

ЗАКЛЮЧЕНИЕ

коллегии палаты по патентным спорам по результатам рассмотрения возражения заявления

Коллегия палаты по патентным спорам в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 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, зарегистрированными в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение фирмы РЕСВЕНЬТАРШАШАГ, Венгрия (далее – лицо, подавшее возражение) против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2259366, поступившее 19.08.2011, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2259366 на группу изобретений «Арипипразоловое лекарственное средство с низкой гигроскопичностью и способы его получения» выдан по заявке №2003101334/15 с приоритетом от 25.09.2002 на имя компании ОЦУКА ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД, Япония (далее – патентообладатель) и действует со следующей формулой:

«1. Гидрат А арипипразола, где указанный гидрат имеет спектр порошковой дифракции рентгеновских лучей, имеющий характеристические пики порошковой дифракции рентгеновских лучей при $2\theta=12,6^\circ, 15,4^\circ, 17,3^\circ, 18,0^\circ, 18,6^\circ, 22,5^\circ$ и $24,8^\circ$; характерные инфракрасные полосы поглощения при 2951, 2822, 1692, 1577, 1447, 1378, 1187, 963 и 784 см^{-1} на ИК-спектре (КВг); слабый эндотермический пик при 71°C и не резкий эндотермический пик в интервале $60-120^\circ\text{C}$ при термогравиметрическом/дифференциальном термическом анализе (скорость нагрева $5^\circ\text{C}/\text{мин}$), и

средний размер частиц 50 мкм или меньше.

2. Гидрат А арипипразола по п.1, где указанный гидрат имеет диапазон средних размеров частиц от 36 до 14 мкм.

3. Способ получения гидрата А арипипразола, где указанный способ включает размалывание обычного гидрата арипипразола до среднего размера частиц 50 мкм или меньше.

4. Способ по п.3, где указанное размалывание проводят в установке для тончайшего измельчения с использованием скорости вращения основной оси 5000-15000 об/мин, скорости вращения сырья 10-30 об/мин и размера отверстий сита 1-5 мм.

5. Гидрат А арипипразола, полученный способом по п.3, включающим размалывание обычного гидрата арипипразола до среднего размера частиц 50 мкм или меньше.

6. Гидрат А по п.5, где указанное размалывание проводят в установке для тончайшего измельчения с использованием скорости вращения основной оси 5000-15000 об/мин, скорости вращения сырья 10-30 об/мин и размера отверстий сита 1-5 мм.

7. Кристаллы В безводного арипипразола, которые имеют спектр порошковой дифракции рентгеновских лучей, имеющий характеристические пики порошковой дифракции рентгеновских лучей при $2\theta=11,0^\circ$, $16,6^\circ$, $19,3^\circ$, $20,3^\circ$ и $22,1^\circ$;

характерные инфракрасные полосы поглощения при 2945, 2812, 1678, 1627, 1448, 1377, 1173, 960 и 779 см^{-1} на ИК-спектре (KBr) ;

эндотермический пик при $141,5^\circ\text{C}$ в термогравиметрическом/дифференциальном термическом анализе (скорость нагрева: $5^\circ\text{C}/\text{мин}$) ;

эндотермический пик при $140,7^\circ$ в дифференциальной сканирующей калориметрии (скорость нагрева $5^\circ\text{C}/\text{мин}$).

8. Кристаллы В безводного арипипразола по п.7, имеющие низкую гигроскопичность, характеризующуюся содержанием влаги 0,40% или меньше после помещения лекарственного средства кристаллов В на 24 ч в

эксикатор, в котором поддерживают температуру 60°C и уровень влажности 100%.

9. Кристаллы В безводного арипипразола по п.8, имеющие низкую гигроскопичность, характеризующуюся содержанием влаги 0,10% или меньше после помещения лекарственного средства кристаллов В на 24 ч в эксикатор, в котором поддерживают температуру 60°C и уровень влажности 100%.

10. Кристаллы В безводного арипипразола по п.7, где указанные кристаллы имеют средний размер частиц 50 мкм или меньше.

11. Кристаллы В безводного арипипразола по п.10, где указанные кристаллы имеют средний размер частиц 30 мкм или меньше.

12. Кристаллы В безводного арипипразола по п.7 где указанные кристаллы В по существу не будут превращаться в водную форму арипипразола при сохранении должным образом при относительной влажности (RH) 60% и при температуре 25°C, даже в течение длительного периода не менее чем 4 года.

13. Способ получения кристаллов В безводного арипипразола, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола по любому из п.1 или 2.

14. Способ получения кристаллов В безводного арипипразола по п.13, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола при 90-125°C в течение 3-50 ч.

15. Способ получения кристаллов В безводного арипипразола по п.13, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола при 100°C в течение 18 ч.

16. Способ получения кристаллов В безводного арипипразола по п.13, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола при 100°C в течение 24 ч.

17. Способ получения кристаллов В безводного арипипразола по п.13, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола при

120°C в течение 3 ч.

18. Способ получения кристаллов В безводного арипипразола по п.13, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола в течение 18 ч при 100°C с последующим дополнительным нагреванием в течение 3 ч при 120°C.

19. Кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, полученные способом, включающим нагревание гидрата А арипипразола по любому из п.1 или 2 в течение 18 ч при 100°C с последующим дополнительным нагреванием в течение 3 ч при 120°C.

20. Фармацевтическая композиция, содержащая кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12 вместе с одним или несколькими фармацевтически приемлемыми носителями.

21. Фармацевтическая композиция по п.20 в форме твердой пероральной таблетки.

22. Фармацевтическая композиция по п.20 в форме пероральной быстро плавящейся таблетки.

23. Способ получения фармацевтического твердого перорального препарата, включающего кристаллы В безводного арипипразола, определенные в п.8, и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, посредством влажной грануляции смеси порошка кристаллов В безводного арипипразола и носителей, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола, определенного в п.1.

24. Способ получения фармацевтического твердого перорального препарата, включающего кристаллы В безводного арипипразола, определенные в п.8, и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, посредством влажной грануляции смеси порошка кристаллов В безводного арипипразола и носителей, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола, определенного в п.1, при 90-125°C в течение 3-50 ч.

25. Способ получения фармацевтического твердого перорального

препарата, включающего кристаллы В безводного арипипразола, определенные в п.9, и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, посредством влажной грануляции смеси порошка кристаллов В безводного арипипразола и носителей, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола, определенного в п.1.

26. Способ получения фармацевтического твердого перорального препарата, включающего кристаллы В безводного арипипразола, определенные в п.9, и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, посредством влажной грануляции смеси порошка кристаллов В безводного арипипразола и носителей, где указанный способ включает нагревание гидрата А арипипразола, определенного в п.1, при 90-125°C в течение 3-50 ч.

27. Кристаллы В безводного арипипразола по п.7, где указанные кристаллы В по существу не будут превращаться в водную форму арипипразола при хранении должным образом при относительной влажности (RH) 60% и при температуре 25°C, даже в течение длительного периода не менее чем 1 год.

28. Кристаллы В безводного арипипразола по п.7, где указанные кристаллы В по существу не будут превращаться в водную форму арипипразола при хранении должным образом при относительной влажности (RH) 75% и при температуре 40°C, даже в течение длительного периода не менее чем 0,5 года.

29. Фармацевтическая композиция, содержащая кристаллы В безводного арипипразола по п.27 или 28 вместе с одним или несколькими фармацевтически приемлемыми носителями.

30. Фармацевтическая композиция по п.29 в форме твердой пероральной таблетки.

31. Фармацевтическая композиция по п.29 в форме пероральной быстро плавящейся таблетки.

32. Способ лечения нарушения центральной нервной системы,

включающий введение кристаллов В безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28.

33. Способ лечения шизофрении, включающий введение кристаллов В безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28,

34. Способ лечения биполярного нарушения, включающий введение кристаллов В безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28.

35. Способ лечения трудноизлечимой (резистентной к лекарственным средствам, хронической) шизофрении со снижением умственной деятельности или трудноизлечимой (резистентной к лекарственным средствам, хронической) шизофрении без снижения умственной деятельности, включающий введение кристаллов В безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28.

36. Способ лечения аутизма, синдрома Дауна или нарушения типа гиперактивности с дефицитом внимания (ADHD), включающий введение кристаллов В безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28.

37. Способ лечения болезни Альцгеймера, болезни Паркинсона и других нейродегенеративных заболеваний, включающий введение кристаллов В безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28.

38. Способ лечения панического состояния, навязчивого компульсивного нарушения (OCD), нарушений сна, нарушения половой функции, алкогольной и лекарственной зависимости, рвоты, укачивания, ожирения, мигрени или снижения умственной деятельности, включающий введение кристаллов В безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28.

39. Способ лечения тревоги, депрессии или мании, включающий введение кристаллов В безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28.

40. Способ лечения или профилактики шизофрении или симптомов, связанных с шизофренией, включающий введение кристаллов В безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28.

41. Лекарственное средство для лечения шизофрении или симптомов, связанных с шизофренией, которое включает кристаллы В

безводного арипипразола по пп.7-12, 27-28 в количестве, эффективном для лечения шизофрении или ее симптомов, в смеси с фармацевтически приемлемым носителем.

42. Лекарственное средство по п.41, которое содержится в торговой упаковке, имеющей инструкции о том, что лекарственное средство можно использовать для лечения шизофрении или ее симптомов.

43. Способ получения гранул кристаллов В безводного арипипразола по п.8, отличающийся тем, что он включает влажную грануляцию кристаллов В безводного арипипразола, определенных в п.8, сушку полученных гранул при 70-100°C, сортировку их по размеру и затем снова сушку просеянных гранул при 70-100°C.

44. Способ получения гранул кристаллов В безводного арипипразола по п.9, отличающийся тем, что он включает влажную грануляцию кристаллов В безводного арипипразола, определенных в п.9, сушку полученных гранул при 70-100°C, сортировку их по размеру и затем снова сушку просеянных гранул при 70-100°C.

45. Способ получения фармацевтического твердого перорального препарата, отличающийся тем, что он включает сушку фармацевтического твердого перорального препарата, включающего кристаллы В безводного арипипразола, определенные в п.8, и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, при 70-100°C.

46. Способ получения фармацевтического твердого перорального препарата, отличающийся тем, что он включает сушку фармацевтического твердого перорального препарата, включающего кристаллы В безводного арипипразола, указанные в п.9, и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, при 70-100°C.

