

**ЗАКЛЮЧЕНИЕ  
коллегии по результатам  
рассмотрения  возражения  заявления**

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01.01.2008 Федеральным законом от 18.12.2006 № 231-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации» (далее – Кодекс), и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2203659, поступившее 30.04.2019 от Общества с ограниченной ответственностью «Изварино Фарма» (РФ) (далее – лицо, подавшее возражение), при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2203659 на группу изобретений «Фармацевтические композиции на основе соли микофероловой кислоты с энтеросолюбильным покрытием» выдан по заявке № 98120360/04 компании НОВАРТИС АГ (Швейцария) (далее – патентообладатель) со следующей формулой:

«1. Фармацевтическая композиция, состоящая из ядра, включающего фармацевтически приемлемую соль микофероловой кислоты, и нанесенного на него энтеросолюбильного покрытия, обеспечивающего высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта.

2. Фармацевтическая композиция, включающая фармацевтически приемлемую соль микофеноловой кислоты с нанесенным энтеросолюбильным покрытием.

3. Фармацевтическая композиция, содержащая фармацевтически приемлемую соль микофеноловой кислоты с нанесенным энтеросолюбильным покрытием, необязательно в сочетании с фармацевтически приемлемыми ингредиентами, предназначенная для использования при изготовлении лекарственного средства, обладающего иммунодепрессантной активностью и предназначенного, в частности, для предупреждения или лечения отторжения трансплантата, являющегося аллотрансплантатом или ксенотрансплантатом нативного или трансгенного органа, ткани или клетки, а также для лечения или предупреждения опосредованных иммунной системой и/или воспалительных заболеваний, причем фармацевтическую композицию можно использовать в сочетании с другим иммунодепрессантом, при одновременном или раздельном его введении.

4. Композиция по любому из предыдущих пунктов, в форме таблетки.

5. Композиция по п. 4, в которой ядро таблетки имеет твердость от 10 до 70 Н.

6. Композиция по любому из пп. 1-3, в форме пилюль или гранул.

7. Композиция по п. 6, в которой пилюли или гранулы помещены в капсулы.

8. Композиция по любому из предыдущих пунктов, в которой фармацевтически приемлемая соль микофеноловой кислоты представляет собой мононатриевую соль.

9. Композиция по п. 8, в которой мононатриевая соль микофеноловой кислоты находится в кристаллической форме.

10. Композиция по любому из предыдущих пунктов, содержащая примерно от 50 мг до 1,5 г фармацевтически приемлемой соли микофеноловой кислоты.

11. Комбинация, содержащая фармацевтическую композицию по пп.1-3 и другой иммунодепрессант для одновременного, последовательного или раздельного введения.

12. Способ подавления иммунитета у пациента, включающий введение терапевтически эффективного количества фармацевтической композиции по пп. 1-3 пациенту, нуждающемуся в такой иммунодепрессии.

13. Способ по п. 12, в котором пациенту дополнительно одновременно или раздельно вводят другой иммунодепрессант.

14. Способ по п. 13, в котором другой иммунодепрессант представляет собой циклоспорин.

15. Способ по пп. 12-14, в котором фармацевтически приемлемая соль миофеноловой кислоты представляет собой мононатриевую соль.

16. Фармацевтическая композиция по пп. 1-3 или комбинация по п. 11, в которой фармацевтически приемлемая соль миофеноловой кислоты представляет собой мононатриевую соль.

17. Фармацевтическая композиция по пп. 1-3 или комбинация по п. 11, в которых присутствует другой иммунодепрессант, например, циклоспорин».

В соответствии с записью в Государственном реестре от 08.05.2006, срок действия патента в отношении пунктов 1, 2, 3, 4, 8, 11, 16, 17 формулы группы изобретений продлен до 13.10.2019.

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса, в Федеральный орган исполнительной власти по интеллектуальной собственности поступило возражение, мотивированное несоответствием изобретений по независимым пунктам 1, 2, 3 и 11 формулы, характеризующей группу изобретений, условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «изобретательский уровень». Кроме того, в возражении указано на наличие в формуле изобретения признаков, не раскрытых на дату подачи заявки, в документах, представленных на эту дату.

