

ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам рассмотрения ☒ возражения

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 1 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 231-ФЗ в редакции, действующей на дату подачи возражения и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденными приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020 г. № 644/261, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020 № 59454, с изменениями, внесенными приказом Минобрнауки России и Минэкономразвития России от 23.11.2022 № 1140/646 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение, поступившее 20.02.2025 от компании «ВАЙВ ХЕЛТКЕР КОМПАНИ» (US), США (далее – лицо, подавшее возражение), против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2826745, выданного по заявке №2024121194, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации №2826745 (далее – оспариваемый патент) на изобретение «СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ НАТРИЕВОЙ СОЛИ (4R,12aS)-N-(2,4-ДИФТОРБЕНЗИЛ)-7-ГИДРОКСИ-4-МЕТИЛ-6,8-ДИОКСО-3,4,6,8,12,12a-ГЕКСАГИДРО-2Н-ПИРИДО[1',2':4,5]ПИРАЗИНО[2,1-b][1,3]ОКСАЗИН-9-КАРБОКСАМИДА» с приоритетом от 25.07.2024, установленным по дате подачи (25.07.2024) заявки № 2024121194, выдан на имя АКЦИОНЕРНОГО ОБЩЕСТВА «БИОХИМИК» (далее – патентообладатель), со следующей формулой

изобретения:

1. Способ получения (4R,12aS)-N-(2,4-дифторбензил)-7-гидрокси-4-метил-6,8-диоксо-3,4,6,8,12,12а-гексагидро-2Н-пиридо[1',2':4,5]пиразино[2,1-Ь][1,3]оксазин-9-карбоксамида натрия (соединения формулы (II)), включающий взаимодействие (4R,12aS)-N-(2,4-дифторбензил)-7-метокси-4-метил-6,8-диоксо-3,4,6,8,12,12а-гексагидро-2Н-пиридо[1',2':4,5]пиразино[2,1-Ь][1,3]оксазин-9-карбоксамида (соединения формулы (III)) с лития бромидом в присутствии лимонной кислоты или ее гидрата с последующим добавлением гидроксида натрия.

2. Способ по п. 1, характеризующийся тем, что взаимодействие соединения формулы (III) с лития бромидом происходит в апротонном органическом растворителе.

3. Способ по п. 2, характеризующийся тем, что апротонный органический растворитель выбран из группы, включающей метиленхлорид, ацетонитрил, N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид, диметилсульфоксид, ацетон, толуол, хлороформ, циклогексан, 1,2-дихлорэтан, 1,4-диоксан, этилацетат, диэтиловый эфир, гептан, гексан, изооктан, трет-бутилметиловый эфир, метилэтилкетон, пентан, тетрагидрофуран, ксилол, N-метилпирролидон и 1,2-диметоксиэтан.

4. Способ по п. 1, характеризующийся тем, что гидроксид натрия добавляют вместе со спиртом.

5. Способ по п. 4, характеризующийся тем, что спирт представляет собой одноатомный спирт.

6. Способ по п. 5, характеризующийся тем, что одноатомный спирт представляет собой метанол, этанол, 1-пропанол, 2-пропанол, 1-бутанол, 2-бутанол или изобутанол.

7. Способ по п. 1, характеризующийся тем, что дополнительно включают следующие стадии:

а) выделение продукта; и/или

b) промывка выделенного продукта; и/или

с) сушка продукта.

8. Способ по п. 7, характеризующийся тем, что стадию b) проводят при помощи органического растворителя.

9. Способ по п. 8, характеризующийся тем, что органический растворитель представляет собой спирт.

10. Способ по п. 9, характеризующий тем, что спирт представляет собой метанол, этанол, 1-пропанол, 2-пропанол, 1-бутанол, 2-бутанол или изобутанол.

11. Способ по п. 8, характеризующий тем, что органический растворитель представляет собой трет-бутилметилловый эфир.

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса было подано возражение, мотивированное несоответствием изобретения, охарактеризованного в вышеприведенной формуле, условию патентоспособности «изобретательский уровень».

К возражению, приложены копии следующих источников информации:

- патентный документ WO 2019/048808 A1, дата публикации 14.03.2019, с переводом релевантных частей на 60 л.; (далее – [1];

- патентный документ EP 3045461 A1, дата публикации 16.01.2015, с переводом релевантных частей на 66 л.; (далее – [2];

- патентный документ WO 2012/081032 A1, дата публикации 21.06.2012, с переводом релевантных частей на 35 л. (далее – [3];

- патентный документ US 2016/0039759 A1, дата публикации 11.02.2016, с переводом релевантных частей на 11 л. (далее – [4];

- патентный документ WO 2019/159199 A1, дата публикации 22.08.2019, с переводом релевантных частей на 21 л. (далее – [5];

- патентный документ US 11248005 B2, дата публикации 15.02.2022, с переводом релевантных частей на 64 л. (далее – [6].

В возражении отмечено, что предложенный в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента способ получения долутегравира натрия не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку он явным образом следует для специалиста из уровня техники.

При этом отмечено, что наиболее близким аналогом к способу получения долутегравира натрия по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента является способ получения долутегравира натрия, известный из патентного документа [1].

В патентном документе [1], в частности раскрыт способ получения натриевой соли долутегравира включающий взаимодействие защищенного долутегравира с безводным бромидом лития (LiBr) в присутствии растворителя с добавлением уксусной кислоты и отделение и концентрирование органического слоя от реакционной массы, последующее добавление к нему гидроксида натрия вместе со спиртом (метанолом), промывку, сушку и выделение целевого продукта долутегравира натрия (примеры 5 и 12).

Кроме того, лицо, подавшее возражение, отмечает, что известный из патентного документа [1] способ сам по себе представляет собой широко известный способ получения долутегравира натрия из защищенного долутегравира при помощи реакции деметилирования бромидом лития в растворителе, с добавлением кислоты и последующим добавлением гидроксида натрия и спирта.

По мнению лица, подавшего возражение, аналогичные способы получения долутегравира и его аналогов, а также их солей раскрыты в патентном документе [5] (примеры на с. 38-39, примеры 3, 5, 7) и в патентном документе [6] (кол. 1-2, стадии d)-e) кол. 6-7, кол. 8., кол. 13-14, пример 4, пример 7). При этом отмечено, что в патентных документах [5] и [6] продемонстрировано получение солей долутегравира и его аналогов при различных условиях с высоким выходом и высокой чистотой (99,9%).

По мнению лица, подавшего возражение, отличие изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента от известного из патентного документа [1] способа заключается в использовании лимонной кислоты вместо уксусной кислоты.

Вместе с тем, в возражении отмечено, что специалисту из уровня техники известно использование минеральных или органических кислот, таких как соляная, уксусная, лимонная, муравьиная, для выделения долутегавира из подкисленных сред (см. патентный документ [2] (абзац [0066])).

