сухого прессования". Далее, на с. 10 отмечено, что "прессование для образования компримата требует уплотнения сухих измельченных компонентов". На с.12 описания к изобретению указано, что "компримат можно просеивать и размалывать с получением гранулята", затем полученный гранулят прессуют с получением твердой оральной дозируемой формы. Последняя стадия подробно охарактеризована на с.12 (последний абзац) - с.13 (последний абзац). Представленные в описании примеры 1-3 иллюстрируют приготовление твердых оральных дозируемых форм конкретного состава методом сухого гранулирования. Все полученные лекарственные формы с высокой загрузкой действующего вещества (53,3 мас% и 40 мас%) охарактеризованы по размерам. Максимальная длина таблетки (или диаметр) не превышает 15,3 мм.

Таким образом, по мнению патентообладателя, все дополнительно включенные в измененную формулу изобретения признаки в совокупности с остальными признаками формулы изобретения были раскрыты в первоначальных материалах заявки.

Дополнительно патентообладателем также приведены обоснования соответствия независимых пунктов 1, 8 и 18 измененной формулы изобретения

условию патентоспособности "промышленная применимость".

По мнению патентообладателя, в описании к изобретению указано, что твердая оральная дозируемая форма, включающая в качестве действующего вещества эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, предназначена для лечения застойной сердечной недостаточности и снижения уровня кровяного давления. Поскольку действующее вещество вальсартан и препараты на его основе хорошо известны из предшествующего уровня техники, то возможность реализации указанного выше назначения не может вызывать сомнений. Патентообладатель считает, что описание изобретения в полном объеме, включая примеры раскрывает и подтверждает возможность реализации предложенного изобретения, охарактеризованного в уточненной формуле изобретения.

Следовательно, по мнению патентообладателя, имеющиеся в описании сведения в достаточной мере подтверждают соответствие охарактеризованных в пунктах 1, 8 и 18 изобретений условию патентоспособности "промышленная применимость".

Относительно несоответствия независимого пункта 1 формулы изобретения условию патентоспособности "новизна" патентообладателем отмечено то, что в возражении указано то, что в примере 93 источника информации [1] раскрыта композиция для приготовления таблеток с покрытием, содержащих в качестве действующего вещества более 35 мас% вальсартана, и способ приготовления этих таблеток методом влажного гранулирования. Тем не менее, по мнению патентообладателя, в данном источнике «не раскрыта первая альтернатива (компонент (a) представляющий собой вальсартан или его фармацевтически приемлемую соль в эффективном количестве в сочетании с любым другим действующим веществом) независимого пункта 1 формулы изобретения». Что касается второй альтернативы (компонент (a) полностью состоит из вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли в эффективном количестве), то в источнике информации [1] не описан способ приготовления оральной дозированной формы, содержащей более 35 мас% вальсартана, методом сухого гранулирования.

Следовательно, изобретение по независимому пункту 1 соответствует

условию патентоспособности "новизна". Соответственно, охарактеризованные в зависимых пунктах 2 - 6 формулы изобретения частные формы выполнения изобретения по пункту 1 оспариваемого патента также соответствуют условию патентоспособности "новизна".

В источнике информации [2] описан способ лечения гипертонии методом комбинированной терапии, предусматривающим пероральное введение вальсартана, тиазида и нифедипина. В данном источнике информации не раскрыта спрессованная методом сухого гранулирования твердая оральная дозируемая форма, содержащая в качестве действующего вещества вальсартан в сочетании ГХТА.

В источнике информации [3] раскрыт способ лечения артериальной гипертонии методом комбинированной терапии, который предусматривает после первых 8 недель лечения вальсартаном (суточная доза 80 мг), дополнительное лечение ГХТА (суточная доза 12,5 мг). В данном источнике информации также не раскрыта спрессованная методом сухого гранулирования твердая оральная дозируемая форма, содержащая в качестве действующего вещества вальсартан в сочетании с ГХТА.

Следовательно, изобретение по независимому пункту 8 соответствует условию патентоспособности "новизна".