Для подтверждения данных мотивов в возражении приведены следующие документы:

- приоритетная заявка GB 9607564.3, дата публикации 12.04.1996 (далее – [1]);
- приоритетная заявка GB 9622028.0, дата публикации 24.10.1996, (далее – [2]);
- учебник Технология лекарственных форм. Под ред. Т.С. Кондратьевой, том 2, М.: Медицина, 1991, с. 184-188 (далее – [3]);
- статья Solez K. et al., «International standardization of criteria for the histologic diagnosis of renal allograft rejection: The Banif working classification of kidney transplant pathology», Kidney International, Vol. 44, 1993, pp. 411 – 422 (далее – [4]);
- патентный документ GB 1157100, дата публикации 02.07.1969, (далее – [5]);
- патентный документ ZA 6804959, дата публикации 22.05.1969, (далее – [6]);
- статья Allison A.C. et al., «Purine metabolism and immunosuppressive effects of mycophenolate mofetil (MMF)», Clin Transplant, 1996 Feb; 10 (1 Pt 2), pp.77-84 (далее – [7]);
- статья Nobuyuki Sugioka et al., «Stability and pharmacokinetic studies of a new immunosuppressant, mycophenolate mofetil (RS-61443), in rats», Biopharm Drug Dispos., 1995, vol. 16, pp. 591-601 (далее – [8]);
- учебник Самусев Р.П. и др., «Анатомия человека» М.: Медицина, 1995. с. 203, 220-227 (далее – [9]);
- статья Davis S.S. et al., «Transit of pharmaceutical dosage forms through the small intestine», Gut., 1986, 27, pp. 886-892 (далее – [10]);
- статья Anthony C. Allison «Immunosuppressive and other Effects of Mycophenolic Acid and an Ester Prodrug, Mycophenolate Mofetil», Immunological reviews, 1993, No. 136 , pp. 1, 6-28 (далее – [11]);

- статья Elsie M. Eugui et al., «Immunosuppressive activity of mycophenolate mofetil», Annals NY Academy of sciences. pp. 309-329 (далее – [12]);
- патентный документ GB 1203328, дата публикации 02.08.1967, (далее – [13]);
- патентный документ WO 97/38689, дата публикации 23.10.1997, (далее – [14]);
- статья MacManus R.P. et al., «Immunosuppressant Combinations in Primate Cardiac Xenografts», Annals NY Academy of sciences., pp. 281-284 (далее – [15]);
- автореферат Platz K.P. et al., «RS-61443-a new, potent immunosuppressive agent», Transplantation. 1991, 51(l), pp.27-31 (далее – [16]).

В возражении отмечено, что независимые пункты 1, 3 и 11 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, не полностью основаны на описании изобретения и включают признаки, отсутствующие в материалах заявки, представленных на дату ее подачи. При этом, по мнению лица, подавшего возражение, материалы, представленные на дату подачи заявки, соответствуют материалам заявки, поданным на дату международной подачи заявки PCT/EP97/01800, по которым была осуществлена публикация [14].

Так, по мнению лица, подавшего возражение, в материалах заявки, представленных на дату ее подачи, отсутствуют признаки «...обеспечивающего высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта», характеризующие техническое решение по независимому пункту 1 формулы. Отсутствуют признаки «...предназначенная для использования при изготовлении лекарственного средства, обладающего иммунодепрессантной активностью и предназначенного, в частности, для предупреждения или лечения отторжения трансплантата, являющегося аллотрансплантатом или ксенотрансплантатом нативного или трансгенного органа, ткани или клетки, а также для лечения или предупреждения

опосредованных иммунной системой и/или воспалительных заболеваний, причем фармацевтическую композицию можно использовать в сочетании с другим иммунодепрессантом, при одновременном или раздельном его введении», характеризующие техническое решение по независимому пункту 3 формулы. Отсутствуют признаки «Комбинация.....и другой иммунодепрессант для одновременного, последовательного или раздельного введения», характеризующие техническое решение по независимому пункту 11 формулы.

Также в возражении отмечено, что независимые пункты 1, 2, 3 и 11 не соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость», поскольку в описании к оспариваемому патенту не приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретений в том виде, как они охарактеризованы в данных независимых пунктах формулы группы изобретений. При этом в возражении отмечено, что также невозможно убедиться в том, что в случае осуществления изобретений действительно возможна реализация указанного заявителем назначения.

В частности, в независимом пункте 1 формулы отсутствуют какие-либо признаки, указывающие на определенный состав композиции (например, состав самого ядра, входящих в него ингредиентов), кроме указания на фармацевтически приемлемую соль микофероловой кислоты, а также на состав энтеросолюбильного покрытия, используемого для получения композиции. Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, не определено понятие «энтеросолюбильное покрытие, обеспечивающее высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта». Также отмечено, что в описании к оспариваемому патенту не содержится указания на состав покрытия, которое обеспечивает высвобождение активного вещества (соли микофероловой кислоты) именно в верхней части кишечного тракта.

