

**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 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 № 644/261, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020 № 59454 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2391097, поступившее 21.04.2021 от КРКА, д.д., Ново Место (Словения) (далее – лицо, подавшее возражение), при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2391097 на группу изобретений «Композиция и способ прямого прессования» выдан по заявке № 2006130009 с приоритетом от 20.01.2004 на имя НОВАРТИС АГ (Швейцария) (далее - патентообладатель). Патент действует со следующей формулой:

«1. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования, в которой дисперсия включает частицы, содержащие ингибитор ДПП-IV, представляющий собой (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения, причем по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм.

2. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой дисперсия включает частицы, содержащие ингибитор ДПП-IV, представляющий собой (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения, и при этом

- (a) по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм, предпочтительно от 10 до 250 мкм;
- (b) отношение толщины к массе таблетки составляет от 0,002 до 0,06 мм/мг или от 0,01 до 0,03 мм/мг.

3. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1 или 2, в которой дисперсия включает частицы, содержащие ингибитор ДПП-IV, представляющий собой (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения, и при этом

- (a) по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм, предпочтительно от 10 до 250 мкм;
- (b) содержание воды в таблетке составляет менее 10% через 1 неделю при 25°C и 60% относительной влажности в помещении, и
- (c) отношение толщины к массе таблетки составляет от 0,002 до 0,06 мм/мг.

4. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой распределение частиц по размерам в таблетке составляет от 50 до 150 мкм.

5. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой содержание воды в таблетке составляет менее 5% через 1 неделю при 25°C и 60% относительной влажности в помещении.

6. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой отношение толщины к массе таблетки составляет от 0,01 до 0,03 мм/мг.

7. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой по меньшей мере 60% или по меньшей мере 80% распределения частиц по размерам в таблетке составляет от 10 до 250 мкм.

8. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой по меньшей мере 25% или по меньшей мере 35% распределения частиц по размерам в таблетке составляет от 50 до 150 мкм.

9. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, где таблетка содержит

- (a) 5-60 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии ингибитора ДПП-IV, представляющего собой (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения;
- (b) 40-95 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого разбавителя;
- (c) 0-20 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого вещества, обеспечивающего распадаемость; и необязательно
- (d) 0,1-10 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого смазывающего вещества.

10. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9, где таблетка содержит

- (a) 20-40%, предпочтительно 20-35 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии ингибитора ДПП-IV, представляющего собой (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения;
- (b) 40-95 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого разбавителя;
- (c) 0-10 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого вещества, обеспечивающего распадаемость; и необязательно

(d) 0,25-6 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого смазывающего вещества.

11. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9 или 10, где таблетка содержит

(a) 20-35 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидина в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения;

(b) 62-78 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого разбавителя;

(c) 0-10 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого вещества, обеспечивающего распадаемость; и необязательно

(d) 0,1-10 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого смазывающего вещества.

12. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9 или 10, где таблетка содержит (a) 22-28 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидина в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения.

13. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9 или 10, где таблетка содержит

(a) 30-35 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидина в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения; и

(b) 58-72 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого разбавителя.

14. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9 или 10, включающая:

i) 1 или 2 разбавителя, выбранные из группы, включающей микрокристаллическую целлюлозу и лактозу,

ii) эти 2 разбавителя - микрокристаллическую целлюлозу и лактозу,

iii) 25-70%, предпочтительно - 35-55 мас.% в пересчете на массу разбавителей в сухом состоянии фармацевтически приемлемой микрокристаллической целлюлозы, или

iv) 25-70%, предпочтительно - 35-55 мас.% в пересчете на массу разбавителей в сухом состоянии фармацевтически приемлемой микрокристаллической целлюлозы и 5-40%, предпочтительно - 18-35 мас.% в пересчете на массу разбавителей в сухом состоянии лактозы.

15. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9 или 10, включающая:

(c) 1-6 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого вещества, обеспечивающего распадаемость; и/или

(d) 0,1-10 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого смазывающего вещества.

16. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9 или 10, включающая:

(a) 20-35 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидина в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения;

(b) 25-70% мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой микрокристаллической целлюлозы;

(c) 5-40 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой лактозы;

(d) 0-10 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой натриевой соли гликолята крахмала; и дополнительно

(e) 0,25-6 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии стеарата магния.

17. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9 или 10, включающая:

(a) 30-35%, предпочтительно - 30-32 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидина в свободной форме или в форме кислотной соли

присоединения;

(b) 35-50%, предпочтительно - 40-45 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой микрокристаллической целлюлозы;

(c) 18-35%, предпочтительно - 20-25 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой лактозы;

(d) 1-4%, предпочтительно - 1,5-2,5 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой натриевой соли гликолята крахмала; и дополнительно

(e) 0,5-4%, предпочтительно - 0,1-2 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии стеарата магния.

18. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9 или 10, включающая:

(a) 20-35%, предпочтительно - 22-28 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидина в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения;

(b) 35-55 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой микрокристаллической целлюлозы;

(c) 18-35 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой лактозы;

(d) 1-4 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой натриевой соли гликолята крахмала; и дополнительно

(e) 0,5-4 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии стеарата магния.

19. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.9 или 10, включающая:

(a) от примерно 22 до примерно 28 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидина в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения;

(b) от примерно 45 до примерно 50 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой микрокристаллической целлюлозы;

(c) от примерно 20 до примерно 25 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой лактозы;

(d) от примерно 1,5 до примерно 2,5 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой натриевой соли гликолята крахмала; и дополнительно

(e) от примерно 0,1 до примерно 2 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии стеарата магния.

20. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по любому из пп.1, 2, 4-10, из которой

(a) между 0 и 10 мин высвобождается 85-99,5% активного компонента и

(б) между 10 и 15 мин высвобождается 90-99,5% активного компонента.

21. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по любому из пп.1, 2, 4-10, в которой распределение частиц по размерам фармацевтически приемлемых эксципиентов в таблетке составляет от 5 до 400 мкм.

22. Спрессованная фармацевтическая таблетка по любому из пп.1, 2, 4-10, которая представляет собой фармацевтическую таблетку, полученную прямым прессованием.

23. Способ получения таблетки прямого прессования по любому из пп.1-22, в виде разовой дозированной формы, который включает:

(a) смешивание в количествах, выраженных в мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии:

(i) 6-60 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии ингибитора ДПП-IV и

(ii) по крайней мере одного эксципиента, выбранного из разбавителя, вещества, обеспечивающего распадаемость, и смазывающего вещества, с образованием композиции ингибитора ДПП-IV в форме таблетлирующегося

порошка, пригодного для прямого прессования в таблетку; и  
(b) прессование композиции, полученной на стадии (a), с получением спрессованной таблетки ингибитора ДПП-IV в виде разовой дозированной формы, причем упомянутый ингибитор ДПП-IV представляет собой (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения.

24. Способ по п.23, в котором смешанную композицию, используемую на стадии (a), выбирают из композиций по пп.9-19.

25. Способ получения таблетки прямого прессования по любому из пп.1-22, в виде разовой дозированной формы, который включает:

(a) смешивание в количествах, выраженных в мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии:

(i) 23-35 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии ингибитора ДПП-IV;

(ii) 40-95 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого разбавителя;

(iii) 0-10 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого вещества, обеспечивающего распадаемость;

(iv) 0,25-6 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемого смазывающего вещества;

с получением композиции ингибитора ДПП-IV в форме таблетизирующегося порошка, пригодного для прямого прессования в таблетку; и

(b) прессование композиции, полученной на стадии (a), с получением спрессованной таблетки ингибитора ДПП-IV в виде разовой дозированной формы, причем упомянутый ингибитор ДПП-IV представляет собой (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения.

26. Способ по п.25, в котором смешанная композиция включает:

(a) 20-35 мас.% или предпочтительно 25-30 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-



цианопирролидина в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения;

(b) 25-70 мас.% или предпочтительно 35-50 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой микрокристаллической целлюлозы, такой как Avicel PH 102;

(c) 5-40 мас.% или предпочтительно 18-35 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой лактозы;

(d) 0-10 мас.% или предпочтительно 1-4 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии фармацевтически приемлемой натриевой соли гликолята крахмала;

(e) 0,25-6 мас.% или предпочтительно 0,5-4 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии стеарата магния».

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса поступило возражение, мотивированное несоответствием группы изобретений по независимым пунктам 1, 23, 25 формулы оспариваемого патента условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «изобретательский уровень».