47. Фармацевтический твердый пероральный препарат, включающий кристаллы В безводного арипипразола, определенные в п.8, и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, где указанный фармацевтический твердый пероральный препарат имеет, по меньшей мере,

одну скорость растворения, выбранную из группы, состоящей из 60% или больше при рН 4,5 через 30 мин, 70% или больше при рН 4,5 через 60 мин и 55% или больше при рН 5,0 через 60 мин.

48. Фармацевтический твердый пероральный препарат, включающий кристаллы В безводного арипипразола, определенные в п.9, и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, где указанный фармацевтический твердый пероральный препарат имеет, по меньшей мере, одну скорость растворения, выбранную из группы, состоящей из 60% или больше при рН 4,5 через 30 мин, 70% или больше при рН 4,5 через 60 мин и 55% или больше при рН 5,0 через 60 мин.

49. Способ получения гранул, содержащих кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, 27 и 28, отличающийся тем, что включает влажную грануляцию обычных кристаллов безводного арипипразола, сушку полученных гранул при 70-100°C, сортировку их по размеру и затем снова сушку просеянных гранул при 70-100°.

50. Способ получения фармацевтического твердого перорального препарата, содержащего кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, 27 и 28, отличающийся тем, что включает сушку фармацевтического твердого перорального препарата, включающего обычные кристаллы безводного арипипразола и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, при 70-100°C.

51. Фармацевтический твердый пероральный препарат, содержащий кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, 27 и 28, отличающийся тем, что он имеет, по меньшей мере, одну скорость растворения, выбранную из группы, состоящей из 60% или больше при рН 4,5 через 30 мин, 70% или больше при рН 4,5 через 60 мин и 55% или больше при рН 5,0 через 60 мин.

52. Фармацевтический твердый пероральный препарат, содержащий кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, 27 и 28, отличающийся тем, что он получен способом по п.49, где указанный

фармацевтический твердый пероральный препарат имеет, по меньшей мере, одну скорость растворения, выбранную из группы, состоящей из 60% или больше при рН 4,5 через 30 мин, 70% или больше при рН 4,5 через 60 мин и 55% или больше при рН 5,0 через 60 мин.

53. Фармацевтический твердый пероральный препарат, содержащий кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, 27 и 28, отличающийся тем, что он получен способом по п.50, где указанный фармацевтический твердый пероральный препарат имеет, по меньшей мере, одну скорость растворения, выбранную из группы, состоящей из 60% или больше при рН 4,5 через 30 мин, 70% или больше при рН 4,5 через 60 мин и 55% или больше при рН 5,0 через 60 мин.

54. Способ получения гранул, содержащих кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, 27 и 28, отличающийся тем, что он включает влажную грануляцию обычных кристаллов гидрата арипипразола, сушку полученных гранул при 70-100°C, сортировку их по размеру и затем снова сушку просеянных гранул при 70-100°C.

55. Способ получения фармацевтического твердого перорального препарата, содержащего кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, 27 и 28, отличающийся тем, что он включает сушку фармацевтического твердого перорального препарата, включающего обычные кристаллы гидрата арипипразола и один или несколько фармацевтически приемлемых носителей, при 70-100°C.

56. Фармацевтический твердый пероральный препарат, содержащий кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, 27 и 28, отличающийся тем, что он получен способом по п.54, где указанный фармацевтический твердый пероральный препарат имеет, по меньшей мере, одну скорость растворения, выбранную из группы, состоящей из 60% или больше при рН 4,5 через 30 мин, 70% или больше при рН 4,5 через 60 мин и 55% или больше при рН 5,0 через 60 мин.

57. Фармацевтический твердый пероральный препарат, содержащий

кристаллы В безводного арипипразола по любому из пп.7-12, 27 и 28, отличающийся тем, что он получен способом по п.55, где указанный фармацевтический твердый пероральный препарат имеет, по меньшей мере, одну скорость растворения, выбранную из группы, состоящей из 60% или больше при рН 4,5 через 30 мин, 70% или больше при рН 4,5 через 60 мин и 55% или больше при рН 5,0 через 60 мин ».

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса в палату по патентным спорам поступило возражение, мотивированное несоответствием группы изобретений по пунктам 7-57 формулы оспариваемого патента условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна», «изобретательский уровень», а также наличием в формуле изобретения признаков, отсутствовавших на дату подачи заявки в формуле изобретения и в описании изобретения.