Кроме того, в возражении отмечено, что на основании уровня техники [3] (стадия b) параграфа [0016], параграфы [0034], [0039]) и [4] (параграфы [0017], [0049] и [0050]), специалисту в данной области техники также известно использование лимонной кислоты или ее гидрата в реакции деметилирования/деалкилирования.

Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что для специалиста очевидно заменить уксусную кислоту в предложенном способе получения долутегавира натрия на лимонную кислоту (добавление лимонной кислоты будет способствовать более полному протеканию реакции деалкилирования) с целью оптимизации способа деалкилирования защищенного долутегавира и получения более высокого выхода реакции и более высокой чистоты продукта (более 99,9%).

Также в возражении отмечено, что признаки, охарактеризованные в зависимых пунктах 2 и 3 формулы оспариваемого патента известны из патентного документа [1] (примеры 1-13, с. 9-10 описания), патентного документа [4] (параграф [0050]), патентного документа [6] (кол. 7-8).

Признаки, охарактеризованные в зависимых пунктах 4-10 формулы известны из патентного документа [1] (примеры 1-11, с. 9-10 описания).

Признак, охарактеризованный в зависимом пункте 11 формулы известен из патентного документа [6] (кол. 7-8).

Патентообладателем, ознакомленным в установленном порядке с материалами возражения, на заседании коллегии, состоявшемся 29.04.2025 (см. приложение №2 протоколу заседания коллегии), представлен отзыв по мотивам возражения.

К отзыву приложены копии следующих материалов:

- Смит В., Бочков А., Кейпл Р. Органический синтез. Наука и искусство: Пер. с англ. - М.: Мир, 2001. - 573 с; с. 81-91, 130-131 (далее – [7]).

Патентообладатель указывает, что техническим результатом на достижение которого направлено предложенное изобретение является достижение высокого выхода и чистоты в том числе солей долутегравира при проведении экологически безвредных, безопасных способов их очистки, а также способов их получения.

При этом, по мнению патентообладателя, достижение технического результата изобретением согласно оспариваемому патенту полностью подтверждено в описании, в частности показано в таблице 5 на с. 51 описания.

По мнению патентообладателя, отличие изобретения по оспариваемому патенту от указанного в возражении способа получения, известного из патентного документа [1] заключается в использовании в использовании лимонной кислоты.

При этом отмечено, что преимущество способа получения долутегравира натрия в отношении выхода реакции по оспариваемому патенту по сравнению со способом получения новых полиморфных форм долутегравира натрия 1А и 1В, которые обладают определенной насыпной плотностью, указанным в патентном документе [1], экспериментально подтверждено в описании изобретения к оспариваемому патенту.

Вместе с тем, в отзыве отмечено, что изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента обладает отличительными

признаками, которые не раскрываются ни в одном из источников информации [1]-[6], ни в какой-либо их комбинации, и не приводят к достижению технического результата изобретения согласно оспариваемому патенту.

Так, в отзыве отмечено, что в патентном документе [2] (абз. [0066]) декларативно перечисляются различные минеральные и органические кислоты, в том числе лимонная кислота, которые могут быть использованы для выделения несолевой формы долутегавира в виде осадка. При этом лимонная кислота не была использована ни в одном примере согласно патентному документу [2].

В патентном документе [3] охарактеризован синтез тенофовира, в патентном документе [4] - синтез перампанела и его промежуточных продуктов.

При этом патентные документы [5] и [6], по мнению патентообладателя, были противопоставлены лицом, подавшим возражение, как уровень техники, подтверждающий получение солей долутегавира и его аналогов при различных условиях с высоким выходом и чистотой.

Между тем отмечено, что в описании к оспариваемому патенту было экспериментально подтверждено преимущество способа получения долутегавира натрия по оспариваемому патенту по сравнению со способом, указанным в патентном документе [5], что подтверждено данными, раскрытыми в таблице 5 (с. 51 описания).

При этом в отзыве также отмечено, что источник информации [5] был проанализирован в ходе проведения экспертизы по существу по заявке, по которой выдан оспариваемый патент, о чем, по мнению патентообладателя, говорит список источников информации, указанный в отчете о поиске.

Патентный документ [6] (с.1) относится к способу получения промежуточных соединений и их использования при получении ингибитора интегразы ВИЧ, таких как Биктегравир, Долутегравир, Каботегравир или их

фармацевтически приемлемых солей.

При этом патентообладатель обращает внимание на то, что в примерах 4 и 7 описания к патентному документу [6], на которые ссылается лицо, подавшее возражение, раскрыты способы получения биктегравира и натриевой соли биктегравира соответственно, для которых указаны выходы и чистота. Ни одного экспериментального примера, демонстрирующего процесс синтеза долутегравира или его натриевой соли, в патентном документе [6] не раскрыто.

На заседании коллегии, состоявшемся 29.05 2025 (см. приложение №2 к протоколу и пункт 6 протокола заседания коллегии), лицом, подавшим возражение, к материалам возражения были приобщены дополнения, представляющие собой новое основание оспаривания патента (несоответствие изобретения по оспариваемому патенту требованию достаточности раскрытия). К дополнениям приложены копии следующих источников информации:

- статья Xue X. et al. «Control over selectivity for demethylation in dolutegravir synthesis in microreactors: Kinetics and mechanisms». Chemical Engineering Science 284 (2024) 119453, доступно онлайн 07.11.2023, с переводом на 21 л. (далее – [8]);

- статья Gudisela, M. R., et al. «Synthesis and Characterization of Potential Impurities of Dolutegravir: A HIV Drug». ChemistrySelect,(2018), 3(25), 7152-7155, с переводом на 12 л. (далее – [9]).

Кроме того, приобщен более полный перевод источника информации [2].

По мнению лица, подавшего возражение, изобретение согласно пунктам 1-11 формулы оспариваемого патента не соответствует требованию раскрытия с полнотой, достаточной для его осуществления специалистом в данной области техники, поскольку:

- 1) в формуле изобретения не раскрыта совокупность существенных

признаков, необходимых для достижения указанного заявителем технического результата;

2) в описании заявки и уровне техники не раскрыты методы и средства, с помощью которых возможно осуществление изобретения с реализацией назначения в том виде, как оно охарактеризовано в каждом из пунктов формулы, в том числе в случае использования общего (общих) понятия (понятий) для характеристики признака (признаков);

3) в материалах оспариваемого патента отсутствует пример, подтверждающий экспериментальными данными или теоретическими обоснованиями возможность реализации назначения запатентованного способа с достижением указанного технического результата.

При этом отмечено, что способ получения долутегравира натрия в оспариваемом патенте охарактеризован признаками, указывающими на одновременную реакцию соединения формулы (III) с лития бромидом в присутствии лимонной кислоты или ее гидрата, и с последующим добавлением гидроксида натрия.