Ни в одном из источников информации [1] - [6] не раскрыт способ получения твердых оральных дозируемых форм, охарактеризованных в пунктах 1 и 8 методом сухого гранулирования. Следовательно, и способ по независимому пункту 18 формулы изобретения соответствует условию патентоспособности "новизна".

Что касается несоответствия запатентованного изобретения условию патентоспособности "изобретательский уровень", то патентообладатель отметил следующее.

"Вальсартан имеет низкую плотность, и поэтому представляет собой объемный и рыхлый материал (третий абзац с.2 описания к изобретению). Специалистам в данной области техники хорошо известно, что подобные вещества, рыхлые и легко сыпучие, очень трудно гранулировать, в особенности методом сухого гранулирования, условием применения которого является наличие

значительных сил сцепления между частицами (Pharmaceutical Dosage forms and drug delivery systems, Howard c. Ancel et al., 1999, p.213). Кроме того, как следует из противопоставленного источника информации [6], сухое гранулирование, как правило, применяется для того, чтобы улучшить сыпучесть исходного порошка. Применительно к оспариваемому изобретению необходимости в улучшении сыпучести нет, так как вальсартан изначально представляет собой сыпучий порошок. Поэтому на дату приоритета оспариваемого изобретения для гранулирования вальсартана использовали только методику влажного гранулирования. Это подтверждается сведениями, представленными в источнике информации [1] (примеры 92 и 93)."

Патентообладателем также отмечено, что "авторами изобретения по оспариваемому патенту неожиданно было обнаружено, что сухое гранулирование композиций, содержащих вальсартан, имеет целый ряд преимуществ по сравнению с общепризнанной традиционной методикой". Сухое гранулирование позволяет изготавливать твердые оральные дозируемые формы с высокой загрузкой вальсартана, имеющие меньшие размеры для заданного количества действующего вещества, чем любые известные композиции на его основе. Ни в одном из противопоставленных источников информации не содержится не только указаний, но и даже предположений о том, что известные методики изготовления оральных дозируемых форм, включающих вальсартан, можно модифицировать путем применения способа сухого гранулирования. Кроме того, в источнике информации [6] не указано, что упомянутая в нем методика сухого гранулирования может применяться для изготовления твердых оральных дозируемых форм с высокой загрузкой действующего вещества и с меньшими размерами для заданного количества действующего вещества.

Таким образом, по мнению патентообладателя, в предшествующем уровне техники отсутствуют доказательства того, что метод сухого гранулирования можно использовать для изготовления твердых оральных дозируемых форм, содержащих действующее вещество с низкой плотностью, для достижения указанного в описании изобретения технического результата (изготовления твердых оральных дозируемых форм с высокой загрузкой действующего вещества и с меньшими размерами для заданного количества действующего вещества).

Следовательно, группа изобретений, охарактеризованная в измененной формуле изобретения, соответствует условию патентоспособности "изобретательский уровень".

Дополнительно на заседании коллегии 15.08.2006 патентообладателем предложено внести некоторые корректировки (относительно приема осуществления способа в отсутствие воды) в измененную формулу изобретения, которая представлена в следующей редакции:

"1. Твердая оральная дозируемая форма, полученная способом, осуществляемым в отсутствие воды, включающим следующие стадии:

а) действующее вещество, содержащее эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, в количестве более 35 мас.% в пересчете на общую массу твердой оральной дозируемой формы, и фармацевтически приемлемые добавки измельчают,

б) смесь измельченного действующего вещества и добавок прессуют с получением компримата,

в) компримат превращают в гранулят и

г) гранулят прессуют с получением твердой оральной дозируемой формы.

2. Твердая оральная дозируемая форма по п.1, где количество действующего вещества составляет более 50 мас.%.

3. Твердая оральная дозируемая форма по п.1 или 2, где количество действующего вещества составляет от 57 до 62 мас.%.

4. Твердая оральная дозируемая форма по п.1, где действующее вещество полностью состоит из вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли в дозе приблизительно от 10 до 250 мг.