К возражению приложены следующие материалы:

- копия статьи Сатоши Аоки, Такуи Бандо и Нориуки Кобаяши, Исследование кристаллической трансформации Арипипразола, Материалы четвертого японско-корейского симпозиума по технологии разделения, октябрь 6-8, 1996 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [1]);

- патентный документ EP № 0367141, опубл. 09.05.1990 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [2]);

- Отчет о результатах исследования Арипипразола доктора Ганса – Гюнтера Штригеля, фирма Merckle/Ratiopharm от 21.12.2006 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [3]);

- Отчет о результатах исследования арипипразола профессора доктора Мартина У. Шмидта, профессора Института неорганической и аналитической химии Университета им. Иоганна Вольфганга Гете во Франкфурте на Майне от 23.12.2006 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [4]);

- Ильпо Латтинен, отчет об экспериментах на партиях арипипразола, Эспоо, Финляндия, 18 декабря 2006 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [5]);
- Арипипразол – аналитическое исследование, 19.12.2006 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [6]);
- Вели Пека Таннинен, Отчет об экспериментах с арипипразолом, Орион Корпорейшн, Орион Фарма, Эспоо, 19 декабря 2006 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [7]);
- Решение Европейского Патентного Ведомства от 07.07.2009 на 1л и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [8]);
- Моррисон Р., Бойд Р., Органическая химия, М.:, Издательство «МИР», 1974, с. (далее – [9]);
- Фармакопея США № 29, Национальный формуляр № 24, действует с 01.01.2006 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [10]);
- Сведения из Интернет <mhtml:file://X:\In-Working\IN-working\Nullification\Egis\Russia\21766> (далее – [11]);
- Гапрри Дж. Бриттен, Спектральные методы характеристики полиморфных форм и сальватов, Журнал Фармацевтических Наук, апрель 1997, т. 86, № 4 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [12]);
- патентный документ US 4734416, опубл. 29.03.1988 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [13]);
- Муравьев И.А., Технология лекарств, т.1, М.:, «Медицина», 1980 (далее – [14]);
- Курт Х. Бауер, Карл-Хайнц Фремминг, Клаус Фюрер, Фармацевтическая технология, Издательство Георг Тиме Штутгарт –Нью Йорк, 1986 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [15]);
- Мартин Дж. Перез, Отчет об экспериментах с арипипразолом, Мапримед С.А., Буэнос-Айрес, 17 ноября 2003 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [16]);

- Кузьмичев, Порошковая дифрактометрия в материаловедении, Учебное пособие, Московская государственная академия тонкой химической технологии им. М.В. Ломоносова, М., 2006 (далее – [17]);

- патентный документ US 2010/0069317, опубл. 18.03.2010 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [18]);

- Энциклопедия гигиены и безопасности труда, под ред. Джин Магер Стеллман, т. III, четвертое издание, Международная организация труда, 1998, патентный документ US 4734416, опубл. 29.03.1988 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [19]);

- Брайан С. Фернисс и др., Практический учебник органической химии Фогеля, Логмен Групп ЮК Лимитед, 1989 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [20]);

- Органика, Основной практикум по органической химии, изд. 16, Народное Предприятие Немецкое Научное Издательство, Берлин, 1986 перевод релевантных частей на русский язык (далее – [21]);

- патентный документ US 5006528, опубл. 09.04.1991 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [22]);

- заявка WO 03/026659, опубл. 03.04.2003 (далее – [23]).

Лицо, подавшее возражение, отмечает, что в возражении приведены документы [3] - [7], [16], ставшие доступными после даты приоритета оспариваемого патента, которые представляют собой отчеты об экспериментальных работах, подтверждающих, что объект, известный из статьи [1], имеет все признаки объекта по пункту 7 формулы оспариваемого патента. По мнению лица, подавшего возражение, отчеты [3] - [4] содержат подробную характеристику безводного гидрата арипипразола, известного из статьи [1], при этом способ получения указанного гидрата арипипразола воспроизведен в них с максимальной точностью, что подтверждается также точным совпадением всех упомянутых в оспариваемом патенте параметров безводного кристаллического арипипразола и промежуточного вещества – гидратированного кристаллического арипипразола – с соответствующими

параметрами веществ, полученных авторами отчетов [3] - [4]. Отчет [16] содержит описание исследований с воспроизведением примера 1 из описания к патентному документу [2]. Таким образом, лицо, подавшее возражение считает, что несмотря на то, что документы [3] - [4], [16] опубликованы после даты приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту, они содержат информацию об объектах, которые могут быть включены в уровень техники и приняты во внимание при оценке патентоспособности изобретений по оспариваемому патенту.

В возражении отмечено, что в пунктах 7-20, 23-29, 32-41 и 43-57 формулы изобретения по оспариваемому патенту присутствует признак «кристаллы В безводного арипипразола», однако в международной заявке [23], по которой был выдан оспариваемый патент, отсутствуют какие-либо упоминания кристаллов безводного арипипразола.

По мнению лица, подавшего возражение, в заявке [23] раскрыты кристаллы ангидрида арипипразола, при этом единственное упоминание термина «безводный» на с. 4 описания к оспариваемому патенту характеризует кристаллы ангидрида арипипразола, а не кристаллы арипипразола.

По мнению лица, подавшего возражение, замена совокупности признаков «кристаллы В ангидрида арипипразола» совокупностью признаков «кристаллы В безводного арипипразола» не является для специалистов очевидной и равнозначной, поскольку данные понятия имеют разное смысловое содержание. Кристаллы безводного арипипразола означают химически немодифицированный арипипразол, представленный в кристаллической форме, по существу не содержащий воды. В то же время термин «ангидрид» означает продукт химической модификации, представляющий собой конденсацию двух молекул одного и того же соединения с высвобождением одной молекулы воды.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, замена признаков «кристаллы ангидрида арипипразола» словосочетанием

«кристаллы безводного арипипразола», где признак «безводный» в применении к кристаллам арипипразола отсутствует в первоначальных материалах заявки, не является очевидной для специалистов.