В возражении отмечено, что в независимом пункте 2 формулы отсутствуют какие-либо указания дозировки или признаки, указывающие на

определенный состав энтеросолюбильного покрытия, используемого для получения композиции.

Кроме того, в отношении признаков композиции по независимому пункту 3 формулы, в возражении отмечено, что описание к оспариваемому патенту не включает данные, достоверно указывающие на возможность применения «фармацевтической композиции, содержащей фармацевтически приемлемую соль микофеиноловой кислоты с нанесенным энтеросолюбильным покрытием, необязательно в сочетании с фармацевтически приемлемыми ингредиентами», именно для предупреждения или лечения отторжения трансплантата. Так, по мнению лица, подавшего возражение, состояния отторжения трансплантата включают различные по своей природе реакции: острые, сверхострые отторжения, хронические отторжения, которые являются разными по своей симптоматике и могут лечиться согласно различным схемам терапии, раскрытым, в частности, в статье [4].

В отношении несоответствия технического решения по независимому пункту 11 формулы, характеризующей группу изобретений условию патентоспособности «промышленная применимость» в возражении отмечено, что данный пункт включает широкий круг веществ и их комбинаций, а также их количеств. Термин «другой иммунодепрессант» является неопределенным и также относится к неограниченному и неподтвержденному набору веществ. По мнению, лица, подавшего возражение, указанные признаки комбинации по независимому пункту 11 формулы не подтверждены материалами заявки.

Доводы, лица, подавшего возражение, в отношении несоответствия оспариваемой группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень» основаны на том, что признаки фармацевтической композиции, раскрытой в независимом пункте 1 формулы, известны из источников информации [3], [5]-[10].

В возражении отмечено, что в патентном документе [5] раскрыта фармацевтическая композиция, проявляющая, в том числе, иммунодепрессантную активность, выраженная, в частности, в форме таблеток, пилюль, капсул, и содержащая микофероловую кислоту или ее соль (например, натриевую). При этом, виды энтеросолюбильных покрытий, а также технологии их нанесения описаны в учебнике [3].

Таким образом, по мнению, лица, подавшего возражение, нанесение энтеросолюбильного покрытия на состав, в том числе, который может быть использован в качестве ядра (например, таблетка), является очевидным для специалиста в данной области техники.

При этом в возражении отмечено, что из технического решения по патентному документу [6] известны натриевые соли микофероловой кислоты. Из сведений, раскрытых в статье [7], известно, что вводимое перорально производное микофероловой кислоты микоферолят мофетил (в описании к оспариваемому патенту - соль микофероловой кислоты) гидролизуется в кишечнике с образованием самой микофероловой кислоты, которая, в свою очередь, и является активным действующим веществом (иммунодепрессантом).

Кроме того, в возражении отмечено, что на основании сведений из статьи [8] понятно, что для получения высоких уровней в организме микофероловой кислоты из ее производных необходимо вводить производные микофероловой кислоты именно в среду кишечника (рН 6-8), поскольку по сравнению с другими отделами организма их высвобождение в кишечнике выше. При этом скорость превращения микоферолята мофетила (производного микофероловой кислоты) в микофероловую кислоту выше всего именно в клетках тонкой кишки.

Следовательно, по мнению лица, подавшего возражение, самая оптимальная степень биодоступности микофероловой кислоты достигается за счет введения производных микофероловой кислоты (например, ее соли) в тонкую кишку. Из сведений, раскрытых в учебнике [9], известно, что тонкая

кишка расположена сразу после отделов желудка и включается в кишечный тракт, т.е. тонкую кишку можно отнести к верхней части кишечника. Таким образом, улучшение биодоступности соли микофероловой кислоты вследствие высвобождения ее в тонкой кишке (верхней части кишечника) очевидно для специалиста в данной области техники. В поддержку данного мнения, в возражении приведены сведения, раскрытыые в статье [10].

В возражении отмечено, что признаки фармацевтической композиции, раскрытой в независимом пункте 2 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, известны из источников [3], [5]-[8].

Лицом, подавшим возражение, в отношении технического решения по независимому пункту 2 формулы выявлен признак, отличающий его от технического решения по патентному документу [5], которым, как указано в возражении, является «нанесение энтеросолюбильного покрытия». Составы и технологии для нанесения энтеросолюбильных (кишечнорастворимых) покрытий известны из сведений, раскрытых в учебнике [3]. Влияние отличительного признака на технический результат известно из сведений, раскрытых в источниках [7]-[8].