5. Твердая оральная дозируемая форма по п.4, где диапазон доз составляет до 40 до 160 мг.

6. Твердая оральная дозируемая форма по п.4, где доза равна 40 мг, 80 мг или 160 мг.

7. Твердая оральная дозируемая форма, полученная способом, осуществляемым в отсутствие воды, включающим следующие стадии:



а) эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, эффективное количество гидрохлортиазида (ГХТА) или его фармацевтически приемлемой соли, и фармацевтически приемлемые добавки измельчают,

б) смесь измельченных действующих веществ и добавок прессуют с получением компримата,

в) компримат превращают в гранулят и

г) гранулят прессуют с получением твердой оральной дозируемой формы.

8. Твердая оральная дозируемая форма по п.7, включающая стандартную дозу вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, составляющую приблизительно от 10 до 250 мг, и стандартную дозу ГХТА, составляющую приблизительно от 6 до 60 мг.

9. Твердая оральная дозируемая форма по п.7 или п.8, включающая стандартную дозу вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, составляющую приблизительно от 50 до 100 мг, и стандартную дозу ГХТА, составляющую приблизительно от 10 до 30 мг.

10. Твердая оральная дозируемая форма по п.7 или п.8, включающая стандартную дозу вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, составляющую приблизительно от 80 до 160 мг, и стандартную дозу ГХТА, составляющую приблизительно от 12,5 до 25 мг.

11. Твердая оральная дозируемая форма по п.1, которая включает микрокристаллическую целлюлозу в качестве фармацевтически приемлемой добавки.

12. Твердая оральная дозируемая форма по п.1, которая включает сшитый поливинилпирролидон (ПВД) в качестве фармацевтически приемлемой добавки.

13. Твердая оральная дозируемая форма по п.11, где количество микрокристаллической целлюлозы составляет от 15 до 25 мас %.

14. Твердая оральная дозируемая форма по п.12, где количество сшитого ПВП составляет от 10 до 30 мас%.

15. Твердая оральная дозируемая форма по п. 1 или п.7 в форме таблетки.

16. Твердая оральная дозируемая форма по п. 1 или п.7 в форме драже.

17. Способ изготовления твердой оральной дозируемой формы по одному из предыдущих пунктов, проводимый в отсутствии воды, и включающий следующие этапы:

а) действующее вещество, содержащее эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, в количестве более 35 мас.% в пересчете на общую массу твердой оральной дозируемой формы, и фармацевтически приемлемые добавки измельчают,

б) смесь измельченного действующего вещества и добавок прессуют с получением компримата,

в) компримат превращают в гранулят и

г) гранулят прессуют с получением твердой оральной дозируемой формы.

18. Способ по п.17, где прессование б) осуществляют с использованием методов валкового уплотнения или штамповки.

19. Способ по п. 17 или п. 18, где стадию в) осуществляют путем просеивания или размалывания компримата.

20. Способ по п.17, где гранулят прессуют без предварительной классификации по размерам.

21. Способ по п.17, где смесь измельченного действующего вещества и добавок прессуют под давлением от 25 до 65 кН.

22. Комприматы, полученные путем валкового уплотнения или штамповки по п.19.

23. Гранулят, полученный способом по п.17.

24. Твердая оральная дозируемая форма, изготовленная способом по любому из пп. 17-21."

При этом патентообладателем на заседании коллегии Палаты по патентным спорам представлены дополнительные пояснения в отношении преимуществ последовательности, приемов и режимов выполнения стадий способа для получения твердой оральной дозируемой формы, содержащей в качестве действующего вещества вальсартан или его фармацевтически приемлемую соль, и

достигаемого при этом технического результата.

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения возражения, Палата по патентным спорам установила следующее.

С учетом даты поступления заявки правовая база для оценки охраноспособности заявленного изобретения включает упомянутый выше Закон и Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 17.04.1998 № 82 и зарегистрированные в Министерстве юстиции Российской Федерации 22.09.1998 № 1612 (далее – Правила ИЗ), и указанные ранее Правила ППС.