К возражению приложены копии следующих материалов:

- патентный документ WO 00/34241, дата публикации 15.06.2000 (далее – [1]);

- статья Julia Z. H. Gao et al, «Fluid bed granulation of a poorly water soluble, low density, micronized drug: comparison with high shear granulation», International Journal of Pharmaceutics, 237, 2002, 1-14 (далее – [2]);

- патентный документ WO 01/52825, дата публикации 26.07.2001 (далее – [3]);

- книга L. Lachman And H. A. Lieberman «The Theory And Practice Of Industrial Pharmacy», (3rd Edition, Indian Edition), VARGHESE PUBLISHING HOUSE, 1987, pp. 313-328 (далее – [4]);

- справочник Pharmaceutical Dosage Forms, Tablets, ed.: H.A. Liebermann, L. Lachman, vol. 1, 1980, pp. 3-4 (далее – [5]);

- справочник *Pharmaceutical Dosage Forms, Tablets*, ed.: H.A. Liebermann et al., vol. 1, 1989, pp. 195-220 (далее – [6]);

- руководство *Handbook of Pharmaceutical Excipients*, ed.: A.H. Kibbe, 2000, pp. 102-106, 276-285, 305-308, 501-504 (далее – [7]).

В отношении несоответствия изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость» в возражении отмечено, что в родовом понятии содержится признак «прессованная таблетка», под определение которого подпадает любая таблетка, изготовленная способом мокрого гранулирования, прямого прессования или сухого гранулирования.

По мнению лица, подавшего возражение, в описании к оспариваемому патенту должны быть приведены доказательства, что при выборе любой альтернативы в совокупности с другими признаками, включенными в формулу изобретения, обеспечивается получение одного и того же технического результата. Кроме того, в возражении отмечено, что для каждой альтернативы должны быть указаны средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в каждом из пунктов формулы изобретения.

Так, для спрессованной фармацевтической таблетки по оспариваемому патенту, получаемой, по мнению лица, подавшего возражение, тремя альтернативными способами, отличающимися как своими операциями, так и требованиями, предъявляемыми к используемым при изготовлении таблеток композициям, в описании патента должны быть приведены сведения, подтверждающие, что при любом допуске указанной альтернативой выборе в совокупности с другими признаками, включенными в формулу изобретения, обеспечивается получение одного и того же технического результата. При этом в рассматриваемом случае технический результат заключается прежде всего в получении таблетки, обладающей необходимыми физическими характеристиками, поскольку при их несоответствии принятым

стандартам таблетки не могут быть использованы в гражданском обороте по своему прямому назначению.

Кроме того, в возражении приведена критика в отношении несоблюдения в формуле группы изобретений по оспариваемому патенту требований предъявляемых к формуле изобретения.

Вместе с тем, в возражении сделан вывод о несоответствии условию патентоспособности «промышленная применимость» объекта изобретения по независимому пункту 1 формулы, а также зависимых от него пунктов 2 - 8, поскольку в описании изобретения отсутствуют примеры, подтверждающие, что указанное назначение изобретения можно реализовать только за счет распределения в таблетке, по меньшей мере, 60% частиц по размерам менее 250 мкм, без такого существенного, по мнению лица, подавшего возражение, признака, как наличие в составе таблетки инертного наполнителя. Также отмечено отсутствие средств и методов для осуществления изобретения по независимому пункту 1 формулы и зависимых от него пунктов.

Кроме того, в отношении объекта, раскрытого в независимом пункте 25 формулы оспариваемого патента в возражении отмечено, что при максимальном количестве разбавителя (95 мас.%) смесь не может включать даже минимальное количество ингибитора ДПП-IV (23 мас.%), т.к. их сумма будет существенно больше 100 мас.%, а именно,  $95\% + 23\% = 118\%$ . Кроме того, указанное количество входящих в композицию ингредиентов составит больше 100% без учета содержания вещества, обеспечивающего распадаемость, и смазывающего вещества, которые также могут входить в состав композиции.

Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что в указанных пределах количественного содержания входящих в композицию ингредиентов изобретение по независимому пункту 25 формулы оспариваемого патента не может быть реализовано.

В отношении несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в

возражении отмечено, что изобретения по независимым пунктам 1, 23 и 25 формулы для специалиста явным образом следуют из уровня техники.

В качестве наиболее близкого аналога по отношению к таблетке по оспариваемому патенту в возражении указано техническое решение, известное из документа [1].

При этом признаками, которыми изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента отличается от таблеток, раскрытых в патентном документе [1], являются признаки, характеризующие, что таблетка получена методом прямого прессования, в которой, по меньшей мере, 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм.

При этом, по мнению лица, подавшего возражение, в описании к оспариваемому патенту отсутствует какое-либо указание на неожиданный эффект, который мог бы рассматриваться в качестве технического результата и для которого было бы показано, что он связан с конкретным распределением частиц по размерам.

Также, в возражении отмечено, что из уровня техники известно о том, что в отношении активного ингредиента важно определить влияние размера частиц на сжимаемость, а также влияние кристаллической формы или аморфной на сжимаемость (см., например, источник информации [6] (с. 215)). При этом данные таких исследований в описании оспариваемого патента отсутствуют.

Вместе с тем, лицом, подавшим возражение, отмечено, что согласно описанию к оспариваемому патенту без инертных наполнителей большинство лекарственных средств и фармацевтических ингредиентов невозможно подвергнуть прямому прессованию в таблетки. При этом в возражении отмечено, что увеличения прочности таблетки нельзя добиться без разбавления композиции достаточным количеством наполнителя, обладающим превосходной прессуемостью, т.к. таблетки с содержанием вилдаглипина (LAF237) обладают низкой твердостью/прочностью на раздавливание (см. пример 4 описания к оспариваемому патенту).

В возражении отмечается, что в качестве наполнителей, используемых при изготовлении таблеток, могут использоваться микрокристаллическая целлюлоза и лактоза, в качестве вещества, обеспечивающего распадаемость, может использоваться натриевая соль гликолята крахмала, и в качестве смазывающего вещества может использоваться стеарат магния и др.

Однако, по мнению лица, подавшего возражение, все указанные ингредиенты были известны из уровня техники до даты подачи заявки и подробно описаны в документах [4] и [6].

Кроме того, в возражении отмечено, что носитель (лекарственное средство и/или наполнитель - связующее) должен включать диапазон размеров частиц, максимально приближенных к размеру частиц активных ингредиентов. Этот диапазон должен быть относительно узким и включать небольшой процент как крупных, так и мелких частиц, чтобы гарантировать, что пустоты между более крупными частицами лекарственных средств или наполнителей заполняются частицами меньшего размера и мелкими частицами (документ [6], с.200).

Раскрытые в описании к оспариваемому патенту марки микрокристаллической целлюлозы были известны из уровня техники, а размеры их частиц находились в пределах диапазона от 60 до 200 мкм (документ [7], с. 103, табл. 1).

Сведения, представленные в документе [2], раскрывают исследование различных способов изготовления таблеток, в том числе с использованием грануляции в жидком слое и грануляции с высоким сдвигом, в которых перед проведением грануляции смешивают частицы активного вещества (составляющего 52% гранулята) с целлюлозным связующим (документ [2], п.2.1, п.2.2) при этом согласно сведениям из таблицы 3 около 80% частиц указанной смеси имеют размеры от 37 до 297 мкм (документ [2], табл.3).

Исходя из изложенного и с учетом сведений, известных из документов [1], [2], [4], [5], [6] и [7], в возражении сделан вывод, что заявленная в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента спрессованная

фармацевтическая таблетка, а также признаки зависимых пунктов формулы, характеризующие состав таблеток, основаны на добавлении к известной фармацевтической композиции, содержащей вилдаглиптин, известных инертных наполнителей, используемых как при прямом прессовании, так и при изготовлении таблеток способами сухого и мокрого гранулирования, с использованием известных правил и рекомендаций и достижением ожидаемого технического результата, обусловленного известными свойствами данных ингредиентов.

В отношении способов по независимым пунктам 23 и 25 формулы оспариваемого патента в возражении отмечено, что поскольку операции смешивания и прессования присущи любому способу прессования, в том числе прямому прессованию, а также прессованию с использованием сухого и влажного гранулирования (см. документ [1], перевод с. 18-19; документ [2], п.2.9; документ [6], с. 195, 196, документ [3], с. 38, пример 1), вся новизна заявленных способов сводится к составу используемых ингредиентов.

Однако, по мнению лица, подавшего возражение, из уровня техники известна спрессованная фармацевтическая таблетка, в которой процентное содержание вилдаглиптина и инертных наполнителей находится в диапазоне содержания ингредиентов, приведенных в независимых пунктах 23 и 25 формулы оспариваемого патента, а также известен состав и свойства используемых инертных наполнителей (см. документ [1], с. 18, и документы [4], [6], [7]).

При этом в возражении отмечено отсутствие причинно-следственной связи между влиянием распределения по размерам частиц вилдаглиптина на способ изготовления таблеток и заявленным техническим результатом.