На основании данных доводов в возражении сделан вывод о том, что признак «безводный», относящийся к арипипразолу по пункту 7 формулы изобретения по оспариваемому патенту, отсутствует в первоначальных материалах заявки.

В отношении несоответствия группы изобретений по пунктам 7, 12, 27, 28 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», в возражении отмечено следующее.

В пункте 7 данной формулы кристаллы безводного арипипразола охарактеризованы, в частности, признаками: «эндотермический пик при $141,5^{\circ}\text{C}$ в термогравиметрическом/дифференциальном термическом анализе (скорость нагрева: $5^{\circ}\text{C}/\text{мин}$)»; «эндотермический пик при $140,7^{\circ}$ в дифференциальной сканирующей калориметрии (скорость нагрева $5^{\circ}\text{C}/\text{мин}$)». Однако, по мнению лица, подавшего возражение, в описании и на графических материалах к оспариваемому патенту не показано получение кристаллов, имеющих эндотермический пик в термогравиметрическом/дифференциальном термическом анализе, точно при $141,5^{\circ}\text{C}$, и эндотермический пик при дифференциальной сканирующей калориметрии, точно при 140°C . В описании к оспариваемому патенту (пример 2) безводные кристаллы В арипипразола имеют в термогравиметрическом/дифференциальном термическом анализе эндотермический пик приблизительно около $141,5^{\circ}\text{C}$, а при дифференциальной сканирующей калориметрии – приблизительно около 140°C . На основании данных доводов в возражении сделан вывод о том, что в оспариваемом патенте не приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в пункте 7 формулы по оспариваемому патенту.

В отношении несоответствия изобретений по зависимым пунктам 12, 27, 28 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», в возражении отмечено следующее.

В пункте 12 формулы оспариваемого патента кристаллы В безводного арипипразола (по пункту 7 данной формулы) охарактеризованы следующим образом: «где указанные кристаллы В по существу не будут превращаться в водную форму арипипразона при сохранении должным образом при относительной влажности (RH) 60% и при температуре 25⁰ С, даже в течение длительного периода не менее чем 4 года». При этом пункт 27 формулы изобретения по оспариваемому патенту содержит ту же совокупность признаков, что и пункт 12 данной формулы, а также указание периода «не менее чем 1 год». В пункте 28 данной формулы указан период «не менее, чем 0,5 года», температура 40⁰С и относительная влажность 75%. В возражении указано, что признак: «сохранение должным образом», содержащийся в пунктах 12, 27, 28 формулы по оспариваемому патенту, является неидентифицируемым, что делает невозможным идентификацию объектов по данным пунктам формулы. Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, в описании изобретения по оспариваемому патенту отсутствуют данные о превращении кристаллов В безводного арипипразола в водную форму при хранении в течение 0,5 года или более при каких - либо условиях.

В возражении также отмечено, что пункты 8-11, 13-26, 29-57 содержат ссылки хотя бы на один из пунктов 7,12 и 27-28 формулы по оспариваемому патенту, поэтому они также не соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость».

В отношении оценки несоответствия изобретения по независимому пункту 7 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «новизна» в возражении отмечено, что изобретение по данному пункту формулы относится к веществу, известному из статьи [1], а именно, к кристаллам безводного арипипразола, при этом параметры вещества,

указанные в пункте 7 формулы оспариваемого патента, не будучи опубликованными для этого вещества ранее даты приоритета оспариваемого патента, были объективно ему присущи. По мнению лица, подавшего возражение, для отрицания новизны не требуется, чтобы из уровня техники были известны все признаки объекта, включенного в независимый пункт формулы, достаточно того, чтобы эти признаки были присущи известному объекту. В возражении указано, что независимый пункт 7 формулы оспариваемого патента относится к кристаллам В безводного арипипразола, при этом характеристики вещества по независимому пункту 7 формулы оспариваемого патента, не будучи опубликованы ранее, были объективно ему присущи.

Лицо, подавшее возражение, обращает внимание на то, что в статье [1] описано несколько кристаллических форм арипипразола, в том числе безводные кристаллы Типа 1, которые охарактеризованы температурой плавления 140°C и картиной дифракции рентгеновских лучей на порошке, приведенной на фиг. 3 (а). При этом, по мнению лица, подавшего возражение, картина распределения пиков дифракции рентгеновских лучей для порошка кристаллов Типа 1, представленной на фиг. 3(а) статьи [1], совпадает с картиной распределения пиков дифракции рентгеновских лучей на порошке, приведенной на фиг. 5 оспариваемого патента.

Лицо, подавшее возражение, обращает внимание на то, что согласно факмакопее США [10] каждая кристаллическая форма соединения имеет собственную характерную картину дифракции рентгеновских лучей, а из журнала [12] известно, что различия в картинах дифракции являются критерием распознавания разных полиморфных кристаллических форм, т.е. если картины дифракции субстанций совпадают, значит речь идет об одной и той же кристаллической форме. На основании данных доводов лицо, подавшее возражение, делает вывод о том, что безводные кристаллы Типа 1, известные из статьи [1] являются кристаллами В безводного арипипразола,

имеющими характеристики, указание в независимом пункте 7 формулы оспариваемого патента.