В соответствии с пунктом 1 статьи 4 Закона изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

В соответствии с подпунктом (1) пункта 19.5.2 Правил проверка новизны изобретения проводится в отношении всей совокупности признаков, содержащихся в независимом пункте формулы изобретения.

Согласно подпункту (3) пункта 19.5.2 Правил, не признаются соответствующими условию новизны изобретения, если в уровне техники выявлено средство, которому присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в предложенной заявителем формуле изобретения, включая характеристику назначения.

Согласно подпункту (3) пункта 19.5.3 Правил ИЗ не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные, в частности, на дополнении известного средства какой-либо известной частью (частями), присоединяемой (присоединяемыми) к нему по известным правилам, для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно таких дополнений.

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.

Согласно подпункту (3) пункта 19.5.4 Правил ИЗ, если заявлена группа изобретений, проверка патентоспособности проводится в отношении каждого из входящих в нее изобретений. Патентоспособность группы может быть

констатирована только тогда, когда патентоспособны все изобретения группы. Если установлено, что патентоспособны не все изобретения группы, то заявителю сообщается об этом и предлагается представить свое мнение относительно приведенных доводов и, при необходимости, исключить из формулы независимые пункты, в которых охарактеризованы непатентоспособные изобретения, либо представить эти пункты в скорректированном виде.

Согласно пункту 4.9 Правил ППС, при рассмотрении возражения против выдачи патента на изобретение коллегия Палаты по патентным спорам вправе предложить патентообладателю внести изменения в формулу изобретения, если без внесения указанных изменений оспариваемый патент должен быть признан недействительным полностью, а при их внесении – может быть признан недействительным частично. Указанные изменения должны соответствовать изменениям формулы изобретения, которые предусмотрены правилами составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, действовавшими на дату подачи заявки.

Существо образующих группу изобретений выражено в приведённой выше формуле изобретения, содержащей 6 независимых пункта (1, 7, 17, 22 - 24), которую Палата по патентным спорам принимает к рассмотрению.

Анализ уточненной формулы изобретения показал следующее. Данная измененная формула изобретения представлена заявителем без выхода за рамки первоначальных материалов заявки, отражает существо заявленного изобретения и составлена в соответствии с требованиями, установленными Правилами ИЗ.

В соответствии с независимым пунктом 1 измененной формулы изобретения предложена твердая оральная дозируемая форма, полученная способом, осуществляемым в отсутствии воды, и определенной последовательностью выполнения операции способа.

Ближайшим аналогом в возражении правомерно выбраны твердые фармацевтические дозируемые формы, содержащие вальсартан, из патента [1]. В качестве ближайшего аналога и в самом описании (с.4, левая колонка, абзац 25) также указан патент [1], где описан способ получения твердой фармацевтической

дозированной формы, содержащей действующее вещество - вальсартан. При этом и количество действующего вещества раскрыто в указанном патенте и составляет более 35 мас. % в пересчете на общую массу твердой оральной дозированной формы.

Отличиями изобретения по оспариваемому патенту являются последовательность выполнения стадии способа и приемы его выполнения.

Однако, в противопоставленном патенте [1] отсутствует не только вышеуказанная последовательность выполнения стадии способа, но и отсутствует указание на возможность выполнения способа получения твердой оральной дозированной формы в отсутствии воды. В противопоставленном патенте [1] (примеры 92 и 93) для гранулирования вальсартана использовали только методику влажного гранулирования.