Признаки фармацевтической композиции, раскрытой в независимом пункте 3 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, известны из источников информации [3], [5]-[8], [11]-[12]. При этом отмечено, что применение композиции в комбинации с другими иммунодепрессантами известно из сведений, раскрытых в патентном документе [13].

Признаки комбинации, раскрытой в независимом пункте 11 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, известны из источников [3]-[13].

Кроме того, в возражении отмечено, что признаки зависимых пунктов 4, 8, 16 и 17 формулы известны из источников информации [5], [6], [15], [16].

На основании изложенного, лицо, подавшее возражение, просит признать оспариваемый патент недействительным полностью.

Второй экземпляр возражения в установленном порядке был направлен в адрес патентообладателя, отзыв от которого поступил в корреспонденции от 16.08.2019.

К отзыву приложены следующие материалы (копии):

- решение Роспатента от 19 декабря 2016 года, на 34 л. (далее – [17]);
- решение Суда по интеллектуальным правам от 06 июля 2018 года, на 44 л. (далее – [18]);
  - статья H.W. Sollinger et al., «Mycophenolate mofetil for the prevention of acute rejection in primary cadaveric renal allograft recipients», *Transplantation*, August 15, 1995, No. 3, Vol. 60, pp. 225-232 (далее – [19]);
  - статья S. Bunnapradist et al., «Mycophenolate mofetil dose reductions and discontinuations after gastrointestinal complications are associated with renal transplant graft failure», *Transplantation*, July 15, 2006, No. 1, Vol. 82, pp.102-107 (далее – [20]);
  - статья W.A. Lee et al, «Bioavailability Improvement of Mycophenolic Acid Through Amino Ester Derivatization», *Pharmaceutical Research*, 1990, Vol. 7, No. 2, pp.161-166 (далее – [21]);
  - статья L. Chan et al., «Patient-Reported Gastrointestinal Symptom Burden and Health-Related Quality of Life following Conversion from Mycophenolate Mofetil to Enteric-Coated Mycophenolate Sodium», *Transplantation*, 15 May 2006, Vol. 81, Number 9, pp.1290-1297 (далее – [22]);
  - статья P. Bolin et al. «Improvement in 3-Month Patient-Reported Gastrointestinal Symptoms After Conversion From Mycophenolate Mofetil to Enteric-Coated Mycophenolate Sodium in Renal Transplant Patients», 15 December 2007, *Transplantation*, Volume 84, Number 11, pp.1443-1451 (далее – [23]);
  - регистрационное удостоверение П N016017/01 от 01.10.2009, на 2 л (далее – [24]);
  - материалы заявки № 98120360/04, на 16 л (далее – [25]).

В отзыве отмечено, что материалы заявки № 98120360 содержат точный перевод материалов международной заявки РСТ/ЕР97/01800. При этом признаки независимых пунктов 1, 3 и 11 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, которые в возражении отмечены как отсутствующие в материалах заявки на дату их подачи, содержатся в материалах заявки № 98120360 на дату ее подачи на странице 2 (строки 17-18, 21-25, 31-32), странице 3 (строки 3-4), странице 7 (строки 16-19), странице 8 (строки 7-19), странице 11 (строки 13-28) и на странице 14 (строки 2-3 пункта 1 формулы изобретения, строки 2-9 пункта 3 формулы изобретения, строки 3-4 пункта 5 формулы изобретения). Таким образом, по мнению патентообладателя, признаки независимых пунктов 1, 3 и 11 формулы по оспариваемому патенту содержались в материалах заявки на дату ее подачи.

Также патентообладатель обращает внимание на то, что описание к оспариваемому патенту содержит исчерпывающие сведения, подтверждающие, что оспариваемая группа изобретений по независимым пунктам 1, 2, 3 и 11 формулы может быть использована в качестве иммуносупрессанта, например, для лечения и предупреждения отторжения трансплантата, которое достигается путем введения фармацевтически приемлемой соли миофеноловой кислоты. В частности, описание к оспариваемому патенту содержит сведения о назначении группы изобретений, а также о средствах и методах, с помощью которых возможно осуществление и реализация назначения оспариваемой группы изобретений.

В отношении соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности изобретательский уровень в отзыве акцентируется внимание на том, что в возражении в качестве технического результата учитывается только результат, заключающийся в улучшении биологической доступности от использования фармацевтической композиции. При этом в отзыве уточняется, что группа изобретений по оспариваемому патенту также направлена на достижение технического

результата, заключающегося в снижении побочных эффектов со стороны ЖКТ, правомерность которого была установлена Судом по интеллектуальным правам в решении от 06 июля 2018 года [18].