В возражении отмечено, что в статье [1] не раскрыты такие параметры кристаллов Типа 1, как характерные инфракрасные полосы поглощения, эндотермический пик в термогравиметрическом/ дифференциальном термическом анализе при скорости нагрева $5^{\circ}\text{C}/\text{мин}$, эндотермический пик в дифференциальной сканирующей калориметрии при скорости нагрева $5^{\circ}\text{C}/\text{мин}$. Однако, после даты приоритета оспариваемого патента были проведены исследования, которые показали, что кристаллам Типа 1, описанным в статье [1], присущи вышеперечисленные характеристики, что подтверждают отчеты [3] и [4].

В возражении подчеркнуто, что в статье [1] не раскрыт способ, которым получали исходные кристаллы арипипразола, которые использовали для дальнейших преобразований, однако, на момент опубликования статьи [1] был известен только один способ получения кристаллов арипипразола, а именно, способ, раскрытый в примере 1 описания к патентному документу [2].

Лицо, подавшее возражение, отмечает, что под обычным арипипразолом подразумевается гидрат арипипразола, который получен согласно примеру 1 по патентному документу [2]. В способе, известном из статьи [1], получают кристаллы безводного арипипразола Типа 1 путем нагревания гидрата арипипразола (кристаллы Типа 3) при температуре $70\text{--}125^{\circ}\text{C}$, в свою очередь кристаллы гидрата арипипразола Типа 3 получают по способу, известному из статьи [1], путем перекристаллизации арипипразола из смеси этанол/вода (80%/ 20%). По мнению лица, подавшего возражение, аналогичным способом получают кристаллы В безводного арипипразола, а одинаковые способы получения приводят к получению одинаковых продуктов.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, кристаллы В безводного арипипразола известны из статьи [1].

Лицо, подавшее возражение, обращает внимание на то, что в отчете [3] содержатся сведения о том, что был получен арипипразол согласно примеру 1 патентного документа [2], затем арипипразол дважды перекристаллизовали, после чего были получены кристаллы, обозначенные как «AS 18», имеющие температуру плавления $139,7^{\circ}\text{C}$, полученные безводные кристаллы нагревали при $130-140^{\circ}\text{C}$ в течение 15 часов и получили кристаллическую форму с температурой плавления 149°C , что совпадает в пределах погрешности с температурой плавления кристаллов Типа 2, известных из статьи [1] (температура плавления 150°C). Образец «AS 29» не имеет аналогов из числа заявленных в оспариваемом патенте, однако совпадение его температуры плавления с температурой плавления кристаллов Типа 2, известных из статьи [1], при идентичном способе получения из кристаллов «AS 18» и кристаллов Типа 1 подтверждает идентичность кристаллической структуры образцов «AS 18» и известных перекристаллизованных из этанола кристаллов Типа 1, что свидетельствует о точном воспроизведении в отчете [3] описанных статье стадий рекристаллизации из этанола.

Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, кристаллы В безводного арипипразола известны также из патентного документа [2].

В возражении приведен анализ на соответствие условию патентоспособности «новизна» группы изобретений по пунктам 12, 20-21, 27-30, 51 формулы оспариваемого патента и анализ соответствия условию патентоспособности «изобретательский уровень» группы изобретений по пунктам 9-11, 13-19, 22-26, 31- 50, 52-57 данной формулы.

Патентообладатель, в установленном порядке ознакомленный с материалами возражения, в отзыве, поступившем 27.01.2012, отметил, что все признаки, содержащиеся в формуле оспариваемого патента были раскрыты в первоначальных материалах заявки, а изобретения по пунктам 7-57 формулы оспариваемого патента удовлетворяют всем условиям патентоспособности.

Доводы патентообладателя, касающиеся наличия в формуле группы изобретений по оспариваемому патенту признаков, отсутствовавших в материалах заявки на дату ее подачи, сводятся к следующему:

- в процессе экспертизы в описание изобретения было внесено уточнение, заключающееся в замене терминов «кристалл В ангидрида арипипразола» и «кристаллы ангидрида арипипразола» терминами «кристалл В безводного арипипразола» и «кристаллы безводного арипипразола», при этом данное уточнение было связано с исправлением очевидной технической ошибки, допущенной при переводе материалов с японского языка на английский, а затем с английского языка на русский язык, заключающейся в том, что вместо термина «anhydrous» - «безводный», использован термин «anhydride» - «ангидрид» ;

- то, что кристаллы В арипипразола представляют собой именно безводную форму арипипразола очевидно для специалиста в данной области исходя из сведений, содержащихся на с. 10 (строки 16-21) описания к оспариваемому патенту, где подчеркивается, что кристаллы В арипипразола по существу не превращаются в «водную форму» арипипразола при сохранении должным образом в течение длительного периода;

- в таблице 1 на странице 35 описания к оспариваемому патенту представлено содержание влаги в кристаллах В арипипразола, полученных в примерах 2-10, где начальное содержание влаги в этих кристаллах составляет 0,05% или менее, что соответствует безводной форме;

- на странице 4 в английском тексте публикации заявки [23], а также и в русском переводе данной заявки, поданном в Роспатент, термин «безводный» прямо упоминается при описании кристаллического вещества В: «было также обнаружено, что эта форма арипипразола с пониженной гигроскопичностью является кристаллическим веществом, определенным здесь как ангидрид В. Был также открыт конкретный способ получения этого безводного кристаллического вещества», т.е. термин «безводный» относится

именно к полиморфной форме арипипразола, обозначенной как «ангидрид В»;

- при этом из описания заявки, по которой выдан оспариваемый патент, следует, что объектами изобретения являются различные полиморфные формы (безводная и гидратная/гидратированная формы арипипразола), а не получение его производных (ангидрида арипипразола).