Таким образом, в отношении способов по независимым пунктам 23 и 25 формулы оспариваемого патента в возражении сделан вывод о том, что для специалиста они явным образом следуют из уровня техники.

От патентообладателя, уведомленного в установленном порядке о поступлении и содержании возражения, в корреспонденции от 28.06.2021 поступил отзыв на указанное возражение.

В отзыве патентообладатель выразил несогласие с доводами возражения.

Относительно соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость» в отзыве отмечено, что в описании оспариваемого патента содержатся исчерпывающие сведения о назначении изобретения. Также в описании патента приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в формуле оспариваемого патента.

Так, в отзыве отмечено, что в описании оспариваемого патента указано, что средствами, с помощью которых возможно осуществление изобретения, являются: в качестве активного ингредиента - ингибиторы ДПП-IV, в том числе вилдаглиптин (с.32, строки 44-46 описания), в качестве вспомогательных инертных веществ - наполнитель, связующее, смазывающее вещество и вещество, придающее скользкость (с.12, строка 39 - с.13, строка 30 описания). Кроме того, в описании оспариваемого патента изложены основные методы, известные специалисту в данной области, для получения спрессованных таблеток, в том числе таблеток, полученных прямым прессованием (с.12-15 описания).

В разделе описания «определение распределения частиц по размерам с помощью ситового анализа» (с.27, строка 45 - с.28, строка 21, с.35, пример б) указаны средства и методы, с помощью которых специалист в данной области способен определить распределение частиц по размерам в дисперсии таблетки, и приведены соответствующие источники информации, в которых описаны упомянутые средства и методы.

По мнению патентообладателя, средства и методы для определения содержания воды в таблетке и толщины таблетки также раскрыты в описании

оспариваемого патента, и приведены соответствующие источники информации, в которых описаны упомянутые средства и методы (с.28, строки 23-43).

Патентообладатель акцентирует внимание на том, что примеры 1 и 2 описания иллюстрируют способ получения таблеток по оспариваемому патенту и состав полученной таблетки, а сведения о том, как получить частицы вилдаглиптина, обладающие размерами в необходимом диапазоне, содержатся в примере 6. При этом в примерах 3 и 5 описания приведены методики исследования таблеток, результаты которых позволили сделать вывод о достижении технического результата, связанного с улучшением параметров твердости, прочности, стойкости к разламыванию и времени распада таблетки по оспариваемому патенту. В примере 4 описания показано, что композиции и выбранные диапазоны являются особенно подходящими для обеспечения необходимой прессуемости.

Вместе с тем, в отзыве отмечено, что из уровня техники, в частности, из документа [1], известно о получении таблеток вилдаглиптина способом влажного гранулирования, в котором ингибитор ДПП-IV (вилдаглиптин) смешивают с лактозой и картофельным крахмалом, смесь увлажняют спиртовым раствором желатина и гранулируют с помощью сита. После сушки смешивают остаток картофельного крахмала, тальк, стеарат магния и высокодисперсный кремнезем и смесь прессуют, получая таблетки.

В отношении реализации назначения в отзыве отмечено, что в примерах 1 и 2 (с.33-34 описания) продемонстрировано получение смеси, подходящей для получения таблеток, из приготовленных смесей получают спрессованные таблетки известными специалисту методами. В примере 6 (с.36, последний абзац) показано получение вилдаглиптина с распределением частиц в необходимом диапазоне.

В подтверждение своих доводов патентообладатель ссылается на практику Суда по интеллектуальным правам, в соответствии с которой «критерий «промышленная применимость» предполагает лишь



принципиальную пригодность изобретения для использования в какой-либо из отраслей промышленности, требованию промышленной применимости могут соответствовать изобретения, которые реализуемы лишь однократно в специфических, неповторимых условиях». При этом патентообладатель отмечает, что большинство приведенных в возражении доводов не имеют отношения к проверке промышленной применимости изобретения.

Вместе с тем, патентообладатель обращает внимание на то, что в описании оспариваемого патента также говорится, что улучшение параметров прессуемости, твердости, прочности, стойкости к разламыванию и времени распада таблетки, т.е. технический результат, достигается за счет использования частиц вилдаглиптина с определенным указанным в формуле распределением по размерам (с.24, строки 16-26, с.27, строки 20-22 описания).

Таким образом, по мнению патентообладателя, независимый пункт 1 формулы оспариваемого патента содержит совокупность существенных признаков изобретения, достаточную для достижения технического результата.

Относительно соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в отзыве отмечено следующее.

Отличительным признаком изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента по отношению к наиболее близкому аналогу, известному из документа [1], является признак, характеризующий, что в таблетке находится «по меньшей мере 60% распределения частиц вилдаглиптина с размером менее чем 250 мкм». Кроме того, в документе [1] отсутствуют сведения о том, что таблетку получают прямым прессованием.

Как отмечено в отзыве, в возражении не приведены источники информации, из которых известны упомянутые выше отличительные признаки изобретения. В частности, отмечено, что такие сведения отсутствуют в документах [1], [2], [4], [5], [6], [7].

По мнению патентообладателя, в возражении также отсутствует анализ уровня техники с целью установления известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на технический результат, заключающийся в улучшении параметров прессуемости, твердости, прочности, стойкости к разламыванию и времени распада таблетки по оспариваемому патенту.

Кроме того, в отзыве отмечено, что в документе [1] приведен пример фармацевтической композиции в форме таблетки, но отсутствуют сведения в отношении улучшения параметров прессуемости, твердости, прочности, стойкости к разламыванию и времени распада таблетки. В документе [2] раскрываются таблетки с совершенно иным профилем растворения, чем в таблетке по оспариваемому патенту.

Патентообладатель также обращает внимание на то, что при оценке соответствия условию патентоспособности «изобретательский уровень» изобретения по оспариваемому патенту следует рассматривать тот технический результат, который был установлен заявителем и который заключается в улучшении параметров прессуемости, твердости, прочности, стойкости к разламыванию и времени распада запатентованной таблетки. Указанный технический результат объективно проявляется при использовании изобретения, однозначно следует из примеров и раскрыт в них.

К отзыву приложены следующие источники информации (копии):

- книга В.И. Чуешов «Промышленная технология лекарств», том 2, X: МТК-Книга; Издательство НФАУ, 2002 (далее – [8]);
- решение Роспатента (патент 2391097) от 30.07.2020 (далее – [9]);
- решение Суда по интеллектуальным правам от 06.07.2018 по делу № СИП-152/2017 (далее – [10]);
- решение Суда по интеллектуальным правам от 06.07.2018 по делу № СИП-152/2017 (далее – [11]).

В корреспонденции, поступившей 26.07.2021 (см. также приложение №1 к протоколу заседания коллегии от 29.07.2021), лицом, подавшим возражение, были представлены дополнения к возражению.

Суть доводов упомянутых дополнений сводится к следующему.

Поскольку в оспариваемом патенте речь идет о таблетке, то в первую очередь к ее существенным признакам относятся признаки, характеризующие качественный и количественный состав ингредиентов таблетки, а потом уже и все остальные признаки. По мнению лица, подавшего возражение, только для химических соединений с неустановленной структурой в формуле допускается приводить физико-химические и иные характеристики.

Независимый пункт 1 формулы по оспариваемому патенту составлен без указания того, является ли вилдаглиптин единственным активным ингредиентом, без указания его количественного содержания, а также не указано что еще входит в состав таблетки, помимо вилдаглиптина.

Кроме того, обращается внимание на невозможность, по мнению лица, подавшего возражение, реализации назначения изобретения в том виде, как оно сформулировано в независимом пункте 23 формулы оспариваемого патента. Так, указано, что разовая дозированная форма таблетки включает: (i) 6-60 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии ингибитора ДПП-IV и (ii) по крайней мере, одного эксципиента, выбранного из разбавителя, вещества, обеспечивающего распадаемость, и смазывающего вещества, с образованием композиции ингибитора ДПП-IV в форме таблетлирующегося порошка, пригодного для прямого прессования в таблетку.

При этом, по мнению лица, подавшего возражение, имеющаяся формулировка допускает вариант, когда в таблетке присутствует в виде альтернативы или разбавитель, или вещество, обеспечивающее распадаемость, или смазывающее вещество. Однако, данное условие выполнимо только в том случае, когда в состав эксципиентов входит разбавитель, т.к. при его отсутствии, даже при одновременном наличии максимального количества

вещества, обеспечивающее распадаемость, и смазывающего вещества, их суммарное количество не будет превышать 30 % .

В свою очередь патентообладателем на заседании коллегии, состоявшемся 29.07.2021, были представлены пояснения на дополнение к возражению (см. приложение № 2 к протоколу заседания коллегии)

По мнению патентообладателя, признак, характеризующий распределение частиц вилдаглиптина в определенном интервале размеров, влияет на достижение технического результата, т.е. является существенным и, следовательно, должен содержаться в формуле оспариваемого патента.