При этом необходимо отметить то, что как правомерно указано патентообладателем, вальсартан, имеющий низкую плотность, представляет собой объемный и рыхлый материал (третий абзац с.2 описания к изобретению), и его очень трудно гранулировать известными методами. Как следует из источника информации [6], сухое гранулирование применяется для того, чтобы улучшить сыпучесть исходного порошка. Однако в изобретении по оспариваемому патенту отсутствует необходимость в улучшении сыпучести, так как вальсартан изначально представляет собой сыпучий порошок. То есть, известный способ сухого гранулирования, упомянутый в источнике информации [6], на дату приоритета был не применим для изготовления твердых дозированных форм, содержащих в качестве действующего вещества вальсартан. Ввиду изложенного, заявитель в уточненной формуле изобретения в соответствии с описанием к изобретению указал следующий признак "способ осуществляют в отсутствии воды". Данный признак позволяет обеспечить достижение указанного в описании изобретения (с.6 описания) технического результата - изготовление твердых оральных дозированных форм с высокой загрузкой действующего вещества и с меньшими размерами для заданного количества действующего вещества.

Таким образом, как в источниках информации [1], [6], так и в источниках информации [2] - [5] отсутствуют сведения о том, что для получения твердой оральной дозированной формы, содержащей действующее вещество - вальсартан или его фармацевтически приемлемую соль и фармацевтические добавки,

использовали способ, осуществляемый в отсутствии воды. И более того, из всех этих источников информации не следует, что указанная очередность выполнения стадии способа позволяет таким образом получать твердую оральную дозированную форму с высокой загрузкой вещества (в данном случае вальсартана) и с меньшими размерами для заданного количества действующего вещества.

Следовательно, в источниках информации [1] – [6] отсутствуют сведения об обеспечиваемом результате с помощью совокупности и очередности вышеуказанных приёмов, предложенных в изобретении.

Данные обстоятельства позволяют сделать вывод о том, что изобретение по независимому пункту 1 формулы изобретения для специалиста не следует из уровня техники, и, следовательно, соответствует условию "изобретательский уровень".

Что касается независимого пункта 7 формулы изобретения, то доводы приведенные по независимому пункту 1 формулы изобретения, относятся и к нему, так как технический результат обеспечивается, несмотря на сочетание с ГХТА, самим вальсартаном.

Относительно независимого пункта 17 формулы изобретения следует отметить то, что в данном пункте раскрыт сам способ изготовления твердой оральной дозируемой формы, содержащей валсартан или его фармацевтически приемлемую соль, или сочетание вальсартана с гидрохлортиазидом. То есть доводы, относящиеся к независимым пунктам 1 и 7 формулы изобретения, относятся и к данному независимому пункту.

При этом доводы, относящиеся к независимому пункту 17 формулы изобретения, относятся и к изготовлению вышеуказанным способом комприматов, гранулята, твердой оральной дозируемой формы из независимых пунктов 22 - 24 формулы изобретения,

Таким образом, источники информации, приведенные в возражении, не позволяют сделать вывод о несоответствии заявленной группы изобретений условию патентоспособности "изобретательский уровень".

Приведенная выше уточненная заявителем формула изобретения отвечает требованиям пункта 3.3 Правил ИЗ по ее составлению.

Каких-либо иных обстоятельств, препятствующих признанию заявленного изобретения охраноспособным, Палатой по патентным спорам не выявлено.

Учитывая изложенное, Палата по патентным спорам решила:

**удовлетворить возражение, поступившее 02.09.2005, признать патент Российской Федерации № 2203054 на изобретение недействительным частично, и выдать новый патент Российской Федерации на изобретение "Твердые оральные дозируемые формы на основе вальсартана" с измененной формулой, представленной на заседании коллегии в следующей редакции:**

Форма № 01а

(21) 99101056/14

(51) МПК

A61K 31/41, 9/20, 9/14

(57)

1. Твердая оральная дозируемая форма, полученная способом, осуществляемым в отсутствии воды, включающим следующие стадии:

а) действующее вещество, содержащее эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, в количестве более 35 мас.% в пересчете на общую массу твердой оральной дозируемой формы, и фармацевтически приемлемые добавки измельчают,

б) смесь измельченного действующего вещества и добавок прессуют с получением компримата,

в) компримат превращают в гранулят и

г) гранулят прессуют с получением твердой оральной дозируемой формы.

2. Твердая оральная дозируемая форма по п.1, где количество действующего вещества составляет более 50 мас.%.