Вместе с тем, в дополнениях к возражению указано, что в описании изобретения к оспариваемому патенту способ иллюстрируется только одним примером (с. 51), где долутегравир натрия получают в несколько стадий:

На первой стадии осуществляют взаимодействие защищенного долутегравира с бромидом лития в течение 40 часов, и только после окончания взаимодействия с бромидом лития и охлаждения реакционной смеси на второй стадии добавляли водный раствор лимонной кислоты и выдерживали реакционную массу в течение 2 ч. Далее, на третьей стадии, после отделения органического слоя к полученному долутегравирному основанию добавляли гидроксид натрия в этиловом спирте с получением долутегравира натрия. Выход целевого долутегравира натрия был количественный (строки 21-22).

Таким образом, в дополнениях к возражению сделан вывод о том, что

изобретение согласно пунктам 1-11 формулы оспариваемого патента не раскрыто в описании патента с полнотой, достаточной для его осуществления специалистом в данной области техники, поскольку в материалах оспариваемого патента отсутствует пример, подтверждающий экспериментальными данными или теоретическими обоснованиями возможность реализации назначения способа в том виде, как он охарактеризован в пункте 1 формулы оспариваемого патента с достижением указанного технического результата (высокого выхода и чистоты).

Вместе с тем, по мнению лица, подавшего возражение, сведения из уровня техники (статья [9] схемы 3 и 4) свидетельствуют о том, что реакция защищенного долутегравира с бромидом лития в кислой среде (то есть как это указано в независимом пункте 1 формулы) будет приводить к образованию побочных примесей и снижению выхода реакции.

Лицо, подавшее возражение, также приводит подробный анализ сведений, приведенных в статье [8].

Так, отмечено, что в статье [8] раскрывается, что в кислых условиях происходит раскрытие цикла защищенного долутегравира и образуется побочный продукт (10), который в свою очередь может взаимодействовать с находящимся в реакционной смеси бромидом лития с получением примеси (V). Т.е. при одновременном нахождении в реакционной смеси и бромида лития и кислоты помимо целевой реакции получения долутегравира основания может протекать 2 побочные реакции с получением побочных продуктов (10) и (V).

Согласно сведениям, раскрытым в статье [8] (раздел 2.2. схема 3) всесторонне исследовали реакцию деметилирования защищенного долутегравира бромидом лития с последующей нейтрализацией уксусной кислотой в каскадной микрореакторной системе и выяснили, что процесс деметилирования защищенного долутегравира идет через получение промежуточного литийорганического соединения формулы R-Li. При этом,

поскольку концентрация долутегравира основания, измеренная с помощью ВЭЖХ была равна концентрации промежуточного R-Li, очевидно, что промежуточный R-Li реагирует с кислотой без побочных реакций.

При этом отмечено, что в некоторых растворителях конверсия (доля превращения) защищенного долутегравира более высокая, например в ДМСО конверсия защищенного долутегравира составила 3,5%, а в тетрагидрофуране 21,4% ([8], раздел 3.1. и таблица 1).

Температура является существенным фактором влияющим на конверсию защищенного долутегравира и селективность долутегравира основания (эффективность целевой реакции по сравнению с побочной в сложных процессах), например при температуре 120°C-150°C конверсия защищенного долутегравира составила около 78% и селективность долутегравира составила 99%. Однако при увеличении температуры конверсия защищенного долутегравира увеличивалась, но селективность долутегравира основания уменьшалась, что, по мнению лица, подавшего возражение, говорит о протекании побочной реакции ([8] раздел 3.2., фигура 2)

Увеличение концентрации защищенного долутегравира до 0,4 моль/л увеличивает его конверсию и селективность долутегравира основания вплоть до 100% ([8] раздел 3.3., фиг.3)

При увеличении молярного соотношения бромида лития к защищенному долутегравиру от 1 к 1,6 селективность долутегравира основания оставалась практически постоянной и составляла около 99%. Однако при увеличении соотношения бромида лития к защищенному долутегравиру от 1,6 к 2 наблюдалось тенденция к снижению селективности долутегравира основания, что говорит о протекании побочной реакции с получением побочного продукта DTG-8-By ([8] раздел 3.4., фигура 4, схема 3.

Проведя масштабные исследования, систематизировав данные и

выявив оптимальные варианты растворителя, температуры и концентрации реагентов авторы работы в статье [8] установили рабочее окно процесса деметилирования, в рамках которого выход долутегравира основания может составить вплоть до 100% ([8] фиг. 10).

При этом чистота целевого продукта будет повышаться вместе с повышением конверсии исходного защищенного долутегравира и селективности долутегравира основания.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, с учетом известных из источников информации [8] и [9] сведений следует, что получение долутегравира натрия с высоким выходом и чистотой напрямую зависит от результатов стадии деметилирования защищенного долутегравира. При этом на выход и чистоту долутегравира основания, получаемого на этапе деметилирования защищенного долутегравира в свою очередь оказывает влияние множество факторов.

Однако, в материалах оспариваемого патента отсутствуют как примеры, иллюстрирующие одновременное взаимодействие защищенного долутегравира и с бромидом лития и с лимонной кислотой, так и данные о выходе и чистоте полученного долутегравира натрия при различных реакционных условиях, предполагаемых в формуле оспариваемого патента.

Данные о безопасности и экологичности защищенного способа получения долутегравира натрия в материалах оспариваемого патента также отсутствуют.

Доводы дополнений к возражению в отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» по существу повторяют доводы, изложенные ранее в возражении.

При этом дополнено, что авторами статьи [8] (раздел 2.3., схема 3) обнаружено, что промежуточный органолитиевый продукт R-Li, являясь сильным основанием, реагирует с кислотой полностью и без побочных

реакций.

Соответственно, по мнению лица, подавшего возражение, в уровне техники выявлено, что полнота протекания реакции получения долутегравира (выход) и чистота продукта определяются иными стадиями процесса деметилирования, тогда как кислота, использованная на стадии выделения долутегравира основания не влияет ни на увеличение выхода, ни на увеличение чистоты целевого продукта.

Более того, в дополнениях отмечено, что из статьи [8] известно получение долутегравира с выходом до 100% и высокой чистотой, то есть известно, что технический результат достигается за счет проведения реакции деметилирования.

По мнению лица, подавшего возражение, имеющийся в материалах заявки пример (с. 51) иллюстрирует получение долутегравира натрия с использованием известных из уровня техники ([1], [2], [8]) приемов и реагентов. При этом в материалах оспариваемого патента не представлен пример с применением других кислот при тех же условиях синтеза, что и в примере 51, который демонстрировал бы влияние добавления лимонной кислоты на увеличение выхода и чистоты полученного продукта.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, предложенный способ явным образом следует из документов уровня техники [1], [2] и [8] и не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

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

С учетом даты подачи заявки (25.07.2024), правовая база для оценки патентоспособности заявленного изобретения включает Кодекс в редакции, действующей на дату подачи заявки, а также Правила составления, подачи и рассмотрения документов, являющихся основанием для совершения юридически значимых действий по государственной регистрации

изобретений (далее – Правила ИЗ) утвержденные приказом Министерства экономического развития Российской Федерации от 21.02.2023 № 107, зарегистрированном в Минюсте РФ 17.04.2023, регистрационный № 73064, дата начала действия 29.04.2023, с изменениями, внесенными приказом Минэкономразвития России от 15 марта 2024 года № 148 «О внесении изменений в некоторые приказы Минэкономразвития России по вопросам государственной регистрации изобретения и полезной модели, а также проведения предварительного информационного поиска изобретения и полезной модели», зарегистрированным 13.05.2024 № 78120, опубликованным 15.05.2024, вступившим в силу с 25.05.2024 (далее - Правила ИЗ) и Требования к документам заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Минэкономразвития Российской Федерации от 21.02.2023 № 107, зарегистрированным в Минюсте РФ 17.04.2023 г., регистрационный №73064, с изменениями внесенными приказом Минэкономразвития России от 15.03.2024 года № 148 (далее – Требования ИЗ).