В отношении формулировки независимого пункта 23 формулы оспариваемого патента в пояснениях отмечено, что она не исключает смешивания на стадии (а) и иных ингредиентов, помимо указанных в подпунктах (i) и (ii).

Вместе с тем, на заседании коллегии, состоявшемся 05.08.2021, лицом, подавшим возражение, были представлены дополнения к возражению (см. приложение № 2 к протоколу заседания коллегии). В дополнениях отмечен документ [1], документ [3], а также упоминается документ WO 2003/101448 с датой публикации 11.12.2003 (обозначен в дополнениях как документ [2], однако таковым не является) (далее - [12]). Документ [12] к дополнению приложен не был, при этом его частичный перевод, представлен в тексте дополнений.

В данных дополнениях приводится критика в отношении сведений, раскрытых в примерах осуществления группы изобретений по оспариваемому патенту.

Кроме того, в дополнениях отмечено, что в оспариваемом патенте не предоставлено экспериментальных данных для сравнения таблеток, полученных прямым прессованием, с таблетками, полученными путем мокрого гранулирования в этаноле, в соответствии с примером состава, раскрытого в документе [1]. При этом, по мнению лица, подавшего возражение, общеизвестно, что прямое прессование это традиционный способ

приготовления таблеток. В соответствии с изложенным отмечено, что специалист в данной области может сделать вывод, что таблетки, получаемые обычными способами прямого прессования, подпадают под объем охраны изобретения, раскрытого в документе [1].

В дополнениях указано, что в примере 1 документа [12] также представлено конкретное описание композиции соединения 1С, вилдаглиптина, которое следует рассматривать вместе с приведенным в документе [12] описанием фармацевтической композиции.

По мнению лица, подавшего возражение, документ [12] явно раскрывает композиции таблеток для вилдаглиптина. Упомянутые таблетки были приготовлены в основном прессованием и на этом основании специалист в данной области поймет, что документ [12] раскрывает прессованные таблетки вилдаглиптина.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента не соответствует условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень» в свете сведений, раскрытых в документах [1] и [12].

Кроме того, отмечено, что изобретение по пунктам 23-24 определяет способ получения таблетки прямого прессования по любому из пунктов 1-22 и также не соответствуют условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень».

При этом отмечено, что обоснованность правовой позиции подтверждается и Постановлением Президиума Суда по интеллектуальным правам по делу №СИП- 561/2020 (далее – [13]).

На упомянутом заседании коллегии, состоявшемся 05.08.2021, патентообладателем была представлена скорректированная формула группы изобретений (см. приложение № 3 к протоколу заседания коллегии), из которой исключен независимый пункт 25, а также зависимые пункты 9-19, 24 и 26 с соответствующим изменением нумерации оставшихся пунктов формулы.

В корреспонденции, поступившей 14.09.2021 (см. также приложение №1 к протоколу заседания коллегии от 16.09.2021), патентообладателем были представлены пояснения на дополнения к возражению.

Патентообладатель настаивает на том, что существенность признака независимого пункта 1, характеризующего, по меньшей мере, 60% распределения частиц вилдаглиптина по размерам в таблетке менее чем 250 мкм, подтверждается описанием оспариваемого патента, где говорится: «согласно изобретению обнаружено, что определенные распределения частиц по размерам ингибитора ДПП-IV, предпочтительно - LAF237, особенно важны для обеспечения наилучшего уплотнения таблеток» (с.27, строки 20-22 описания). В описании оспариваемого патента также ясно говорится, что улучшение параметров прессуемости, твердости, прочности, стойкости к разламыванию и времени распада таблетки, т.е. технический результат, достигается за счет использования частиц вилдаглиптина с определенным указанным в формуле распределением по размерам (с.24, строки 16-26, с.27, строки 20-22).

При этом, по мнению патентообладателя, размер частиц может быть получен с помощью любой известной для специалиста технологии, на что прямо указано в описании оспариваемого патента (с. 27).

В отношении соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» в пояснениях отмечено следующее.

В документе [1] не упоминается о распределении частиц вилдаглиптина по каким-либо размерам.

Фармацевтические композиции на основе вилдаглиптина, в документе [12] раскрыты «для энтерального или парентерального, а также для глазного введения», которые «представлены, например, в виде стандартных доз, таких как таблетки с покрытием, таблетки, капсулы или суппозитории, а также ампулы». Таким образом, в документе [12], по мнению патентообладателя, не

раскрываются спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования вилдаглиптина.

На заседании коллегии, состоявшемся 16.09.2021, лицом, подавшим возражение, было представлено мотивированное мнение в отношении уточненной патентообладателем формулы группы изобретений по оспариваемому патенту.

Лицо, подавшее возражение, отмечает, что при внесении изменений в формулу изобретения, коллегия обязана провести экспертизу заявки как на соответствие требованиям формальной экспертизы, так и на соответствие требованиям экспертизы по существу.

При этом отмечено, что название изобретения по независимому пункту 1 формулы не уточнено.

Пункты 3, 5, 20, 21 формулы, в которых приведены не признаки таблетки, а результат, характеризующий эксплуатационные показатели таблетки и потребительские свойства, причем даже не на момент изготовления, а получаемый через определенный промежуток времени, не исключены.

Независимые пункты 1 и 23 формулы не соответствуют требованию единства изобретения, поскольку в формуле изобретения и приведенных в описании примерах, не представлено необходимых доказательств наличия у них единого изобретательского замысла.

Также отмечено, что скорректированная формула не отвечает требованиям, предъявляемым к составлению пунктов формулы изобретения.

Вместе с тем, на заседании коллегии, состоявшемся 16.09.2021 (см. приложение №3 протоколу заседания коллегии), лицом, подавшим возражение, были представлены дополнительные пояснения на уточненную патентообладателем формулу группы изобретений по оспариваемому патенту.

В дополнительных пояснениях лицо, подавшее возражение, отмечает несоответствие пунктов формулы условию патентоспособности

«промышленная применимость» и условию патентоспособности «изобретательский уровень».

При этом представлены ответы специалиста по вопросам, имеющим значение для правильного разрешения спора, советника Суда по интеллектуальным правам Яковлева Р.Ю., приглашенного для консультации в ином деле (дело № СИП-909/2020), рассматриваемом Судом по интеллектуальным правам в отношении спора по данному патенту.

К дополнениям приложены следующие источники информации (копии):

- определение СИП от 5 ноября 2020 (далее – [14]);
- определение СИП от 26 июля 2021 (далее – [15]);
- письменные ответы специалиста Яковлева Р.Ю. по делу № СИП-909/2020, на вопросы Роспатента, КРКА и Новартиса АГ (далее – [16]);
- книга Чуешов В.И. Промышленная технология лекарств, Харьков, Изд-во НФАУ, МТК, 2002, Т.2, стр. 317, 321 (далее – [8]).

В корреспонденции, поступившей 11.10.2021 (см. также приложение №1 к протоколу заседания коллегии, состоявшегося 12.10.2021), лицом, подавшим возражение, были представлены дополнительные пояснения на уточненную патентообладателем формулу группы изобретений по оспариваемому патенту. Кроме того, в пояснениях представлены ответы упомянутого выше специалиста Яковлева Р.Ю. на уточняющие вопросы в деле № СИП-909/2020.

Кроме того, на заседании коллегии, состоявшемся 12.10.2021 (см. приложение № 2 к протоколу заседания коллегии), лицом, подавшим возражение, был представлен общий вывод по вопросам, рассматриваемым в деле № СИП-909/2020 специалистом Яковлевым Р.А.

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



С учетом даты подачи заявки (17.01.2005), по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности группы изобретений по указанному патенту включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 № 3517-1 в редакции Федерального закона «О внесении изменений и дополнений в Патентный закон Российской Федерации» № 22 – ФЗ от 07.02.2003 (далее – Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 06.06.2003 № 82, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 30.06.2003 № 4852, с изменениями от 11.12.2003 (далее - Правила).

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

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

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

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

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

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

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

В соответствии с подпунктом (1) пункта 19.5.3 Правил изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в

промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.3 Правил при установлении возможности использования изобретения в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности проверяется, указано ли назначение изобретения в описании, содержащемся в заявке на дату подачи (если на эту дату заявка содержала формулу изобретения - то в описании или формуле изобретения), а в случае испрашивания приоритета, более раннего, чем дата подачи - также в документах, послуживших основанием для испрашивания такого приоритета.

Кроме того, проверяется приведены ли в описании, содержащемся в заявке, и в указанных документах средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в каждом из пунктов формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в указанных документах допустимо, чтобы упомянутые средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения.

Кроме того, следует убедиться в том, что в случае осуществления изобретения по любому из пунктов формулы действительно возможна реализация указанного заявителем назначения.