Патентообладатель считает, что отличительным признаком группы изобретений по отношению к техническому решению, раскрытыму в патентном документе [5], является «энтеросолюбильное покрытие, обеспечивающее высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта». При этом в отзыве отмечено, что сведения об энтеросолюбильных покрытиях и технологии их нанесения в учебнике [3], указанном в возражении, отсутствуют. Кроме того, по мнению патентообладателя, иные противопоставленные в возражении источники информации также не содержат сведений об энтеросолюбильных покрытиях.

Между тем, патентообладатель подчеркивает, что в учебнике [3] и иных противопоставленных источниках информации также отсутствуют сведения о том, что нанесение энтеросолюбильного покрытия на композицию на основе соли миофеноловой кислоты могло привести к улучшению ее биологической доступности.

При этом в отзыве также отмечено, что энтеросолюбильное покрытие может улучшить биологическую доступность терапевтического агента, предотвращая его разрушение в кислой среде желудка и улучшая тем самым параметры его биологической доступности, однако на дату приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту было известно, что миофеноловая кислота и ее соли стабильны в кислой среде желудка, что подтверждается сведениями, приведенными в статье [21].

Поэтому для специалиста в данной области техники не могло быть очевидно, что нанесение энтеросолюбильного покрытия, обеспечивающего высвобождение действующего вещества в верхней части кишечного тракта, на фармацевтическую композицию, содержащую соль миофеноловой кислоты, приведет к улучшению ее биологической доступности при всасывании в верхней части кишечного тракта.

Патентообладатель также утверждает, что изобретение по оспариваемому патенту отвечает условию патентоспособности «изобретательский уровень» с учетом технического результата, заключающегося в снижении уровня побочных эффектов со стороны ЖКТ, который не был учтен в возражении.

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

С учетом даты подачи заявки (10.04.1997), по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности группы изобретений по указанному патенту включает Патентный закон Российской Федерации за № 3517-І от 23.09.1992 (далее - Закон), и Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные Роспатентом 20.09.1993 и зарегистрированные в Минюсте РФ 5 ноября 1993 г. № 386 (далее - Правила). Кроме того, учитываются положения Договора о патентной кооперации, подписанного в Вашингтоне 19.06.1970, пересмотренного 02.10.1979 и измененного 03.02.1984 (далее - Договор РСТ).

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

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

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.

В соответствии с пунктом 19.5.1.(2) Правил, при установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли

материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения. Проверяется также, описаны ли в первичных материалах заявки средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в независимом пункте формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в материалах заявки допустимо, чтобы указанные средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения. Кроме того, следует убедиться в том, что в случае осуществления изобретения действительно возможна реализация указанного заявителем назначения.

Если установлено, что на дату приоритета изобретения соблюдены все указанные требования, изобретение, охарактеризованное в данном независимом пункте формулы, признается соответствующим условию промышленной применимости.

В соответствии с пунктом 19.5.3.(1) Правил, проверка изобретательского уровня проводится в отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте формулы, и включает:

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

В соответствии с пунктом 3.2.4.2 Правил в качестве аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений, ставших общедоступными до даты приоритета изобретения.

В соответствии с пунктом 19.5.3.(2) Правил, изобретение признается соответствующим условию изобретательского уровня, если не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность

влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

В соответствии с подпунктом (6) пункта 19.5.3 Правил известность влияния отличительных признаков заявленного изобретения на технический результат может быть подтверждена как одним, так и несколькими источниками информации.

В соответствии со статьей 19 Закона приоритет изобретения устанавливается по дате поступления в Патентное ведомство заявки, содержащей заявление о выдаче патента, описание, формулу и чертежи, если в описании на них имеется ссылка.

В соответствии с пунктом 2 статьи 21 Закона материалы изменяют сущность заявленного изобретения, если они содержат подлежащие включению в формулу изобретения признаки, отсутствовавшие в первоначальных материалах заявки.

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

Как отмечалось выше, формула оспариваемого патента на изобретение содержит группу изобретений, представленных независимыми пунктами 1, 2, 3 и 11.

Заявка № 98120360, по которой выдан оспариваемый патент, была подана 10.04.1997 по процедуре РСТ (международный Договор о патентной кооперации (Patent Cooperation Treaty)). Заявке присвоен номер РСТ/EP97/01800.

Первоначальные материалы заявки РСТ/EP97/01800 не обязательно полностью соответствуют материалам, содержащимся в международной публикации [14], которые представлены в возражении. Однако материалы заявки РСТ/EP97/01800 к возражению не приложены. Международная фаза процедуры РСТ завершается переходом заявки в национальную стадию, т.е.

