

**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 10.07.2019 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 микофеноловой кислоты с энтеросолюбильным покрытием» выдан по заявке № 98120360/04 с приоритетом от 12.04.1996 компании НОВАРТИС АГ (Швейцария) (далее – патентообладатель) со следующей формулой:

«1. Фармацевтическая композиция, состоящая из ядра, включающего фармацевтически приемлемую соль микофеноловой 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, условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Кроме того, в возражении отмечено неправомерное установление приоритета и известность зависимых пунктов формулы до даты приоритета.

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]);
- материалы 4-го международного Конгресса по терапевтическому лекарственному мониторингу и клинической токсикологии Pirsch, John D. et al., «Mycophenolate mofetil – Clinical and experimental experience», Therapeutic Drug Monitoring, August 1996, vol. 18, pp. 357-361 (далее – [17]);
- статья James J. Lipsky «Mycophenolate mofetil», Drug profile, The Lancet, Vol. 348, 16 November 1996, pp.1357-1359 (далее – [18]);
- Краткая справка по клиническим исследованиям препарата Миfortик от 10.02.2003 в материалах дела СИП 744-2018 (далее – [19]);
- Инструкция по медицинскому применению лекарственного препарата Миfortик (информация для специалиста) по состоянию на 12.02.2002 в материалах дела СИП 744-2018 (далее – [20]).

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.

Таким образом, 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, раскрытые в статье [10].

Кроме того, в возражении отмечено, что из материалов конференции [17] и из статьи [18] известно, что при введении микоферолята мофетила в организм в качестве побочных эффектов проявляются, среди прочих, проблемы с пищеварительным трактом (рвота, диарея, дискомфорт).

Следовательно, по мнению лица, подавшего возражение, проблемы, возникающие с пищеварительным трактом, могут быть настолько плохо переносимы пациентом, что может возникать вопрос отмены лечения. Избежать проявления подобных побочных эффектов возможно, если препарат всасывается в кишечнике, а не в желудке, путем нанесения на него именно кишечнорастворимого (энтеросолюбильного) покрытия, чтобы защитить стенки желудка.

В возражении отмечено, что признаки фармацевтической композиции, раскрытой в независимом пункте 2 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, известны из источников [3], [5] и [6].

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]. Натриевые соли микофероловой кислоты известны из технических решений, раскрытых в патентных документах [5] и [6]. Композиции на основе соли микофероловой

кислоты раскрыты для технического решения, известного из патентного документа [5].

Влияние отличительного признака на технический результат известно из сведений, раскрытых в источниках [7], [8] и [17].

Признаки фармацевтической композиции, раскрытой в независимом пункте 3 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, известны из источников информации [3], [5]-[8], [11] и [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].

Влияние признаков композиций, раскрытых в независимых пунктах 3 и 11 формулы, характеризующей группу изобретений на технический результат известно из сведений, раскрытых в источниках [7], [8] и [17].

Дополнительно, лицо, подавшее возражение, отмечает эквивалентность признаков «соль микофероловой кислоты» (натриевая соль микофероловой кислоты) и «микоферолят мофетил».

Данное мнение основано на том, что в исследованиях лекарственного препарата, раскрытых в источнике [20], включающих соединение по оспариваемому патенту, описано, что натриевая соль микофероловой кислоты в организме превращается в микофероловую кислоту, что эквивалентно фармакокинетике микоферолята мофетила.

Также отмечено, что вследствие того, что соединения (микоферолят мофетил и натриевая соль микофероловой кислоты) весьма сходны по химической структуре и метаболизму в организме, при регистрации лекарственного средства [19] было проведено не полное клиническое исследование, а исследования биоэквивалентности.

Таким образом, на основании сведений, раскрытых в источниках информации [7], [8] и [20], по мнению лица, подавшего возражение, микоферолят мофетил и натриевая соль микофероловой кислоты являются эквивалентными по фармакокинетике, а значит – взаимозаменяемыми.

Кроме того, в возражении отмечено, что признаки зависимого пункта 4 известны из источников информации [3] и [5], признаки зависимых пунктов 8 и 16 известны из источников информации [5] и [6], а признаки зависимого пункта 17 известны из источников информации [15] и [16].