Если о возможности осуществления изобретения и реализации им указанного назначения могут свидетельствовать лишь экспериментальные данные, проверяется наличие в описании изобретения примеров его осуществления с приведением соответствующих данных, а также устанавливается, являются ли приведенные примеры достаточными, чтобы вывод о соблюдении указанного требования распространялся на разные частные формы реализации признака, охватываемые понятием, приведенным заявителем в формуле изобретения.

В соответствии с подпунктом (3) пункта 19.5.3 Правил, если установлено, что соблюдены все указанные требования, изобретение

признается соответствующим условию промышленной применимости.

При несоблюдении хотя бы одного из указанных требований делается вывод о несоответствии изобретения условию промышленной применимости.

В соответствии с подпунктом (4) пункта 19.5.3 Правил в отношении изобретения, для которого установлено несоответствие условию промышленной применимости, проверка новизны и изобретательского уровня не проводится.

В соответствии с подпунктом (1) пункта 19.5.2 Правил изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники.

Проверка новизны изобретения проводится в отношении всей совокупности признаков, содержащихся в независимом пункте формулы изобретения.

В соответствии с подпунктом (6) пункта 19.5.2 Правил, если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, содержащей зависимые пункты, соответствует условию новизны, то анализ уровня техники в отношении зависимых пунктов не проводится.

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

Проверка изобретательского уровня включает:

- определение наиболее близкого аналога в соответствии с пунктом 3.2.4.2 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 подпунктом (7) пункта 19.5.3 Правил подтверждения известности влияния отличительных признаков на технический результат не требуется, если в отношении этих признаков такой результат не определен заявителем или в случае, когда установлено, что указанный им технический результат не достигается.

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 с подпунктом (5) пункта 19.5.3 Правил 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.

В соответствии с пунктом 2.3 Правил заявка должна относиться к одному изобретению или группе изобретений, связанных между собой настолько, что они образуют единый изобретательский замысел.

Единство изобретения признается соблюденным, если в формуле изобретения охарактеризована группа изобретений:

- одно из которых предназначено для получения (изготовления) другого (например, устройство или вещество и способ получения (изготовления) устройства или вещества в целом или их части);

- одно из которых предназначено для осуществления другого (например, способ и устройство для осуществления способа в целом или одного из его действий);

- одно из которых предназначено для использования другого (в другом) (например, способ и вещество, предназначенное для использования в способе; способ или устройство и его часть; применение устройства или вещества по определенному назначению и способ с их использованием в соответствии с

этим назначением; применение устройства или вещества по определенному назначению и устройство или композиция, в которых они используются в соответствии с этим назначением как составная часть).

В соответствии с пунктом 39 Правил ППС в рамках рассмотрения возражения лицо, подавшее возражение, вправе ходатайствовать об изменении испрашиваемого объема правовой охраны изобретения, при условии, если испрашиваемые изменения могут устранить причины, препятствующие предоставлению правовой охраны заявленному объекту, либо в случае, если без внесения соответствующих изменений в предоставлении правовой охраны должно быть отказано в полном объеме, а при их внесении – частично.

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

Анализ доводов возражения, отзыва патентообладателя и дополнительных материалов, касающихся соответствия изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость», показал следующее.

Целесообразно отметить, что большая часть доводов лица, подавшего возражение, относится к проверке формулы изобретения, при этом следует напомнить, что согласно приведённой выше правовой базе (см. подпункт (2) пункта 19.5.3 Правил) оценка соответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость» проводится путем установления возможности использования изобретения в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности. При этом проверяется указано ли назначение изобретения в описании, содержащемся в заявке, возможна ли реализация указанного назначения и проверяется, приведены ли в описании, содержащемся в заявке, средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения (могут

быть описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения).

В отношении указания назначения в описании оспариваемого патента необходимо отметить, что в описании (с.1) указано, что изобретение относится к таблеткам ингибирующим дипептидилпептилазу IV (ДПП-IV) и к способу их получения.

Согласно описанию оспариваемого патента в качестве представителя ингибитора ДПП-IV выбрано соединение (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин (LAF237) (далее – вилдаглиптин). При этом в описании оспариваемого патента указано, что вилдаглиптин известен из примера 1 документа [1] (см. с.10, последний абзац описания оспариваемого патента).

Следует отметить, что в описании оспариваемого патента представлена исчерпывающая информация об ингибиторах ДПП-IV вообще и о вилдаглиптине в частности, подробно раскрыто их биологическое действие (см. с.1-11 описания оспариваемого патента), фармацевтические композиции на их основе с подходящими носителями и эксципиентами.

Так, в описании оспариваемого патента со ссылками на известный уровень техники указано, что ингибиторы ДПП-IV применимы для лечения патологических состояний, опосредуемых ингибированием ДПП-IV, в частности, для лечения патологических состояний, таких как инсулиннезависимый сахарный диабет, артрит, ожирение, трансплантация аллотрансплантата и связанный с кальцитонином остеопороз и др. (с.11 описания оспариваемого патента).

При этом указано, что ингибирующие ДПП-IV соединения, например, соединения формулы (I), в частности, вилдаглиптин, и соответствующие им фармацевтически приемлемые молекулярные соли с кислотами можно комбинировать с одним или большим количеством фармацевтически приемлемых носителей и, необязательно, с одним или большим количеством других обычных фармацевтических вспомогательных веществ и вводить

энтерально, например, перорально, в форме таблеток, капсул, таблеток в форме капсул и т.п. или парентерально, например, внутривенно в форме стерильных растворов или суспензий для инъекций (с.11 второй абзац описания оспариваемого патента).

Здесь необходимо отметить, что оспариваемая группа изобретений в большей степени направлена на преодоление недостатков способа прямого прессования, заключающихся в том, что он может использоваться для ограниченного количества лекарственных средств, поскольку большинство из них не обладает хорошими свойствами сыпучести и прессуемости, низкой адгезионной способностью к пресс-инструменту таблеточной машины, обеспечивающими непосредственное их прессование, а также необходимостью использования частиц определенной формы и размера 500-1000 мкм (см. документ [8] с.336-337).

При этом можно согласиться, с мнением патентообладателя, что в описании к оспариваемому патенту приведено достаточно сведений о средствах и методах осуществления специалистом в данной области техники группы изобретений по оспариваемому патенту.

Так, в качестве активного ингредиента ингибитора ДПП-IV, как отмечено выше, указан вилдаглиптин (с.32, строки 44-46 описания), в качестве вспомогательных инертных веществ - наполнитель, связующее, смазывающее вещество и вещество, придающее скользкость (с.12, строка 39 - с.13, строка 30 описания). На с.12-15 описания патента изложены основные методы, известные специалисту в данной области, для получения спрессованных таблеток, в том числе таблеток, полученных прямым прессованием.

При этом целесообразно отметить, что оба указанных альтернативных понятия (спрессованная таблетка и таблетка прямого прессования) направлены на получение одного и того же технического результата, а именно, улучшение параметров прессуемости, твердости, прочности, стойкости к разламыванию и времени распада таблетки.

В примерах 1 и 2 (с.33-34 описания оспариваемого патента) продемонстрировано получение смесей, подходящих для получения таблеток, далее раскрыто, что из приготовленных смесей получают спрессованные таблетки известными специалисту методами. При этом в примере 6 (с.36, последний абзац оспариваемого патента) показано получение вилдаглиптина с распределением частиц в необходимом диапазоне. В примерах 3 и 5 приведены методики исследования таблеток и гранул. В примере 4 показано, что композиции и выбранные диапазоны являются особенно подходящими для обеспечения необходимой прессуемости.

Что касается других спрессованных таблеток, в частности, таблеток, которые получены прессованием с предварительными стадиями сухого или влажного гранулирования (см. с.13-15 описания оспариваемого патента), то необходимо отметить следующее.

В описании к оспариваемому патенту посредством ссылки на патентный документ [1] (с.10 последний абзац) указано на то, что известна технология получения спрессованных таблеток вилдаглиптина с предварительной стадией гранулирования. Таким образом, в описании представлено достаточно информации для специалиста в данной области техники о том, как конкретно для вилдаглиптина провести влажную грануляцию.

Что касается оценки распределения частиц по размерам, то в описании указано, что данную процедуру можно провести с помощью ситового анализа, фотонной корреляционной спектроскопии или лазерной дифракции, электронной сенсорной зоны, поглощения света, седиментации или микроскопии, т.е. с помощью любой из указанных известных методик, средствами для осуществления которой располагает специалист (см. с. 27-29 описания оспариваемого патента).