материалы заявки № 98120360 являются переводом материалов международной заявки РСТ/ЕР97/01800 на национальную фазу.

При этом признаки «обеспечивающее высвобождение в верхней части кишечного тракта», характеризующие композицию, раскрытую в независимом пункте 1 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту, раскрыты на странице 2 (абзац 2), странице 3 (абзац 1) и на странице 4 (абзац 2) материалов заявки № 98120360.

Признаки «предназначенная для использования при изготовлении лекарственного средства, обладающего иммунодепрессантной активностью и предназначенного, в частности, для предупреждения или лечения отторжения трансплантата, являющегося аллотрансплантатом или ксенотрансплантатом нативного или трансгенного органа, ткани или клетки, а также для лечения или предупреждения опосредованных иммунной системой и/или воспалительных заболеваний, причем фармацевтическую композицию можно использовать в сочетании с другим иммунодепрессантом, при одновременном или раздельном его введении», характеризующие композицию, раскрытую в независимом пункте 2 формулы оспариваемого патента, раскрыты на странице 2 (абзац 2) и на странице 8 (абзацы 2 и 3) материалов заявки № 98120360.

Признак «комбинация», характеризующий изобретение по независимому пункту 11 формулы, раскрыт на странице 7 (абзац 4) и на странице 11 (абзац 3) описания, а также в пункте 3 формулы, содержащихся в материалах заявки № 98120360.

В отношении признаков «другой иммунодепрессант для одновременного, последовательного или раздельного введения» также характеризующих изобретение по независимому пункту 11 формулы, следует отметить, что они раскрыты в материалах заявки, представленных на дату ее подачи, в частности, на странице 11 (абзацы 3 и 4) и в пунктах 3, 4, 5, 7 формулы.

Таким образом, в возражении отсутствуют доводы и материалы, подтверждающие, что упомянутые выше признаки независимых пунктов 1, 3 и 11 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту не содержались в материалах заявки № 98120360.

В отношении соответствия независимых пунктов 1, 2, 3 и 11 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, условию патентоспособности «промышленная применимость» необходимо отметить следующее.

Техническое решение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента относится к композиции, состоящей из ядра, включающего соль миофеноловой кислоты, и нанесенного на него энтеросолюбильного покрытия, обеспечивающего высвобождение соли в верхней части кишечника.

Средства и методы для осуществления изобретения раскрыты в описании к оспариваемому патенту на с.2. Так, раскрыто, что под термином «ядро» понимается, в частности, химическое соединение - миофенолят натрия (или другая его катионная соль) при необходимости в смеси с физиологически приемлемым материалом, где указанное ядро окружено энтеросолюбильной оболочкой. При этом также раскрыто, какого вида может быть ядро (таблетки, пилюли капсулы и пр.) и каким образом оно может быть изготовлено. Там же, на с.2 описания к оспариваемому патенту, раскрыты виды наполнителей, которые могут быть использованы при изготовлении упомянутых ядер.

На с.3 описания к оспариваемому патенту раскрыто, что понимается под термином «энтеросолюбильное покрытие», с какой целью оно используется при изготовлении лекарственного средства, и описаны условия, в которых указанное покрытие может выполнять свои функции. Кроме того, на с.4 описания раскрыты материалы и способы нанесения покрытия.

Также в описании к оспариваемому патенту подробно раскрыты характеристики композиций и комбинаций, являющихся объектами

изобретений по независимым пунктам 2, 3 и 11 формулы группы изобретений. В частности раскрыты дозировки, биологическая доступность, активность и использование композиций и комбинаций в качестве иммунодепрессантов в указанных в описании случаях заболеваний или состояний. Конкретные примеры композиций приведены на с.6-7 описания к оспариваемому патенту.

Реализация назначения продемонстрирована в клинических опытах на животных, результаты исследований на самцах гончих собак представлены в таблице на с.8.

Можно констатировать, что в описании к оспариваемому патенту приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в независимых пунктах 1, 2, 3 и 11 формулы группы изобретений, с реализацией указанного назначения.

Таким образом, изобретения по независимым пунктам 1, 2, 3 и 11 формулы соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость» в соответствии с требованием пункта 1 статьи 4 Закона и подпункта 2 пункта 19.5.1 Правил.

Что касается источника информации [4], то его содержание не меняет сделанного выше вывода.

В отношении соответствия независимых пунктов 1, 2, 3 и 11 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, условию патентоспособности «изобретательский уровень» необходимо отметить следующее.