В отношении неправомерного установления приоритета, лицом, подавшим возражение, отмечено, что при анализе материалов приоритетных заявок установлено, что некоторые признаки, указанные в независимых пунктах 1, 3 и 11 формулы изобретения по оспариваемому патенту, отсутствуют в первичных материалах заявки, а именно, в заявке [1], имеющей дату приоритета от 12.04.1996, и заявке [2], имеющей дату приоритета от 24.10.1996.

Так, по мнению лица, подавшего возражение, независимый пункт 1 формулы содержит признак «...обеспечивающего высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта». При этом в результате анализа описания и примеров, раскрытых в приоритетных заявках, не выявлено подтверждения того, что в случае нанесения энтеросолюбильного покрытия на композицию, включающую ядро с фармацевтически приемлемой солью микофероловой кислоты, ее высвобождение будет происходить именно в верхней части кишечного тракта, что обеспечит улучшенную биодоступность. Кроме того, в приоритетных заявках не указано, что энтеросолюбильное покрытие может способствовать высвобождению действующего вещества именно в верхней части кишечника.

Сведения о том, что указанная в качестве изобретения фармацевтическая композиция имеет энтеросолюбильное покрытие, которое «модифицировано для высвобождения микоферолята в верхней части кишечника», можно найти только в приоритетной заявке [2].

Независимый пункт 3 формулы изобретения по оспариваемому патенту указывает на назначение фармацевтической композиции «...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».

В возражении отмечено, что в приоритетных заявках отсутствуют примеры, раскрывающие биологические исследования того, что данная композиция, содержащая соль миофеноловой кислоты с энтеролюбильным покрытием, может быть использована для лечения различных состояний при отторжении разного рода трансплантата, в том числе такого широкого ряда тканей и органов. Кроме того отмечено, что материалами приоритетных заявок также не подтверждается применение данной композиции в комбинации с другим иммунодепрессантом.

Независимый пункт 11 формулы изобретения по оспариваемому патенту раскрывает объект «композиция», которая характеризуется признаком «...другой иммунодепрессант для одновременного, последовательного или раздельного введения». Однако по мнению лица, подавшего возражение, материалы приоритетных заявок не содержат примеров или иного подтверждения применения комбинации, включающей соль миофеноловой кислоты и другой иммунодепрессант, например, циклоспорин.

На основании вышеизложенного в возражении сделан вывод о том, что в части признаков независимых пунктов 1, 3 и 11 формулы изобретения приоритет не может быть установлен на основании приоритетных заявок [1]

и [2], а должен быть установлен по дате подачи заявки [14], а именно, от 10.04.1997.

Второй экземпляр возражения в установленном порядке был направлен в адрес патентообладателя, отзыв от которого поступил в корреспонденции от 01.10.2019.

К отзыву приложены следующие материалы (копии):

- решение Роспатента от 19 декабря 2016 года, на 34 л. (далее – [21]);
- решение Суда по интеллектуальным правам от 06 июля 2018 года, на 44 л. (далее – [22]);
 - 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 – [23]);
 - 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 – [24]);
 - 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 – [25]);
 - 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 – [26]);
 - 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 – [27]);

- регистрационное удостоверение П N016017/01 от 01.10.2009, на 2 л (далее – [28]);
- экспертный отчет Минздрав РФ «Научный центр экспертизы средств медицинского применения. Институт доклинической и клинической экспертизы лекарственных средств» от 15.10.2004, фрагменты на 4 л. (далее – [29]);
- решение Суда по интеллектуальным правам от 19 июля 2018 года на 44 л. (далее – [30]).

В отношении соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности изобретательский уровень отмечает, что отличительным признаком группы изобретений по отношению к техническому решению, раскрытым 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 микофероловой 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 микофероловая кислота и ее соли стабильны в кислой среде желудка, что подтверждается сведениями, приведенными в статье [25].

Поэтому для специалиста в данной области техники, с учетом сведений содержащихся в источниках информации [6] -[10], не очевидно, что нанесение энтеросолюбильного покрытия, обеспечивающего высвобождение действующего вещества в верхней части кишечного тракта (далее ЖКТ), 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.