Кроме того, в описании оспариваемого патента раскрыто, что размер частиц лекарственного средства, в частности, размер частиц LAF237 (вилдаглиптина) регулируется путем кристаллизации, сушки и/или



размола/просеивания. Отмечено, что размер частиц также можно уменьшить с помощью вальцового уплотнения и размола/просеивания. Ссылки на указанные методики в описании к оспариваемому патенту приведены (с.25). Содержание воды в таблетке также можно определить по методике потерь при сушке (например, с помощью термогравиметрии) или по методике Карла Фишера. Ссылки на упомянутые методы также даны в описании к оспариваемому патенту.

При этом в описании отмечено, что за счет использования указанного в формуле распределения частиц в определенном интервале размеров удалось достичь еще меньшего времени растворения таблеток при пероральном применении в качестве ингибитора ДПП-IV.

В отношении довода возражения об отсутствии в формуле изобретения указания на конкретные наполнители и эксципиенты, необходимо отметить, что предпочтительные разбавители и наполнители подробно раскрыты в описании к оспариваемому патенту (с.30-32). Здесь необходимо напомнить, что цель изобретения заключается не в предоставлении нового состава композиции, содержащей вилдаглиптин, а в создании таблетки, обладающей упомянутыми выше физико-химическими свойствами. При этом в независимом пункте 1 формулы присутствие ингредиентов в таблетке определено понятным для специалиста термином дисперсия («дисперсия включает частицы, содержащие ингибиторы ДПП-IV»). Общеизвестно, что дисперсия это физико-химическая система, в которой вещество распределено в однородной фазе другого состава или агрегатного состояния.

Таким образом, с учетом описания оспариваемого патента и общих знаний в данной области техники, для специалиста очевидно, что вилдаглиптин не является единственным ингредиентом таблетки по оспариваемому патенту.

Что касается количества активного ингредиента, то оно должно быть эффективным для лечения патологических состояний, опосредуемых ингибированием ДПП-IV (с. 11, абзац 4 описания оспариваемого патента) и

легко может быть подобрано специалистом, например, в зависимости от предназначения таблетки для лечения какого-либо из указанных в описании заболеваний.

В соответствии с изложенным можно констатировать, что в описании к оспариваемому патенту указано назначение изобретения по независимому пункту 1 формулы, раскрыты средства и методы для получения спрессованных таблеток, в том числе с предварительной стадией гранулирования, содержащих в качестве активного ингредиента вилдаглиптин, а также показана реализация назначения группы изобретений.

Таким образом, можно сделать вывод о том, что спрессованная таблетка по независимому пункту 1 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (пункт 19.5.1 Правил).

В отношении признаков, охарактеризованных в зависимых пунктах 9-10 формулы оспариваемого патента, необходимо отметить, что в них приведен нереальный состав ингредиентов, а именно, при их комбинации состав может превысить 100 мас.% ингредиентов (см. количественные характеристики, раскрытые в пунктах 9-10 формулы (приведены в диапазоне)), подвергающихся смешиванию в пересчете на массу в сухом состоянии. При этом состав, раскрытый в зависимых пунктах 11-19 формулы, находится в прямой зависимости от состава, раскрытого пунктах 9-10 формулы.

Необходимо констатировать, что зависимые пункты 9-19, в редакции как они изложены в формуле группы изобретений по оспариваемому патенту, содержит, в том числе состав, который не приводит к получению таблетки, т.е. назначение не реализуется.

Таким образом, можно сделать вывод о том, что спрессованная таблетка по зависимым пунктам 9-19 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (пункт 19.5.1 Правил).

Анализ доводов возражения, отзыва патентообладателя и дополнительных материалов, касающихся соответствия изобретения по независимому пункту 23 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость», показал следующее.

Довод возражения о несоответствии независимого пункта 23 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость» основан на том, что реализация назначения способа невозможна в случае отсутствия разбавителя, т.к. даже при одновременном наличии максимального количества вещества, обеспечивающего распадаемость, и смазывающего вещества их суммарное количество не будет превышать 30 % при содержании ингибитора ДПП-IV до 60 мас.% .

Здесь следует отметить, что при характеристике эксципиентов в подпункте (ii) независимого пункта 23 формулы действительно указано, что при смешивании ингредиентов используется «по крайней мере» один эксципиент, выбранный из разбавителя, вещества, обеспечивающего распадаемость, и смазывающего вещества».

Однако специалист в данной области техники из формулировки пункта 23 формулы однозначно понимает, что при содержании в таблетке активного ингредиента в количестве 6-60 мас.% эксципиенты должны быть подобраны таким образом, чтобы состав композиции был 100%.

Таким образом, можно сделать вывод о том, что способ получения таблетки по независимому пункту 23 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (пункт 19.5.1 Правил).

В отношении зависимого пункта 24 формулы группы изобретений по оспариваемому пункту необходимо отметить, что он, в виде ссылки включает признаки проанализированных выше пунктов 9-19 формулы, т.е. содержат признаки, которые не позволяют осуществить реализацию назначения. В связи с чем, можно сделать вывод о том, что спрессованная таблетка по зависимому пункту 24 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту не

соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (пункт 19.5.1 Правил).

Анализ доводов возражения, отзыва патентообладателя и дополнительных материалов, касающихся соответствия изобретения по независимому пункту 25 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость», показал следующее.

В способе получения таблетки прямого прессования также приведен нереальный состав ингредиентов, а именно, при их комбинации состав превышает 100 мас.% ингредиентов (см. количественные характеристики, раскрытые в пункте 25 формулы (приведены в диапазоне)), подвергающихся смешиванию в пересчете на массу в сухом состоянии.

Таким образом, следует согласиться с доводом возражения о том, что реализация назначения способа по независимому пункту 25 формулы оспариваемого патента не может быть осуществлена.

Следует констатировать, что способ получения таблетки по независимому пункту 25 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (подпункт (3) пункта 19.5.3 Правил).

Анализ доводов возражения, отзыва патентообладателя и дополнительных материалов, касающихся соответствия изобретения по независимым пунктам 1 и 23 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Можно согласиться с мнением лица, подавшего возражение, что наиболее близким аналогом группы изобретений по оспариваемому патенту является техническое решение, раскрытое в патентном документе [1].

В документе [1] (с.1, строки 1-2, 12, пример 1, пункт 4 формулы) описываются ингибиторы дипептидилпептидазы-IV (ДПП-IV), в частности, (S) 1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин (вилдаглиптин), который может находиться в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения (фармацевтически приемлемая соль). При этом

вилдаглиптин может находиться в форме спрессованной таблетки, полученной методом влажного гранулирования (пример состава, с.17-18).

Признаками, отличающими изобретение по независимому пункту 1 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту от технического решения, известного из патентного документа [1], являются признаки характеризующие, что «по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм», и признаки, характеризующие использование прямого прессования для получения таблетки.

В отношении сведений, содержащихся в документе [2], необходимо отметить, что они раскрывают оценку влияния различных технологических переменных при гранулировании в жидком слое на физико-химические свойства гранул и соответствующих таблеток, содержащих высокую дозу, плохо растворимого в воде, низкой плотности и микронизированного лекарственного средства. В частности, исследованию подвергались таблетки с идентичным составом, массой, размером и твердостью, которые изготавливали в грануляторе с высоким сдвигом, и таблетки, которые были получены методом гранулирования в псевдооживленном слое.

При этом сделан вывод о том, что за исключением распределения гранул по размерам, другие физические свойства грануляций и таблеток, полученных в грануляторе с псевдооживленным слоем, не зависят от выбранных технологических переменных в исследуемом диапазоне.

В отношении довода возражения о том, что из документа [2] известно, что 80% частиц активного вещества, подвергаемых грануляции, имели размеры от 37 до 297 мкм, следует отметить, что данные сведения (таблица 3) относятся к размеру частиц пребленда (см., в том числе, название таблицы), т.е. смеси лекарственного вещества со вспомогательными веществами, которая затем будет подвергаться гранулированию, что однозначно раскрыто в данном документе (с.10, левая колонка, последний абзац перевода), а не к распределению частиц по размерам какого-либо активного ингредиента в

таблетке. Причем в отношении данного пребленда, в статье также отмечено (с.10, правая колонка, первый абзац перевода), что более быстрая скорость растворения пребленда по сравнению с активным веществом обусловлена присутствием поверхностно-активного вещества и супердисинтегранта в пребленде.

Между тем, следует отметить, что вилдаглиптин растворим в воде и для повышения его растворимости эксципиенты специально подбирать не требуется.

Документ [2] не содержит информации о вилдаглиптине, и, соответственно, о каком-либо виде его гранулирования для получения таблетки и не мотивирует специалиста к изучению распределения частиц вилдаглиптина в таблетке с целью улучшения ее физико-химических характеристик.