Наиболее близким аналогом изобретений по независимым пунктам 1, 2, 3 и 11 формулы, является техническое решение, известное из патентного документа [5]. Техническое решение по патентному документу [5], описывает фармацевтическую композицию, проявляющую противоопухолевую и иммуносупрессорную активность, выполненную, в частности, в форме таблеток, пилюль, капсул, содержащую микофенольную

кислоту или ее соль. Согласно единственному примеру, приведенному в описании к патентному документу [5], композиция содержит 250 частей микофероловой кислоты, 30 частей фосфата кальция, 30 частей кукурузного крахмала и 12 частей стерата магния. Данную композицию получали путем смещивания и гранулирования ингредиентов с последующим прессованием для получения таблеток для перорального введения в терапевтических целях.

Отличие изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента от наиболее близкого аналога заключается в том, что композиция состоит из ядра, включающего активный агент (соль микофероловой кислоты), и нанесенного на него энтеросолюбильного покрытия, обеспечивающего высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта.

Технический результат в описании к оспариваемому патенту в явном виде не указан, однако на с.2 описания отмечено, что после обширных испытаний было установлено, что:

- соли микофероловой кислоты с энтеросолюбильным покрытием, приспособленные для высвобождения в верхней части кишечника, например в двенадцатиперстной кишке, тощей кишке и/или подвздошной кишке, являются эффективными, хорошо переносимыми лекарственными средствами, в частности, для показаний, связанных с иммунодепрессией, особенно для лечения или предупреждения отторжения аллотрансплантата или ксенотрансплантата органа, ткани или клетки, например, после трансплантации или для лечения или предупреждения заболеваний, обусловленных иммунной системой (автоиммунные заболевания), и обладают представляющими интерес характеристиками биологической доступности и стабильности;

- требуется вводить меньшие стандартные дозируемые формы, чем для микофероловой кислоты, что облегчает их введение;

- композиции по оспариваемому изобретению переносятся лучше, чем микофероловая кислота, вызывая менее выраженные побочные действия в

отношении желудочно-кишечного тракта, в частности, такие как диарея и изжога.

При этом, в учебнике [3] отсутствуют сведения о том, что нанесение энтеросолюбильного покрытия на композицию на основе соли микоференоловой кислоты может привести к улучшению ее биологической доступности в верхней части кишечника, например, в двенадцатиперстной кишке, тощей кишке и/или подвздошной кишке. Сведения из упомянутого учебника [3] (с.183-184) раскрывают виды покрытий таблеток оболочками, в случаях когда это предусматривает регламент их производства. В учебнике [3], в том числе, раскрыто, что покрытие может быть нанесено с целью локализовать или пролонгировать действие лекарственного вещества, содержащегося в таблетке, защитить слизистые оболочки пищевода или желудка от разрушающего действия лекарственного вещества.

Здесь целесообразно отметить статью [21], представленную патентообладателем в отзыве, сведения в которой показывают, что микоференоловая кислота и ее соли стабильны в кислой среде желудка.

Таким образом, можно констатировать, что сведения из учебника [3] не мотивируют специалиста в данной области техники к созданию энтеросолюбильного покрытия на ядрах, содержащих микоференоловую кислоту или ее соли с целью достижения технических результатов, заключающихся в улучшении биологической доступности и стабильности упомянутых производных микоференоловой кислоты, вызывая при этом менее выраженные побочные действия в отношении желудочно-кишечного тракта, в частности, таких как диарея и изжога.

Источники информации [6]-[10] также не содержат таких сведений.

Так, в патентном документе [6] содержатся сведения о получении двунатриевой и мононатриевой соли микоференоловой кислоты, однако отсутствует указание на возможность нанесения энтеросолюбильного покрытия на данное вещество для увеличения биодоступности.

В реферате к статье [7] аннотируется исследование пуринового обмена и иммуносупрессивных эффектов миофенолята мофетила, а также содержится упоминание, что сложный эфир миофеноловой кислоты, мофетил миофенолят, гидролизуется в кишечнике и крови с высвобождением миофеноловой кислоты. В данном источнике информации отсутствуют сведения о солях миофеноловой кислоты и об энтеросолюбильных покрытиях.

Статья [8] посвящена исследованию доставки мофетил миофенолята в кишечник для улучшения всасываемости на основании сведений о возможности превращения мофетил миофенолята в миофеноловую кислоту. В результате исследований выявлено, что биодоступность мофетил миофенолята в 1,52 выше, чем биодоступность миофеноловой кислоты.