При этом в отзыве отмечено, что источники информации [17] и [18] не являются уровнем техники, поскольку стали общедоступны позднее даты приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту. Вместе с тем, лицо, подавшее возражение, отмечает, что сведения, раскрытые в источниках информации [17] и [18], относятся к исследованию только мофетил миофенолята, и побочные эффекты со стороны ЖКТ также наблюдались при введении мофетил миофенолята, а не миофеноловой кислоты или ее солей лежащих в основе группы изобретений по оспариваемому патенту.

В отношении довода, изложенного в возражении, о неправомерно установленном приоритете группы изобретений по оспариваемому патенту в отзыве отмечено, что приоритет установлен по дате подачи более ранних заявок [1] от 12.04.1996 и [2] от 24.10.1996. При этом, по мнению патентообладателя, упомянутый довод не соответствует фактическим обстоятельствам, поскольку все указанные в возражении признаки оспариваемой группы изобретений содержатся в приоритетных документах. В подтверждение своего мнения патентообладатель представил таблицы соответствия признаков группы изобретений по оспариваемому патенту признакам, раскрытым в заявках [1] и [2], по которым установлен приоритет.

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

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 19 Закона приоритет может быть установлен по дате подачи первой заявки в государстве - участнике Парижской конвенции по охране промышленной собственности (конвенционный приоритет).

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.3.1 Правил при испрашивании конвенционного приоритета в соответствии с пунктом 2 статьи 19 Закона проверяется наличие копии первой заявки, поданной заявителем в государстве - участнике Парижской конвенции по охране

промышленной собственности (далее - Парижская конвенция) и раскрытие заявляемого изобретения в первой заявке.

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.

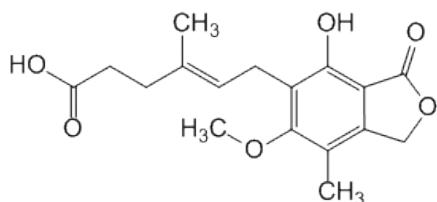
Как отмечалось выше, формула оспариваемого патента на изобретение содержит группу изобретений, представленных независимыми пунктами 1, 2, 3 и 11.

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

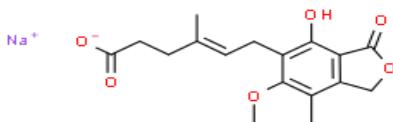
Группа изобретений по оспариваемому патенту относится к фармацевтическим композициям и комбинациям, фармакологическое действие которых основано на использовании фармацевтически приемлемых солях миофеноловой кислоты, в частности, мононатриевой соли миофеноловой кислоты.

В отношении довода возражения об эквивалентности и взаимозаменяемости понятий «соль миофеноловой кислоты» и «миофенолят натрия» необходимо отметить следующее.

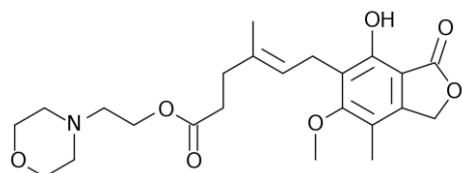
Миофеноловая кислота имеет следующую структурную формулу:



Мононатриевая соль миофеноловой кислоты может быть структурно изображена следующим образом:



Миофенолят мофетил является не солью миофеноловой кислоты, а морфолинэтиловым эфиром миофеноловой кислоты, который имеет следующую структурную формулу:



Как видно, рассматриваемые соединения, в частности, мононатриевая соль миофеноловой кислоты и миофенолят мофетил, вопреки утверждению лица, подавшего возражения, не являются сходными по химической структуре, а напротив относятся к разным классам химических соединений (соли и сложные эфиры).

В отношении их фармакологической эквивалентности на основании сведений представленных в возражении можно отметить следующее.

В реферате к статье [7] содержится упоминание о том, что сложный эфир миофеноловой кислоты (мофетил миофенолят) гидролизуется в кишечнике с высвобождением миофеноловой кислоты.

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

Материалы конгресса [17] относятся к исследованию только мофетил миофенолята и побочные эффекты со стороны ЖКТ также наблюдались при введении мофетил миофенолята, а не миофеноловой кислоты или ее солей.

Статья [18] также касается исследования только мофетил миофенолята. При этом в статье [18] содержатся сведения о наличии побочных эффектов со стороны ЖКТ при введении миофеноловой кислоты, но не солей миофеноловой кислоты.