Согласно пункту 2 статьи 1386 Кодекса экспертиза заявки на изобретение по существу включает: проверку соответствия заявленного изобретения требованиям, установленным пунктом 4 статьи 1349 настоящего Кодекса, и условиям патентоспособности, установленным абзацем первым пункта 1, пунктами 5 и 6 статьи 1350 настоящего Кодекса;

проверку достаточности раскрытия сущности заявленного изобретения в документах заявки, предусмотренных подпунктами 1-4 пункта 2 статьи 1375 настоящего Кодекса и представленных на дату ее подачи, для осуществления изобретения специалистом в данной области техники;

проведение информационного поиска в отношении заявленного изобретения и

проверку с учетом его результатов соответствия заявленного изобретения условиям патентоспособности, предусмотренным абзацем вторым пункта 1 статьи 1350 настоящего Кодекса.

Согласно подпункту 2 пункта 2 статьи 1375 Кодекса заявка на изобретение должна содержать описание изобретения, раскрывающее его сущность с полнотой, достаточной для осуществления изобретения специалистом в данной области техники.

Согласно подпункту 3 пункта 2 статьи 1375 Кодекса заявка на изобретение должна содержать формулу изобретения, ясно выражающую его сущность и полностью основанную на его описании.

Согласно подпункту 4 пункта 2 статьи 1375 Кодекса заявка на изобретение должна содержать чертежи и иные материалы, если они необходимы для понимания сущности изобретения, в том числе по желанию заявителя его трехмерную модель в электронной форме.

Согласно пункту 53 Правил ИЗ при проверке достаточности раскрытия сущности заявленного изобретения в документах заявки, предусмотренных подпунктами 1-4 пункта 2 статьи 1375 Кодекса и представленных на дату ее подачи, для осуществления изобретения специалистом в данной области техники в указанных документах проверяется:

- 1) указано ли назначение изобретения;
- 2) указаны ли техническая проблема, решаемая созданием изобретения, и технический результат, получение которого обеспечивается изобретением;
- 3) раскрыта ли совокупность существенных признаков, необходимых для достижения указанного заявителем технического результата;
- 4) приведен ли хотя бы один пример осуществления изобретения. Пример должен подтверждать экспериментальными данными или теоретическими обоснованиями возможность реализации назначения изобретения с достижением технического результата;

5) раскрыты ли в документах заявки, предусмотренных подпунктами 1-4 пункта 2 статьи 1375 Кодекса, или в уровне техники на дату подачи заявки методы и средства, с помощью которых возможно осуществление изобретения с реализацией назначения в том виде, как оно охарактеризовано в каждом из пунктов формулы, в том числе в случае использования общего (общих) понятия (понятий) для характеристики признака (признаков);

б) приведен ли пример осуществления изобретения, показывающий, как может быть осуществлено изобретение при использовании хотя бы одной частной формы реализации признака, выраженного общим понятием, или хотя бы одного значения параметра, входящего в интервал, если в формуле изобретения использовано хотя бы одно общее понятие или интервал значений какого-либо параметра для характеристики признака изобретения. Пример должен подтверждать экспериментальными данными или теоретическими обоснованиями возможность реализации назначения изобретения с достижением технического результата при использовании хотя бы одной частной формы реализации признака, выраженного общим понятием, или одного значения параметра, входящего в интервал значений параметров.

Согласно пункту 54 Правил ИЗ если в формуле изобретения несколько признаков выражены общими понятиями, проверка в соответствии с подпунктами 5 и 6 пункта 53 настоящих Правил проводится в отношении каждого признака, выраженного общим понятием.

Если изобретение обеспечивает достижение двух и более технических результатов, проверка в соответствии с подпунктами 3, 4 и 6 пункта 53 настоящих Правил проводится в отношении каждого технического результата.

Проверка осуществляется с учетом положений пунктов 47-55 и 57-64

Требований к документам заявки, устанавливающих требования к раскрытию сущности изобретения и раскрытию сведений о возможности осуществления изобретения.

Проверка проводится одновременно с проверкой соблюдения требований к формуле изобретения, установленных подпунктом 3 пункта 2 статьи 1375 Кодекса и главой IV Требований к документам заявки, к содержанию формулы изобретения.

При отсутствии в документах заявки, предусмотренных подпунктами 1-4 пункта 2 статьи 1375 Кодекса, сведений о методах и средствах, необходимых для осуществления изобретения, допустимо, чтобы упомянутые сведения были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты подачи заявки, а если по заявке испрашивается приоритет более ранний, чем дата подачи заявки, - до даты приоритета изобретения.

Согласно пункту 58 Правил ИЗ если в результате проверки соответствия заявленного изобретения требованию достаточности раскрытия сущности заявленного изобретения в документах заявки, предусмотренных подпунктами 1-4 пункта 2 статьи 1375 Кодекса и представленных на дату ее подачи, для осуществления изобретения специалистом в данной области техники, установлено, что сущность заявленного изобретения в документах заявки, предусмотренных подпунктами 1-4 пункта 2 статьи 1375 Кодекса и представленных на дату ее подачи, раскрыта с полнотой, достаточной для осуществления изобретения специалистом в данной области техники, проводится проверка соответствия заявленного изобретения условиям патентоспособности, предусмотренным абзацем первым пункта 1 статьи 1350 Кодекса.

Согласно пункту 1 статьи 1350 Кодекса изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно пункту 2 статьи 1350 Кодекса изобретение имеет изобретательский уровень, если для специалиста оно явным образом не следует из уровня техники.

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

Согласно пункту 79 Правил ИЗ при проверке изобретательского уровня изобретение признается имеющим изобретательский уровень, если установлено, что оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

Проверка изобретательского уровня изобретения проводится без использования признаков, относящихся к объектам, не являющимся изобретениями в соответствии с пунктом 5 статьи 1350 Кодекса, если они не влияют на достижение технического результата.

Согласно пункту 80 Правил ИЗ, изобретение явным образом следует из уровня техники, если оно может быть признано созданным путем объединения, изменения или совместного использования сведений, содержащихся в уровне техники, и (или) общих знаний специалиста.