Можно согласиться с мнением патентообладателя, что действительно, данное исследование информирует специалиста о нежелательности использования энтеросолюбильного покрытия или иного пути доставки миофеноловой кислоты непосредственно в желудочно-кишечный тракт в связи с худшими параметрами всасываемости миофеноловой кислоты из двенадцатиперстной кишки по сравнению с мофетил миофенолятом.

Таким образом, сведения, представленные в статье [8], свидетельствуют об отсутствии каких-либо преимуществ при всасывании миофеноловой кислоты в кишечнике и, как следствие, каких-либо преимуществ в улучшении биодоступности. Сведения о введении миофеноловой кислоты или ее солей, покрытых энтеросолюбильными покрытиями, в статье [8] отсутствуют.

Сведения из учебника [9] относятся к анатомии тонкой кишки. При этом сведения из статьи [10] раскрывают прохождение фармацевтических лекарственных форм через желудок и тонкую кишку, в частности, в зависимости от приема пищи у разных групп пациентов. В статье делается вывод о том, что эффективное разрушение лекарственной формы и растворение лекарственного средства в желудке может являться

значительным преимуществом, если это допускается параметрами стабильности лекарственного вещества. Напротив, чрезмерно эффективная задержка высвобождения лекарственного средства, например, при наличии энтеросолюбильного покрытия может привести к заметному снижению биологической доступности. Таким образом, исследования в статье [10] не мотивируют специалиста к созданию энтеросолюбильного покрытия фармацевтической композиции, содержащей микофероловую кислоту и ее соли. Здесь вновь целесообразно упомянуть статью [21], из которой известно, что микофероловая кислота и ее соли стабильны в кислой среде желудка. В связи с упомянутыми данными не представляется возможным спрогнозировать, в частности, улучшение биодоступности солей микофероловой кислоты с нанесенным энтеросолюбильным покрытием.

С учетом изложенного независимый пункт 1 формулы по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» с учетом положений подпункта 2 пункта 19.5.3 Правил ИЗ.

В отношении независимых пунктов 2, 3 и 11 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, нужно отметить следующее.

Изобретения, раскрытые в упомянутых выше пунктах, также относятся к композициям/комбинациям включающим соль микофероловой кислоты с нанесенным энтеросолюбильным покрытием. При этом композиции по независимым пунктам 3 и 11 могут использоваться в сочетании с другим иммунодепрессантом.

Выше в данном заключении отмечено, что наиболее близким аналогом изобретений по оспариваемому патенту является техническое решение, известное из патентного документа [5].

Отличием композиций по оспариваемому патенту, по существу является энтеросолюбильное покрытие, нанесенное на основу (ядро), представляющую собой соль микофероловой кислоты. При этом покрытие

наносят с целью улучшения биологической доступности лекарственного средства в верхнем отделе желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) и с целью уменьшения побочных реакций со стороны ЖКТ.

Также выше в данном заключении, в отношении композиции по независимому пункту 1 формулы, в результате анализа источников [3], [6]-[10] сделан вывод о том, что в уровне техники не выявлены источники информации, из которых известно применение энтеросолюбильного покрытия с достижением упомянутых технических результатов.

Что касается сведений, раскрытых в статье [11], то они представляют собой отчет об исследованиях иммунодепрессантного эффекта от применения сложного эфира микофеноловой кислоты, микофенолята мофетила, при различных состояниях и заболеваниях и не относятся к энтеросолюбильным покрытиям и их влиянию на указанные, в описанию к оспариваемому патенту, технические результаты.

Статьи [12] и [15], представленные в возражении, не могут быть привлечены к оценке патентоспособности группы изобретений по оспариваемому патенту, поскольку не содержат информации о дате их публикации, что не позволяет включить их в уровень техники, общедоступной до даты приоритета оспариваемого патента.

Представленные патентообладателем источники информации [20], [22], [23] опубликованы позже даты приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту и не могут быть включены в уровень техники при оценке на соответствие условию патентоспособности «изобретательский уровень».

С учетом изложенного, можно констатировать, что независимые пункты 2, 3 и 11 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» с учетом положений подпункта 2 пункта 19.5.3 Правил.

Что касается источников информации [15]-[16] и [24]-[25], представленных патентообладателем, то их содержание не меняет сделанного выше вывода.

Таким образом, в возражении не содержится доводов, позволяющих сделать вывод о несоответствии группы изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «изобретательский уровень». А также в возражении не содержится доводов, свидетельствующих о наличии в формуле изобретения признаков, не раскрытых на дату подачи заявки в документах, представленных на эту дату.

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

**отказать в удовлетворении возражения, поступившего 30.04.2019, патент Российской Федерации на изобретение № 2203659 оставить в силе.**