Патентный документ [3] содержит сведения о комбинации лекарственных средств, которая включает ингибитор ДПП-IV, в частности, вилдаглиптин и дополнительный партнер. Фармацевтический препарат (таблетки, капсулы, суппозитории), известный из патентного документа [3], может содержать от 10 до 100% активного ингредиента. При этом препараты для перорального применения получают путем объединения активного ингредиента с твердыми носителями, при желании гранулирования полученной смеси и обработки смеси или гранул, если это желательно или необходимо, после добавления подходящих наполнителей для таблеток или покрытых сахаром ядра планшета. Между тем в патентном документе [3] не содержится сведений о признаке «по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм».

Документ [4] раскрывает общие сведения о процессе влажной грануляции, в частности, описывает использование в качестве инертных вспомогательных веществ лактозы и микрокристаллической целлюлозы.

В документе [4] не содержится сведений о техническом решении, характеризующимся каким-либо распределением частиц активного вещества по размерам в таблетке.

Документ [5] раскрывает информацию, касающуюся того, что размер материала играет роль для однородности конечной таблетки, при этом отмечено, что мелкозернистые материалы распределяются более равномерно, однако мелкозернистость также является фактором, влияющим на стабильность. В частности, в документе [5] отмечено, что мелкозернистые материалы более легко подвергаются воздействию атмосферного кислорода, влажности и взаимодействующих эксципиентов по сравнению с крупнозернистыми материалами. Поэтому важным является правильный выбор желательного диапазона размеров, поддержание размеров и их контроль. При этом в документе [5] раскрыто, что если первоначальный размер частиц 30 мкм или менее в диаметре, то размалывание является излишним (за исключением материалов иглообразной формы). Размалыванию подвергают большинство лекарственных средств в случае, если их частицы имеют размер «более примерно 100 мкм в диаметре». Размалыванием уменьшают крупнозернистые материалы, «предпочтительно, до диапазона 10-40 мкм».

В соответствии с изложенным в документе [5] можно констатировать, что он содержит сведения, раскрывающие желательный диапазон частиц лекарственных средств, составляющий 10-40 мкм.

При этом, исходя из сведений в документе [5], нет оснований предполагать, что данный диапазон (10-40 мкм) размеров частиц является желательным для вилдаглиптина или иных лекарственных препаратов, близкой к вилдаглиптину химической природы и строения.

Что касается использования для получения таблеток материалов с размером частиц в диапазоне более примерно 100 мкм, в частности, от 250 до 100 мкм, то оно не только не раскрыто в документе [5], а напротив, дается указание к размалыванию частиц таких размеров.

Кроме того, документ [5] не содержит сведения о необходимости, по меньшей мере, 60% распределения частиц в таблетке по каким-либо размерам.

Также документ [5], что важно, не раскрывает сведения о том, что размолотые до 10-40 мкм частицы лекарственных препаратов могут быть использованы для получения таблеток методом прямого прессования или методом гранулирования, как единственные представители активного вещества.

Документ [6] информирует о том, что эффективная доза большинства лекарств настолько мала, что прямое прессование непрактично для этого большинства лекарственных веществ. Кроме того, раскрыто, что немногие химические вещества обладают сыпучестью, когезией и смазывающими свойствами под давлением, позволяющими получать такие компактные изделия, как таблетки прямого прессования. Документ [6] содержит сведения о том, что прямое прессование стало возможным с появлением на рынке носителей прямого прессования, которые обладают как сыпучестью, так и прессуемостью. Таким носителем является, в частности, Avicel (микрористаллическая целлюлоза). При этом документ [6] не относится к вилдаглиптину, лекарствам схожей химической природы, характеризующимся тем, что «по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм».

Руководство [7] относится к микрористаллической целлюлозе, в частности, к Avicel (номинальному размеру ее частиц коммерчески доступных классов) и другим наполнителям.

Суммируя вышеизложенное, следует обратить внимание на сведения, раскрытые в документе [8] (с.321, абзацы 2-4), в котором однозначно указано на то, что мелкая фракция частиц (менее 0,2 мм, т.е. менее 200 мкм) порошков, подвергаемых таблетированию, обладает плохой сыпучестью, вследствие чего плохо дозируется по объёму в таблеточных машинах, а таблетки получаются неодинаковыми по массе и прочности. При этом в документе [8] сделан вывод о том, что направленное гранулирование позволяет использовать



определенное количество крупных фракций (т.е. более 0,2 мм) и распределение частиц порошка по крупности оказывает влияние на сыпучесть, стабильность массы получаемых таблеток, точность дозировки лекарственного вещества и на такие качественные характеристики таблеток, как распадаемость и прочность.

При этом в документе [8] отмечено, что наилучшим образом поддаются прессованию лекарственные порошки с размером частиц 0,5-1,0 мм (500-1000 мкм) (с.337).

Можно констатировать, что сведения, раскрытые в документе [8] мотивируют специалиста не ограничиваться мелкими фракциями частиц активного вещества в таблетке для достижения наилучших характеристик конечного продукта.

Таким образом, в возражении не представлены источники информации из которых известны вышеупомянутые отличительные признаки.

В соответствии с изложенным, следует сделать вывод о том, что спрессованная таблетка по независимому пункту 1 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 19.5.3 Правил).

Руководствуясь подпунктом (1) пункта 19.5.3 Правил, в связи с тем, что в возражении не представлены источники информации, из которых известны упомянутые выше отличительные признаки, анализ доводов возражения, касающийся достижения технического результата не проводился.

В связи со сделанным выше выводом, признаки зависимых пунктов 2-22, в соответствии с подпунктом (8) пункта 19.5.3 Правил не анализировались.

В отношении соответствия условию патентоспособности «изобретательский уровень» технического решения по независимому пункту 23 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту необходимо отметить следующее.

Независимый пункт 23 формулы описывает способ получения таблеток, содержащих вилдаглиптин, методом прямого прессования, характеризующихся тем, что «по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм». Лицом, подавшим возражение, в уровне техники не выявлены источники информации, из которых известны таблетки, характеризующиеся упомянутыми выше признаками.

В этой связи, с учетом вышеприведенного анализа источников информации [1]-[8], может быть сделан вывод о том, что независимый пункт 23 формулы группы изобретений соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 19.5.3 Правил).

В соответствии с подпунктом (4) пункта 19.5.3 Правил, в виду того, что способ получения спрессованной таблетки по независимому пункту 25 формулы группы изобретений признан несоответствующим условию патентоспособности «промышленная применимость», на данном этапе рассмотрения возражения анализ пункта 25 формулы на соответствие его условию патентоспособности «изобретательский уровень» не проводился.

Данные обстоятельства были доведены до сведения патентообладателя, от которого на заседании коллегии, состоявшемся 05.08.2021, была представлена уточненная формула группы изобретений, из которой исключен независимый пункт 25 и зависимые пункты 9-19, 24 и 26 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту.

Таким образом, уточненная формула содержит два независимых пункта формулы, а именно пункты, характеризующие спрессованную фармацевтическую таблетку или таблетку прямого прессования (независимый пункт 1 и зависимые от него пункты 2-11) и способ получения таблетки прямого прессования по пунктам 1-11 (независимый пункт 12).

В результате анализа уточненной патентообладателем формулы группы изобретений установлено, что независимые пункты 1 и 12 соответствуют требованию единства изобретения, поскольку одно изобретение (способ),

предназначено для осуществления части другого (таблетка прямого прессования) (см. пункт 2.3. Правил).

В соответствии с действующими нормативными актами уточненная формула была принята к рассмотрению.

Поскольку формула уточнена путем исключения из нее упомянутых выше пунктов полностью, а в оставшиеся пункты формулы каких-либо изменений внесено не было, коллегия сочла направление уточненной патентообладателем формулы группы изобретений на проведение дополнительной экспертизы нецелесообразным.

Т.к. спрессованная фармацевтическая таблетка или таблетка прямого прессования по независимому пункту 1 и способ получения таблетки прямого прессования по независимому пункту 12 (пункт 23 в первоначальной редакции) не претерпели изменений, были проанализированы выше, то вывод об их соответствии условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «изобретательский уровень» остался в силе.

В отношении довода, изложенного в дополнении к возражению от 05.08.2021, о несоответствии таблетки по независимому пункту 1 и способа по независимому пункту 12 формулы (пункт 23 первоначальной формулы) условию патентоспособности «новизна» ввиду их известности из документов [1] или [12] необходимо отметить следующее.

Как отмечено выше в настоящем заключении, в документе [1] (с.1, строки 1-2, 12, пример 1, пункт 4 формулы) описываются ингибиторы дипептидилпептидазы-IV (ДПП-IV), в частности, (S) 1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин (вилдаглиптин), который может находиться в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения (фармацевтически приемлемая соль).

При этом в техническом решении по патентному документу [1] (пример состава, с.17-18) также раскрыто, что вилдаглиптин может находиться в форме спрессованной таблетки, полученной методом влажного гранулирования.

Признаки, характеризующие изобретение по независимому пункту 1 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту, а именно, «по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм», а также признаки, характеризующие способ прямого прессования вилдаглипина, в документе [1] не раскрыты.