В частности, изобретение явным образом следует из уровня техники в том случае, когда выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с признаками, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы изобретения, отличается от наиболее близкого аналога (отличительными признаками), и подтверждена известность влияния этих отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 81 Правил ИЗ, проверка соблюдения условий, указанных в абзаце втором пункта 80 настоящих Правил, включает:

определение наиболее близкого аналога изобретения в соответствии с пунктом 41 Требований к документам заявки;

выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);

выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками заявленного изобретения;

анализ уровня техники в целях подтверждения известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 82 Правил ИЗ, изобретение признается для специалиста не следующим явным образом из уровня техники, если в ходе проверки не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния этих отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 83 Правил ИЗ не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные, в частности:

на выборе оптимальных или рабочих значений параметров, если подтверждена известность влияния этих параметров на технический результат, а выбор может быть осуществлен обычным методом проб и ошибок или применением обычных технологических методов или методов конструирования.

Согласно пункту 84 Правил ИЗ условию изобретательского уровня соответствуют, в частности:

способы получения известных химических соединений (класса, группы) с установленной структурой, если они основаны на новой для данного класса или группы соединений реакции или на известной для данного класса или группы соединений реакции, условия проведения которой не известны, и они приводят к получению неожиданного технического результата при осуществлении способа.

Согласно пункту 85 Правил ИЗ изобретение не рассматривается как не соответствующее изобретательскому уровню из-за его кажущейся простоты и раскрытия в материалах заявки механизма достижения технического результата, если такое раскрытие стало известно не из уровня техники, а только из материалов заявки.

Согласно пункту 86 Правил ИЗ, известность влияния отличительных признаков заявленного изобретения на технический результат может быть подтверждена как одним, так и несколькими источниками информации. Допускается использование аргументов, основанных на общих знаниях в конкретной области техники, без указания каких-либо источников информации.

Согласно пункту 88 Правил ИЗ если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, соответствует условию изобретательского уровня, проверка изобретательского уровня в отношении зависимых пунктов формулы не проводится.

Согласно пункту 42 Требований ИЗ в разделе описания изобретения "Раскрытие сущности изобретения" приводятся с полнотой, достаточной для осуществления изобретения специалистом в данной области техники, сведения, раскрывающие решенную изобретателем техническую проблему, технический результат и сущность изобретения как технического решения, относящегося к продукту или способу, в том числе к применению продукта или способа по определенному назначению, при этом: способами являются процессы осуществления действий над материальным объектом с помощью материальных средств; сущность изобретения как технического решения выражается в совокупности существенных признаков, достаточной для решения указанной заявителем технической проблемы и получения обеспечиваемого изобретением технического результата; признаки относятся к существенным, если они влияют на возможность решения указанной заявителем технической проблемы и получения обеспечиваемого

изобретением технического результата, то есть находятся в причинно-следственной связи с указанным результатом; техническая проблема может состоять, в частности: в создании объекта изобретения, лишенного недостатков прототипа; в расширении арсенала (множества) технических средств, имеющих назначение, совпадающее с назначением прототипа; к техническим результатам относятся результаты, представляющие собой явление, свойство, а также технический эффект, являющийся следствием явления, свойства, объективно проявляющиеся при осуществлении способа или при изготовлении или использовании продукта, в том числе при использовании продукта, полученного непосредственно способом, воплощающим изобретение, и, как правило, могут быть охарактеризованы физическими, химическими или биологическими параметрами.

Согласно пункту 50 Требований ИЗ при раскрытии сущности изобретения, относящегося к способу, для характеристики способа (способов) использовать следующие признаки:

наличие действия или совокупности действий; порядок выполнения действий во времени (последовательно, одновременно, в различных сочетаниях);

условия осуществления действий; параметры режима, в том числе интервалы параметров; использование веществ (например, исходного сырья, реагентов, катализаторов), устройств (например, приспособлений, инструментов, оборудования), штаммов микроорганизмов, линий клеток растений или животных.

Согласно пункту 52 Требований ИЗ в разделе описания изобретения "Осуществление изобретения" приводятся сведения, раскрывающие, как может быть осуществлено изобретение с реализацией указанного заявителем назначения изобретения и с подтверждением возможности достижения технического результата при осуществлении изобретения, путем приведения детального описания, по крайней мере, одного примера осуществления

изобретения со ссылками на графические материалы, если они представлены.

Согласно пункту 53 Требований ИЗ в разделе описания изобретения "Осуществление изобретения" также приводятся сведения, подтверждающие возможность получения при осуществлении изобретения технического результата. В качестве таких сведений приводятся объективные данные, например полученные в результате проведения эксперимента, испытаний или оценок, принятых в той области техники, к которой относится изобретение, или теоретические обоснования, основанные на научных знаниях (см. последний абзац).

Согласно пункту 57 Требований ИЗ для подтверждения возможности осуществления изобретения, относящегося к способу, приводятся, в частности, следующие сведения:

- 1) для изобретения, относящегося к способу, в примерах его реализации указываются последовательность действий (приемов, операций) над материальным объектом, а также условия проведения действий, конкретные режимы (например, температура, давление), используемые при этом материальные средства (например, устройства, вещества, штампы), если это необходимо;

- 2) если способ характеризуется использованием средств, известных до даты приоритета изобретения, достаточно эти средства раскрыть таким образом, чтобы можно было осуществить изобретение.

При использовании неизвестных средств приводятся сведения, позволяющие их осуществить, и в случае необходимости прилагается графическое изображение.

При описании каждого из аналогов изобретения непосредственно в тексте приводятся библиографические данные источника информации, в котором он раскрыт.

Приводится критика аналогов и прототипа, а именно указываются те недостатки аналогов и прототипа, над устранением которых работал изобретатель при решении технической проблемы (задачи).

В качестве недостатков прототипа могут быть указаны, в частности, конкретные неудовлетворительные значения параметров объекта-прототипа или неудовлетворительные характеристики объекта-прототипа, проявляющиеся при его использовании, ограниченная функциональность объекта-прототипа.

Указываются известные заявителю причины, препятствующие решению этой технической проблемы (задачи) и получению технического результата, обеспечиваемого изобретением, в аналогах и прототипе изобретения.

В разделе описания изобретения "Уровень техники" не должны приводиться пренебрежительные высказывания по отношению к решениям, разработанным другими лицами, заявкам или патентам других лиц.

Анализ доводов сторон, показал следующее.

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

В оспариваемом патенте описан способ получения (4R,12aS)-N-(2,4-дифторбензил)-7-гидрокси-4-метил-6,8-диоксо-3,4,6,8,12,12a-гексагидро-2H-пиридо[1',2':4,5]пиразино[2,1-b][1,3]оксазин-9-карбоксамида натрия (соединения формулы (II)), (далее – долутегравир натрия).