Доводы патентообладателя, касающиеся оценки соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», сводятся к следующему:

- в первоначальных материалах заявки (в пункте 7 формулы), по которой был выдан оспариваемый патент, величины эндотермических пиков в термгравиметрическом/дифференциальном термическом анализе и дифференциальной сканирующей калориметрии присутствовали в том же виде, как они присутствуют в описании к оспариваемому патенту, т.е. с использованием признаков «приблизительно» и «около», а исключение данных признаков было сделано по требованию экспертизы;

- представление цифровых значений пиков на термограммах и в спектрах в любом случае носит приближенный характер, поскольку эти значения зависят от используемого оборудования, качества образца, условий анализа и других параметров, и специалисту в данной области понятно, что возможны отклонения от указанной конкретной величины по меньшей мере в пределах погрешности измерения;

- в описании к оспариваемому патенту подробно описаны средства и методы проведения термгравиметрического/дифференциального термического анализа и дифференциальной сканирующей калориметрии, а форма выражения полученных данных (в виде точечного, либо в виде приближенного значения) в любом случае рассматривается с определенной степенью приближения;

- в таблице 1 описания к оспариваемому патенту приведены данные стресс-теста, целью которого является прогноз изменения качества

лекарственного вещества в жестких условиях, и специалист в данной области на основе данных стресс-теста может сделать прогноз долгосрочной стабильности, т.е. если качество лекарства не изменилось за период стресс-теста, то есть все основания полагать, что оно останется стабильным в течение длительного времени, а данные таблицы 1 показывают, что даже при воздействии жестких условий стресс-теста: 100% влажности и температуры 60⁰С в течение 24 часов, содержание влаги в кристаллах безводного арипипразола не увеличивается, что подтверждает практически полное отсутствие гигроскопичности у кристаллов В безводного арипипразола.

Доводы патентообладателя, касающиеся оценки соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна», сводятся к следующему:

- при оценке соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» документы [3]-[7], [16] не могут быть приняты во внимание, поскольку имеют дату более позднюю, чем дата приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту;

- в статье [1], содержатся сведения о двух формах кристаллов безводного арипипразола (кристаллы Типа 1 и кристаллы Типа 2), а также сведения о форме гидрата арипипразола (кристаллы Типа 3), при этом в качестве физико-химических характеристик приведены температуры плавления: 140⁰С для кристаллов типа 1 и 150⁰С для кристаллов типа 2, а на графических материалах (фиг. 3) приведены в общем виде картины спектров рентгеновской дифракции без указания шкалы, и по приведенным графическим материалам невозможно однозначно идентифицировать значения пиков спектров рентгеновской дифракции таким образом, чтобы корректно сопоставить их со значениями пиков кристаллов В безводного арипипразола по независимому пункту 7 формулы оспариваемого патента;

- сведения о конкретных значениях пиков рентгеновских лучей кристаллов безводного арипипразола отсутствуют в статье [1], поскольку графические материалы содержат только общую картину распределения

пиков (без указания конкретных шкал и численных величин), при этом невозможно утверждать, что известные их статьи [1] кристаллы безводного арипипразола имеют те же характеристические пики порошковой дифракции рентгеновских лучей, что и кристаллы В безводного арипипразола по оспариваемому патенту ($2\Theta = 12,6^{\circ}, 15,4^{\circ}, 17,3^{\circ}, 18,0^{\circ}, 18,6^{\circ}, 12,6^{\circ}, 22,5^{\circ}$ и $24,8^{\circ}$);

- в статье [1] не раскрыты следующие признаки: характерные инфракрасные полосы поглощения при 2945, 2812, 1678, 1627, 1449, 1377, 1173, 960 и 770 см^{-1} на ИК-спектре; эндотермический пик при $141,5^{\circ}\text{C}$ в термогравиметрическом/ дифференциальном термическом анализе (скорость нагрева: $5^{\circ}\text{C}/\text{мин}$); эндотермический пик в дифференциальной сканирующей калориметрии (скорость нагрева $5^{\circ}\text{C}/\text{мин}$);

- доводы возражения, касающиеся того, что параметры, характеризующие кристаллы В безводного арипипразола, были присущи кристаллам Типа 1, известным из статьи [1], сделаны на основании исследований, проведенных через четыре года после даты приоритета оспариваемого патента, которые в рамках действующего законодательства не могут быть приняты во внимание при оценке соответствия изобретения условию патентоспособности «новизна»;

- утверждение: «одинаковые способы получения приводят к получению одинаковых продуктов», применимо только к получению химических соединений как таковых, но оно не применимо к получению кристаллических форм, поскольку исходя из известных закономерностей, можно теоретически предсказать возможность получения только химического соединения определенной структуры из известных промежуточных продуктов, однако, для известного вещества невозможно заранее предсказать даже существование его конкретных кристаллических форм, тем более способов их получения;