Сведения, раскрытые в документе [12], направлены на исследование замещенных цианопиридинов и содержащих их комбинированных препаратов для лечения гиперлипидемии и совместных заболеваний.

Так, в документе [12] раскрыт, в том числе, (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин (вилдаглиптин) (с.4 описания) или его фармацевтически приемлемая соль, а также в общем виде фармацевтические композиции на его основе для энтерального или парентерального, а также для глазного введения, которые представлены, например, в виде стандартных доз, таких как таблетки с покрытием, таблетки, капсулы или суппозитории, а также ампулы. Их получают известным способом, например, с использованием обычных процессов смешивания, грануляции, нанесения покрытия, солубилизации или лиофилизации. Таким образом, известные фармацевтические препараты для перорального применения могут быть получены путем объединения активного соединения с твердыми эксципиентами, при желании гранулирования полученной смеси и, если требуется или необходимо, переработки смеси или гранулята в таблетки или ядра таблеток с покрытием после добавления подходящих вспомогательных веществ. При этом в документе [12] не упоминается о распределении частиц вилдаглиптина по размерам, в частности, что, по меньшей мере, 60% распределения частиц вилдаглиптина по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм.

Таким образом, необходимо констатировать, что таблетки по независимому пункту 1 формулы и способ прямого прессования по независимому пункту 12 (ранее пункт 23) уточненной формулы

оспариваемого патента соответствуют условию патентоспособности «новизна» (подпункт (1) пункта 19.5.2 Правил).

В соответствии с положениями подпункта (6) пункта 19.5.2 Правил, оценка соответствия условию патентоспособности «новизна» в отношении зависимых пунктов не проводится.

В отношении документов [9]-[11], [13]-[16] представленных сторонами спора необходимо отметить следующее.

Документы [9]-[11], [13]-[15] не являются релевантным уровнем техники, т.к. представляют собой решения Роспатента, а также решения и постановления Суда по интеллектуальным правам по иным делам, не связанным с настоящим спором сторон, поэтому не могут быть привлечены для оценки соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту, условиям патентоспособности.

В отношении материалов, представленных сторонами спора (см., в том числе, дополнения [16]), касающихся ответов специалиста по вопросам, имеющим значение для правильного разрешения спора, а именно советника Суда по интеллектуальным правам Яковлева Р.Ю., приглашенного для консультации в ином деле (дело № СИП-909/2020), рассматриваемом Судом по интеллектуальным правам в отношении иного спора по данному патенту необходимо отметить следующее.

Согласно определению Суда по интеллектуальным правам об удовлетворении заявления об отводе специалиста и об отложении судебного заседания по делу № СИП-909/2020 (см. Картотека арбитражных дел на открытом ресурсе <https://kad.arbitr.ru>) специалист Яковлев Р.Ю. не может участвовать в рассмотрении упомянутого дела и подлежит отводу, поскольку делал публичные заявления и давал оценку по существу рассматриваемого дела.

Отвод специалиста Яковлева Р. Ю. от рассмотрения иного дела по данному патенту РФ в Суде по интеллектуальным правам не позволяет

коллегии в настоящем споре принять к рассмотрению ответы специалиста как независимого эксперта.

Таким образом, следует констатировать, что в возражении не содержатся доводы, позволяющие сделать вывод о несоответствии группы изобретений по уточненной формуле оспариваемого патента, представленной 05.08.2021 условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень» (пункт 1 статьи 4 Закона).

От лица, подавшего возражение, в корреспонденции от 08.11.2021 поступило обращение (жалоба), в которой содержатся доводы технического характера в отношении несоответствия группы изобретений, охарактеризованной в формуле, уточнённой патентообладателем 05.08.2021, условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «изобретательский уровень». Упомянутые доводы повторяют доводы, которые были представлены лицом, подавшим возражение, в ходе рассмотрения возражения, учтены и проанализированы выше в настоящем заключении.

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

**удовлетворить возражение, поступившее 21.04.2021, патент Российской Федерации на изобретение № 2391097 признать недействительным частично и выдать новый патент, с уточненной формулой, представленной 05.08.2021.**

(21) 2006130009

(51) МПК

**A61K 31/40** (2006.01)

**A61K 47/38** (2006.01)

**A61K 9/20** (2006.01)

**A61J 3/10** (2006.01)

(57)

1. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования, в которой дисперсия включает частицы, содержащие ингибитор ДПП-IV, представляющий собой (S)-1 -[(3-гидрокси-1 -адамантил)амино]ацетил-2- цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения, причем по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм.

2. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой дисперсия включает частицы, содержащие ингибитор ДПП-IV, представляющий собой (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения, и при этом

(a) по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм, предпочтительно от 10 до 250 мкм;

(b) отношение толщины к массе таблетки составляет от 0,002 до 0,06 мм/мг или от 0,01 до 0,03 мм/мг.

3. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1 или 2, в которой дисперсия включает частицы, содержащие ингибитор ДПП-IV, представляющий собой (8)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения, и при этом

(а) по меньшей мере 60% распределения частиц по размерам в таблетке составляет менее чем 250 мкм, предпочтительно от 10 до 250 мкм;

(b) содержание воды в таблетке составляет менее 10% через 1 неделю при 25°C и 60% относительной влажности в помещении, и

(с) отношение толщины к массе таблетки составляет от 0,002 до 0,06 мм/мг.

4. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой распределение частиц по размерам в таблетке составляет от 50 до 150 мкм.

5. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой содержание воды в таблетке составляет менее 5% через 1 неделю при 25°C и 60% относительной влажности в помещении.

7. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой отношение толщины к массе таблетки составляет от 0,01 до 0,03 мм/мг.

8. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой по меньшей мере 60% или по меньшей мере 80% распределения частиц по размерам в таблетке составляет от 10 до 250 мкм.



9. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по п.1, в которой по меньшей мере 25% или по меньшей мере 35% распределения частиц по размерам в таблетке составляет от 50 до 150 мкм.

10. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по любому из пп.1, 2, 4-8, из которой

(а) между 0 и 10 мин высвобождается 85-99,5% активного компонента  
и

(б) между 10 и 15 мин высвобождается 90-99,5% активного компонента.

10. Спрессованная фармацевтическая таблетка или фармацевтическая таблетка прямого прессования по любому из пп.1, 2, 4-8, в которой распределение частиц по размерам фармацевтически приемлемых эксципиентов в таблетке составляет от 5 до 400 мкм.

11. Спрессованная фармацевтическая таблетка по любому из пп.1, 2, 4-8, которая представляет собой фармацевтическую таблетку, полученную прямым прессованием.

12. Способ получения таблетки прямого прессования по любому из пп.1-11, в виде разовой дозированной формы, который включает:

(а) смешивание в количествах, выраженных в мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии:

(i) 6-60 мас.% в пересчете на массу в сухом состоянии ингибитора ДПП-IV и

(ii) по крайней мере одного эксципиента, выбранного из разбавителя, вещества, обеспечивающего распадаемость, и смазывающего вещества,

с образованием композиции ингибитора ДПП-IV в форме таблетлирующегося порошка, пригодного для прямого прессования в таблетку; и

(b) прессование композиции, полученной на стадии (a), с получением спрессованной таблетки ингибитора ДПП-IV в виде разовой дозированной формы,

причем упомянутый ингибитор ДПП-IV представляет собой (S)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин в свободной форме или в форме кислотной соли присоединения.

(56) US 6548481, 15.04.2003

US 2003/078247, 24.04.2003

US 2003/087950, 08.05.2003

JP 2003327532, 19.11.2003

EP 1537880, 08.06.2005

WO 03/057195, 17.07.2003

US 4452579, 05.06.1984

WO 00/34241, 15.06.2000

Julia Z. H. Gao et al, «Fluid bed granulation of a poorly water soluble, low density, micronized drug: comparison with high shear granulation», International Journal of Pharmaceutics, 237, 2002, 1-14

WO 01/52825, 26.07.2001

L. Lachman And H. A. Lieberman «The Theory And Practice Of Industrial Pharmacy», (3rd Edition, Indian Edition), VARGHESE PUBLISHING HOUSE, 1987, pp. 313-328

Handbook of Pharmaceutical Granulation Technology, ed.: D.M. Parikh, 1997, p. 102

Pharmaceutical Dosage Forms, Tablets, ed.: H.A. Liebermann, L.  
Lachman, vol. 1, 1980, pp. 3-4

Pharmaceutical Dosage Forms, Tablets, ed.: H.A. Liebermann et al.,  
vol. 1, 1989, pp. 195-220

Handbook of Pharmaceutical Excipients, ed.: A.H. Kibbe, 2000, pp.  
102-106, 276-285, 305-308, 501-504