Способ осуществляется путем взаимодействия (4R,12aS)-N-(2,4-дифторбензил)-7-метокси-4-метил-6,8-диоксо-3,4,6,8,12,12a-гексагидро-2H-пиридо[1',2':4,5]пиразино[2,1-b][1,3]оксазин-9-карбоксамида (соединения формулы (III)) с лития бромидом в присутствии лимонной кислоты или ее гидрата с последующим добавлением гидроксида натрия.

Анализ доводов лица, подавшего возражение в отношении достаточности раскрытия сущности изобретения по оспариваемому патенту в документах заявки, по которой выдан оспариваемый патент, показал следующее.

Изобретение по оспариваемому патенту относится области медицины, фармакологии и химико-фармацевтической промышленности, а именно к способу получения натриевой соли долутегравира, который представляет собой ингибитор интегразы ВИЧ, который в сочетании с 2 нуклеозидными ингибиторами обратной транскриптазы рекомендован в качестве препарата выбора у больных ВИЧ-инфекцией, ранее не получавших лечения.

Повышение химической чистоты субстанции обеспечивает улучшение ее исходных биологических свойств и снижение возможных побочных действий, связанных с наличием примесей. При этом разработка новых подходов к синтезу активного агента открывает возможности улучшения профиля физико-химических и технологических характеристик фармацевтического продукта.

При этом образование примесей в синтезе долутегравира или его солей, в том числе, энантиомеров (4S, 12aR) и изомеров (например, соединения формул (IV), (V) и (VI)), примесей «с незамкнутым циклом» (соединения формул (VII)) и (IX)), примесей гидролиза, других продуктов распада (соединения формул (VIII) и (X)), часто происходит на этапах, предполагающих, в том числе, получение интермедиатов долутегравира, например, соединения формулы (III), деметилирование указанного интермедиата, а также на этапе солеобразования долутегравира.

Соответственно требуется разработка способов получения долутегравира и его солей, с высоким выходом и чистотой целевого продукта, в том числе, стереоизомерной (энантиомерной и диастереомерной), в которых используются легко доступные реактивы и

условия реакции, при помощи которых можно воспроизвести синтез в промышленном масштабе.

Таким образом, исходя из представленных в описании оспариваемого патента сведений, технологическая проблема, решаемая патентообладателем, состоит в сокращении этапов синтеза долутегравира с повышением чистоты продукта при достижении высокого выхода.

Согласно описанию изобретения к оспариваемому патенту (см. с.12) , технический результат от реализации оспариваемого способа заключается в достижении высокого выхода (порядка 95,00 - 100,00 %) и чистоты солей долутегравира (около 99,8%) при проведении экологически безвредных, безопасных способов его получения.

Для достижения вышеуказанного технического результата в способе по оспариваемому патенту осуществляют взаимодействие соединения формулы (III) с лития бромидом в присутствии лимонной кислоты или ее гидрата с последующим добавлением гидроксида натрия.

Суть доводов, изложенных в возражении, сводится к тому, что данные, представленные в описании оспариваемого патента, не позволяют реализации назначения способа в том виде, как он охарактеризован в пункте 1 формулы оспариваемого патента с достижением указанного технического результата (высокого выхода и чистоты).

Здесь целесообразно отметить, что нормы действующего на дату подачи заявки законодательства, относящиеся к проверке достаточности раскрытия изобретения, не обязывают патентообладателя включать в формулу изобретения подробное изложение методики реализации изобретения, охарактеризованного в независимом пункте формулы.

Исходя из нормы, указанной в пункте 2 статьи 1375 Кодекса (см. нормативно-правовую базу выше), можно отметить, что наиболее полные сведения об изобретении приводятся в описании.

Будучи основанием для формулы изобретения, выражающей его сущность, описание должно раскрывать сущность изобретения настолько, чтобы это было достаточным для достижения обеспечиваемого изобретением указанного технического результата. Такое требование прописано в нормах действующего законодательства, согласно которым для осуществления изобретения специалистом в данной области техники проверяется, раскрыта ли совокупность существенных признаков, необходимых для достижения указанного заявителем технического результата, а также проверяется - указаны ли назначение изобретения, техническая проблема, решаемая созданием изобретения, технический результат, получение которого обеспечивается изобретением и приведен ли хотя бы один пример осуществления изобретения, а также проверяется раскрытие средств и методов, с помощью которых возможно осуществление изобретения с реализацией назначения и приведен ли пример осуществления изобретения, показывающий, как может быть осуществлено изобретение при использовании хотя бы одной частной формы реализации признака, выраженного общим понятием, или хотя бы одного значения параметра, входящего в интервал, если в формуле изобретения использовано хотя бы одно общее понятие или интервал значений какого-либо параметра для характеристики признака изобретения. При этом пример должен подтверждать экспериментальными данными или теоретическими обоснованиями возможность реализации назначения изобретения с достижением технического результата при использовании хотя бы одной частной формы реализации признака, выраженного общим понятием, или одного значения параметра, входящего в интервал значений параметров (см. пункт 53 Правил ИЗ, нормативно-правовая база выше).

Таким образом, специалист может использовать не только описание, но и любые другие сведения, ставшие общедоступными до даты приоритета изобретения, то есть, то, что составляет уровень техники. Требование

раскрытия подразумевает также и наличие в описании изобретения информации о том, как им воспользоваться в практических целях (если только характер изобретения не таков, что не нуждается в дополнительных пояснениях).

При этом описание оспариваемого патента содержит сведения, позволяющие понять его сущность и воспроизвести охарактеризованный в его формуле способ специалистам в данной области техники, с достижением того технического результата, на который претендует патентообладатель, и с учетом содержащихся в уровне техники необходимых сведений.

Так, в описании изобретения к оспариваемому патенту содержатся не только описание приемов способа с получением желательного результата, но и сравнительные характеристики предложенного патентообладателем способа с известными способами получения, а для достижения заявленного технического результата, согласно описанию оспариваемого патента, был проведен ряд экспериментов, в результате которого был получен высокий результат.

Например, в таблице 5 (см. также описание к оспариваемому патенту)

Источник	Условия реакции	Выход реакции (%)	Чистота (%)
WO2015019310	Гексагидрат бромида магния, соляная кислота; NaOH	До 89,00 %	-
WO2019159199	Бромид лития; соляная кислота; NaOH	До 85,00%,	До 99,00 %
WO2015177537	Соляная кислота; NaOH	До 40,00%	-
WO2019048808	Бромид лития; уксусная кислота; NaOH	До 82,00%	-
По настоящему изобретению	Бромид лития; лимонная кислота; NaOH	95,00 - 100,00 %	Более 99,80 %

показано, что использование в способе получения долутегравира натрия бромида лития, лимонной кислоты и NaOH позволяет достичь высокого выхода реакции (порядка 95%-100%) при чистоте продукта реакции более 99,8 %. Пример получения приведен там же на с.51 описания изобретения к оспариваемому патенту.