3. Твердая оральная дозируемая форма по п.1 или 2, где количество действующего вещества составляет от 57 до 62 мас.%.

4. Твердая оральная дозируемая форма по п.1, где действующее вещество полностью состоит из вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли в дозе приблизительно от 10 до 250 мг.

5. Твердая оральная дозируемая форма по п.4, где диапазон доз составляет до 40 до 160 мг.

6. Твердая оральная дозируемая форма по п.4, где доза равна 40 мг, 80 мг или 160 мг.

7. Твердая оральная дозируемая форма, полученная способом, осуществляемым в отсутствии воды, включающим следующие стадии:

а) эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, эффективное количество гидрохлортиазида (ГХТА) или его фармацевтически приемлемой соли, и фармацевтически приемлемые добавки измельчают,

б) смесь измельченных действующих веществ и добавок прессуют с получением компримата,

в) компримат превращают в гранулят и

г) гранулят прессуют с получением твердой оральной дозируемой формы.

8. Твердая оральная дозируемая форма по п.7, включающая стандартную дозу вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, составляющую приблизительно от 10 до 250 мг, и стандартную дозу ГХТА, составляющую приблизительно от 6 до 60 мг.

9. Твердая оральная дозируемая форма по п.7 или п.8, включающая стандартную дозу вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, составляющую приблизительно от 50 до 100 мг, и стандартную дозу ГХТА, составляющую приблизительно от 10 до 30 мг.

10. Твердая оральная дозируемая форма по п.7 или п.8, включающая стандартную дозу вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли,



составляющую приблизительно от 80 до 160 мг, и стандартную дозу ГХТА, составляющую приблизительно от 12,5 до 25 мг.

11. Твердая оральная дозируемая форма по п.1, которая включает микрокристаллическую целлюлозу в качестве фармацевтически приемлемой добавки.

12. Твердая оральная дозируемая форма по п.1, которая включает сшитый поливинилпирролидон (ПВД) в качестве фармацевтически приемлемой добавки.

13. Твердая оральная дозируемая форма по п.11, где количество микрокристаллической целлюлозы составляет от 15 до 25 мас %.

14. Твердая оральная дозируемая форма по п.12, где количество сшитого ПВП составляет от 10 до 30 мас%.

15. Твердая оральная дозируемая форма по п. 1 или п.7 в форме таблетки.

16. Твердая оральная дозируемая форма по п. 1 или п.7 в форме драже.

17. Способ изготовления твердой оральной дозируемой формы по одному из предыдущих пунктов, проводимый в отсутствии воды, и включающий следующие этапы:

а) действующее вещество, содержащее эффективное количество вальсартана или его фармацевтически приемлемой соли, в количестве более 35 мас.% в пересчете на общую массу твердой оральной дозируемой формы, и фармацевтически приемлемые добавки измельчают,

б) смесь измельченного действующего вещества и добавок прессуют с получением компримата,

в) компримат превращают в гранулят и

г) гранулят прессуют с получением твердой оральной дозируемой формы.

18. Способ по п.17, где прессование б) осуществляют с использованием методов валкового уплотнения или штамповки.

19. Способ по п. 17 или п. 18, где стадию в) осуществляют путем просеивания или размалывания компримата.

20. Способ по п.17, где гранулят прессуют без предварительной классификации по размерам.

21. Способ по п.17, где смесь измельченного действующего вещества и добавок прессуют под давлением от 25 до 65 кН.

22. Комприматы, полученные путем валкового уплотнения или штамповки по п.19.

23. Гранулят, полученный способом по п.17.

24. Твердая оральная дозируемая форма, изготовленная способом по любому из пп. 17-21.

(56) US 5399578 A, 21.03.1995

US 4743612 A, 10.05.1988

DE 3705055 A1, 01.09.1988

US 4543359 A, 24.09.1985

WO 9524901 A, 21.09.1995

Примечание: При публикации сведений о выдаче патента будут использованы описание в редакции заявителя и скорректированный ППС реферат.