Таким образом, в возражении не представлено каких-либо источников информации, подтверждающих доводы лица, подавшего возражение об эквивалентности понятий «соль миофеноловой кислоты» и «миофенолят натрия».

В отношении выбора наиболее близкого аналога по отношению к группе изобретений по оспариваемому патенту можно согласиться с мнением патентообладателя, что таким аналогом для 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 миофенольную кислоту или ее соль. Согласно единственному примеру, приведенному в описании к патентному документу [5], композиция содержит 250 частей миофеноловой кислоты, 30 частей фосфата кальция, 30 частей кукурузного крахмала и 12 частей стерата магния. Данную композицию получали путем смешивания 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 миофеноловой 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 миофеноловой 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 миофеноловой кислоты, что облегчает их введение;

- композиции по оспариваемому изобретению переносятся лучше, чем миофеноловая кислота, вызывая менее выраженные побочные действия в отношении ЖКТ, 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 миофеноловой 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 [25], 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 ЖКТ, 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 микоференолята мофетила, а также содержится упоминание, что сложный эфир микоференоловой кислоты, мофетил микоференолят, гидролизуется в кишечнике и крови с высвобождением микоференоловой кислоты. В данном источнике информации отсутствуют сведения о солях микоференоловой кислоты и об энтеросолюбильных покрытиях.

Статья [8] посвящена исследованию доставки мофетил микоференолята в кишечник для улучшения всасываемости на основании сведений о возможности превращения мофетил микоференолята в микоференоловую кислоту. В результате исследований выявлено, что биодоступность мофетил микоференолята в 1,52 выше, чем биодоступность микоференоловой 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 ЖКТ 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 миофеноловую кислоту и ее соли. Здесь вновь целесообразно упомянуть статью [25], из которой известно, что миофеноловая кислота и ее соли стабильны в кислой среде желудка. В связи с упомянутыми данными не представляется возможным спрогнозировать, в частности, улучшение биодоступности солей миофеноловой кислоты с нанесенным энтеросолюбильным покрытием.

Материалы конгресса [17] описывают экспериментальный и клинический опыт применения миофенолята мофетила в профилактике отторжения почечного трансплантата. Материалы [17] не относятся к исследованию солей миофеноловой кислоты.

Статья [18] относится к изучению миофенолята мофетила в качестве иммуносупрессивного препарата. В данной статье отмечено, что миофенолят мофетил представляет собой пролекарство (сложный эфир) миофеноловой кислоты и активной частью миофенолята мофетила является миофеноловая кислота. В отношении нежелательных явлений (побочных эффектов) в статье [18] отмечено, что при длительном лечении миофенолятом мофетилом псориаза у больных отмечались побочные симптомы со стороны ЖКТ, в частности, тошнота, диарея и нарушение перистальтики кишечника. При этом отмечено, что в данных исследованиях не формировалась контрольная группа для сравнения действия миофеноловой кислоты и миофенолята мофетила. Более того, в статье [18] какие-либо соли миофеноловой кислоты не исследовались.

Таким образом, сведения из материалов [17] и статьи [18] не мотивируют специалиста на создание композиции, в которой энтеросолюбильное покрытие, нанесенное на ядро, которым являются соли миофеноловой кислоты, будет обеспечивать снижение побочных эффектов со стороны ЖКТ.

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, раскрытие в упомянутых выше пунктах, также относятся к композициям/комбинациям включающим соль миофеноловой

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 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], [17] и [18] 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 микофероловой кислоты (микоферолята мофетила) при различных состояниях и заболеваниях и не относятся к энтеросолюбильным покрытиям и их влиянию на указанные, в описании 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 [24], [26], [27], 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 [19]-[20], [21]-[22] и [28]-[29], то их содержание не меняет сделанного выше вывода.

Поскольку проанализированные выше в настоящем заключении, материалы [17] и [18] не раскрывают признаков группы изобретений по оспариваемому патенту и, соответственно, влияние таких признаков на технические результаты, то вопрос об их включении в уровень техники после даты приоритета не требует рассмотрения.

В связи со сделанным выше выводом о соответствии независимых пунктов 1, 2, 3 и 11 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» анализ известности из уровня техники зависимых пунктов не проводился (пункт 19.5.3(8) Правил).

Таким образом, в возражении не содержится доводов, позволяющих сделать вывод о несоответствии группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень».

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 10.07.2019.