В отношении довода возражения о том, что способ получения при использовании одновременно указанных реагентов (бромид лития, лимонная

кислота, NaOH) не раскрыт в описании к оспариваемому патенту следует отметить, что в формуле изобретения отсутствует признак, характеризующий одновременную реакцию соединения формулы (III) с лития бромидом в присутствии лимонной кислоты или ее гидрата, с последующим добавлением гидроксида натрия. При этом как отмечено выше в нормативно-правовой базе отсутствует требование приведения полной методики осуществления способа, для трактовки способа привлекается описание изобретения к оспариваемому патенту, необходимо указание существенных признаков, благодаря которым достигается технический результат.

Данные требования при составлении формулы и в представленном описании к изобретению, как видно из изложенного выше, соблюдены.

Что касается сведений раскрытых в статье [9], где представлен синтез шести технологических примесей, то в частности на схемах 3 и 4, на которые ссылается лицо, подавшее возражение, не показано получение долутегравира натрия, т.е. реакция заканчивается на получении примеси, соответственно и чистота долутегравира натрия не изучалась, при этом необходимо отметить, что в данных синтезах технологических примесей не использовалась лимонная кислота.

В отношении сведений раскрытых в статье [8], следует отметить, что данная работа посвящена изучению кинетики деметилирования промежуточного продукта для получения долутегравира. Исследования проводили на основе экспериментальных данных, полученных с помощью микрореакторов в соответствии с механизмом деметилирования образования и превращения комплексных ионов, исследованным с помощью расчетов согласно теории функционала плотности.

При всех данных условиях получен продукт, не являющийся долутегравиrom натрия, однако полученный долутеграбир имел достаточно

высокий выход около 98.5 % без засорения микрореактора, что в свою очередь не коррелируется со сведениями, раскрытыми в статье [9].

Вместе с тем, в статье [8] (с.3 перевода) указано, что выбор растворителя в процессе деметилирования является важным фактором для достижения высокого выхода долутегравира. В частности, при выборе ТГФ и ацетонитрила в качестве растворителей, наблюдались белые твердые вещества (примеси), вызывающие закупорку микрореактора, а данный вывод как раз коррелируется со сведениями раскрытыми в статье [9].

Вместе с тем, можно согласиться с доводом лица, подавшего возражение, что в статье [8] изучалось влияние различных параметров на процесс деметилирования, а именно таких как температура, концентрация соотношение с литий бромидом и др.

Однако влияние лимонной кислоты не изучалось.

Кроме того, следует отметить, что в описании изобретения к оспариваемому патенту при оценке влияния существенных признаков на выход и чистоту полученного продукта провалилось сравнение со способами известными, например, из патентных документов [1] и [5] (см. выше таблицу 5).

При этом в описании отмечено, что «при варьировании условий способов получения соединения формулы (II) по настоящему изобретению выход и/или чистота целевого продукта уменьшаются».

Таким образом, описание изобретения к оспариваемому патенту содержит подробное изложение осуществления способа, охарактеризованного в вышеприведенной формуле изобретения с указанием необходимых качественных и количественных признаков в выполнении приемов способа и приведены примеры осуществления изобретения по оспариваемому патенту (см. описание к оспариваемому патенту).

При этом лицом, подавшим возражение, не представлено доводов о том, что, исходя из уровня техники, в том числе из сведений, содержащихся

в источниках [8]-[9], специалистам в данной области техники невозможно реализовать заявленный патентообладателем технический результат, на основании той информации, которая изложена в материалах заявки на дату ее подачи, включая формулу изобретения.

На основании имеющихся материалов, относящихся к возражению и оспариваемому патенту, можно сделать вывод, что на дату подачи заявки на изобретение, в его описании приведены сведения, раскрывающие, как может быть осуществлено изобретение путем приведения, по крайней мере, примеров и таблицы 5, с возможностью получения желаемого технического результата. В частности, представлены данные, полученные в результате проведения эксперимента, испытаний и оценок, принятых в той области техники, к которой относится изобретение.

Таким образом, с учетом сведений, содержащихся в материалах заявки, представленных на дату ее подачи и по которой был выдан оспариваемый патент, можно сделать вывод о том, что формула изобретения, выражающая его сущность, основана на его описании, которое, в свою очередь, раскрывает сущность изобретения по оспариваемому патенту с полнотой, достаточной для его осуществления специалистом в данной области техники.

На основании вышесказанного, можно констатировать, что в возражении не представлены доводы, позволяющие признать изобретение по оспариваемому патенту, несоответствующим требованиям, предъявляемым пунктом 2 статьи 1375 Кодекса.

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Согласно сведениям, приведенным на с.12 публикации описания изобретения к оспариваемому патенту: «Задачей настоящего изобретения является разработка новых улучшенных, экологически безвредных,

безопасных способов очистки долутегравира, его интермедиатов и солей, а также способов получения интермедиатов долутегравира, долутегравира и его солей, с высоким выходом и чистотой целевого продукта, в том числе, стереоизомерной (энантиомерной и диастереомерной), в которых используются легко доступные реактивы и условия реакции, при помощи которых можно воспроизвести синтез в промышленном масштабе. При этом перед Авторами настоящего изобретения стояли задачи сократить этапы синтеза долутегравира, уменьшить временные и экономические затраты на его осуществление».

Таким образом, следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что техническим результатом изобретения согласно оспариваемому патенту является достижение высокого выхода и чистоты, в том числе, солей долутегравира при проведении экологически безвредных, безопасных способов их очистки, а также способов их получения.

При этом в описании изобретения к оспариваемому патенту (с.51, таблица 5) показано, что использование в данной реакции гидроксида натрия, бромида лития и лимонной кислоты позволяет достичь чистоты 99,8% при неожиданно высоком выходе реакции порядка 95,00 - 100,00 %.

Таким образом, достижение указанного заявителем технического результата, в описании изобретения к оспариваемому патенту подтверждено.

Вместе с тем, следует согласиться с доводом лица, подавшего возражение, о том, что ближайшим аналогом изобретения по оспариваемому патенту является способ получения долутегравира натрия, известный из патентного документа [1].

В патентном документе [1] раскрыт способ получения соли долутегравира включающий взаимодействие защищенного долутегравира с безводным бромидом лития в присутствии растворителя с добавлением уксусной кислоты с последующим отделением и концентрированием органического слоя от реакционной массы, добавлением гидроксида натрия

вместе с метанолом и выделением целевого продукта долутегравира натрия с достижением выхода до 85% (примеры 5 и 12).

При этом технический результат, на достижение которого направлено изобретение согласно патентному документу [1] (с.1), состоит в получении новых полиморфных форм долутегравира натрия.

Таким образом, отличие способа по оспариваемому патенту от технического решения, раскрытого в патентном документе [1], заключается в использовании лимонной кислоты.

Однако необходимо обратить внимание на то, что согласно таблице 5 описания изобретения к оспариваемому патенту, в которой показаны результаты сравнения способов по оспариваемому патенту и, в том числе, способа, известного из патентного документа [1], то в нем указанный технический результат не достигался.

Что касается сведений, раскрытых в источниках информации [2]-[6], представленных в возражении, то необходимо отметить следующее.

В патентном документе [2] не раскрыто техническое решение, согласно которому в способе получения долутегравира натрия использовали лимонную кислоту.

В патентном документе [2] (абзац [0066]) декларативно перечисляются различные минеральные и органические кислоты, в том числе лимонная кислота, которые могут быть использованы для выделения несолевой формы долутегравира в виде осадка.

При этом следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что в патентном документе [2] лимонная кислота не была использована ни в одном примере получения.

Таким образом, в патентном документе [2] не раскрывается и не предполагается использование лимонной кислоты, а также соединения III при получении долутегравира натрия, соответственно неизвестно влияние

лимонной кислоты на увеличение выхода и чистоты целевого продукта, который представляет собой долутегравир натрия.

В патентных документах [3]-[4] раскрыты синтезы совершенно других молекул, имеющих кардинально отличное от долутегравира строение, так, в патентном документе [3] описан синтез тенофовира, в патентном документе [4]- синтез перампанела и его промежуточных продуктов. При этом следует отметить, что аналогично сведениям, раскрытым в патентном документе [2], в патентных документах [3]-[4] лимонная кислота не использовалась в экспериментальных примерах.

Таким образом, сведения раскрытые в патентных документах [3]-[4] не могут повлиять на выбор специалистом лимонной кислоты в качестве оптимального варианта условий реакции *one pot* для синтеза натриевой соли долутегравира с высоким выходом и чистотой целевого продукта.

Целесообразно отметить, что на стадии рассмотрения заявки на изобретение на этапе проведения экспертизы по существу патентный документ [5] также был выявлен в ходе патентного поиска (о чем говорит список источников информации, указанный на титульном листе патента) и проанализирован.

Так, в описании изобретения к оспариваемому патенту (см. таблицу 5):

Источник	Условия реакции	Выход реакции (%)	Чистота (%)
WO2019159199	Бромид лития; соляная кислота; NaOH	До 85,00%,	До 99,00 %

было экспериментально подтверждено преимущество способа получения долутегравира натрия по оспариваемому патенту по сравнению с условиями по способу, раскрытому в патентном документе [5].

Таким образом, сведения раскрытые в патентном документе [6] не дают оснований специалисту предполагать, что замена одной кислоты на другую, может привести к достижению указанного технического результата в совокупности показателей выхода и чистоты продукта.

Патентный документ [6], представленный в возражении, по сути имеет информационный характер в отношении имеющегося уровня техники и к способам получения долутегравира натрия не относится.

В частности, следует согласиться в доводом патентообладателя о том, что в патентном документе [6] содержится информация о стадиях процесса синтеза, в том числе, среди прочего, декларативно указан и долутегравир, в которых также декларативно раскрываются возможные условия проведения процесса синтеза. При этом патентный документ [6] (с.1) относится к способу получения промежуточных соединений и их использования при получении ингибитора интегразы ВИЧ, таких как Биктегравир (примеры 4 и 7, на которые ссылается возражение), Долутегравир, Каботегравир или их фармацевтически приемлемых солей.

Таким образом, в патентном документе [6] также отсутствуют сведения, дающие основание предполагать возможность использования лимонной кислоты, в способах получения долутегравира натрия с целью обеспечения высокого выхода и чистоты целевого продукта.

В соответствии с изложенным, следует констатировать, что в источниках информации [2]-[6] не раскрыты признаки, отличающие изобретение по оспариваемому патенту от наиболее близкого аналога [1].

Вместе с тем в дополнениях к возражению, лицом подавшим возражение, был представлен источник информации [8] (который проанализирован выше) и сделан вывод о том, что изобретение по оспариваемому патенту явным образом следует из документов уровня техники [1], [2] и [8] и не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Однако необходимо отметить следующее.

Как выявлено выше при анализе сведений, раскрытых в патентном документе [1], отличием способа по оспариваемому патенту от технического

решения, раскрытого в патентном документе [1] является в использовании лимонной кислоты.

Кроме того, выявлено, что согласно таблице 5 описания изобретения к оспариваемому патенту, в которой показаны результаты сравнения способов по оспариваемому патенту и, в том числе, способа, известного из патентного документа [1], то в нем указанный технический результат не достигался.

В патентном документе [2] (абзац [0066]) декларативно перечисляются различные минеральные и органические кислоты, в том числе лимонная кислота, которые могут быть использованы для выделения несолевой формы долутегравира в виде осадка.

При этом в патентном документе [2] лимонная кислота не была использована ни в одном примере получения.

В патентном документе [2] не дано какой-либо подсказки или мотивации для выбора оптимальных или рабочих значений параметров для выбора декларируемых подходящих растворителей и их подбора их соотношений каким-либо методом, тем более не показана известность влияния этих параметров на технический результат, как это предписано в пункте 83 Правил ИЗ.

Статья [8], как уже проанализировано выше в настоящем заключении, посвящена изучению кинетики деметилирования промежуточного продукта для получения долутегравира. Исследования проводили на основе экспериментальных данных, полученных с помощью микрореакторов в соответствии с механизмом деметилирования образования и превращения комплексных ионов, исследованным с помощью расчетов согласно теории функционала плотности.

При этом в статье [8] (с.3 перевода) указано, что выбор растворителя в процессе деметилирования является важным фактором для достижения высокого выхода долутегравира, хотя непосредственно долутегравир натрия в статье [8] не получали и не исследовали.

В частности, при выборе ТГФ и ацетонитрила в качестве растворителей, наблюдались белые твердые вещества (примеси), вызывающие закупорку микрореактора. Однако влияние лимонной кислоты не изучалось.

При всех данных условиях получен продукт, не являющийся долутегравиром натрия.

Вместе с тем, можно согласиться с доводом лица, подавшего возражение, что в статье [8] изучалось влияние различных параметров на процесс деметилирования, а именно таких как температура, концентрация соотношения с литий бромидом и др.

Таким образом и с в статье [8] не дано какой-либо подсказки или мотивации для выбора оптимальных или рабочих значений параметров для выбора декларируемых подходящих растворителей и их подбора их соотношений каким-либо методом, тем более не показана известность влияния этих параметров на технический результат, как это предписано в пункте 83 Правил ИЗ.

Таким образом, изобретение по оспариваемому патенту не следует для специалиста явным образом из уровня техники [1], [2] и [8], не представлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, и, соответственно, не подтверждена известность влияния этих отличительных признаков на указанный заявителем технический результат (пункт 82 Правил ИЗ).

Источник информации [7], представленный патентообладателем относится к сведениям общего характера, не раскрывает способ получения долутегавира или его солей и, соответственно, не влияет на сделанные выше выводы (следует отметить, что титульный лист источника информации [7], содержащий библиографические данные, в том числе, дату публикации, не представлен).

Таким образом, можно констатировать, что в возражении не содержится доводов, позволяющих сделать вывод о несоответствии изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 20.02.2025, патент Российской Федерации на изобретение № 2826745 оставить в силе.