- в статье [1] не раскрыты условия перекристаллизации из смеси этанол/вода, которые позволяют непосредственно получить кристаллы В

безводного арипипразола по независимому пункту 7 формулы оспариваемого патента;

- кристаллы В безводного арипипразола по оспариваемому патенту получают из гидрата А арипипразола по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента, который получают путем измельчения обычного гидрата с последующим нагреванием до температуры 90-125⁰С;

- в патентном документе [2] содержится только пример синтеза арипипразола с получением продукта в виде «хлопьевидных кристаллов» с температурой плавления 139-139,5 ⁰С, при этом в данном документе отсутствуют характеристики кристаллической формы, позволяющие идентифицировать это вещество как кристаллы В безводного арипипразола.

Доводы патентообладателя, касающиеся оценки соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень», сводятся к тому, что объекты по пунктам 7-57 формулы оспариваемого патента имеют отсылку к пункту 7 данной формулы, следовательно, они соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку в возражении не приведено источников информации, из которых были известны до даты приоритета оспариваемого патента кристаллы В безводного арипипразола по пункту 7 формулы оспариваемого патента.

К отзыву патентообладателя приложены следующие материалы:

- HASKIN'S CHEMICAL DICTIONARY, New York, 1969 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [24]);

- Stability Testing of New Drug Substances and Products, Q1A9R2), 06.02.2003 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [25]);

- Отчет о третьем симпозиуме, посвященном перспективным направлениям химии твердого состояния: Состояние химии твердого состояния и ее вклад в физические науки», организаторы Меркурии Г. Канатзидис и Кеннет З. Попельмайер, 02.02.2007, с. 1-33 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [26]);

- Л. Тонглеи, Инженерия материалов твердых лекарственных форм, 06.11.2007 и перевод релевантных частей на русский язык (далее – [27]);

- Экспериментальный отчет с переводом релевантных частей на русский язык (далее – [28]).

На заседании коллегии палаты по патентным спорам 12.03.2012 патентообладателем дополнительно был представлен заверенный перевод с японского языка на русский язык релевантных частей приоритетной заявки JP2001-290645 (далее – [29]) и Новый английско-японский словарь, Токио, 1980, с.83 (далее – [30]).

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

С учетом даты подачи международной заявки (25.09.2002), 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 (далее – Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента 17.04.1998 №82 и зарегистрированные в Министерстве юстиции Российской Федерации 22.09.1998 № 1612 с изменениями и дополнениями от 08.07.1999 № 133 и от 13.11.2000 №2465 (далее – Правила ИЗ), и Правила ППС.

В соответствии с пунктом 1 статьи 29 Правил ИЗ патент в течение всего срока его действия может быть оспорен и признан недействительным полностью или частично, в случаях: а) несоответствия охраняемого объекта промышленной собственности условиям патентоспособности; б) наличия в формуле изобретения признаков, отсутствовавших в первоначальных материалах заявки.

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 их 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 и других отраслях деятельности.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.1. Правил ИЗ при установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения. Проверяется также, описаны ли в первичных материалах заявки средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в любом из пунктов формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в материалах заявки допустимо, чтобы указанные средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения. Кроме того, следует убедиться в том, что в случае осуществления изобретения по любому из пунктов формулы действительно возможна реализация указанного заявителем назначения.

В соответствии с подпунктом (3) пункта 19.5.1. Правил ИЗ если установлено, что на дату приоритета изобретения соблюдены все указанные требования, изобретение признается соответствующим условию промышленной применимости.

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

В соответствии с подпунктом (3) пункта 19.5.2. Правил ИЗ изобретение не признается соответствующим условию новизны, если в уровне техники выявлено средство, которому присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в предложенной заявителем формуле изобретения, включая характеристику назначения.

В соответствии с подпунктом (5) пункта 19.5.2. Правил ИЗ 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 ИЗ изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение признается не следующим для специалиста явным образом из уровня техники, в том случае, когда 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.

Проверка соблюдения указанных условий включает:

- определение наиболее близкого аналога;
- выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);
- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения.

Согласно подпункту (1) пункта 3.2.4.3. Правил ИЗ сущность изобретения выражается в совокупности существенных признаков, достаточной для достижения обеспечиваемого изобретением технического результата. Признаки относятся к существенным, если они влияют на достигаемый технический результат, т.е. находятся в причинно следственной связи с указанным результатом. Технический результат представляет собой характеристику технического эффекта, свойства, явления и т.п., которые могут быть получены при осуществлении (изготовлении) или использовании средства, воплощающего изобретение.

Согласно подпункту (3) пункта 3.2.4.5. Правил ИЗ для изобретения, относящегося к новому индивидуальному химическому соединению с установленной структурой, приводится структурная формула, доказанная известными методами, физико-химические константы и описывается способ, которым новое соединение впервые получено.

Согласно пункту 3.3.5. Правил ИЗ в формулу изобретения, характеризующую индивидуальное химическое соединение любого происхождения, включаются наименование или обозначение соединения, а также физико-химические или иные характеристики, необходимые для отличия данного соединения от других.

В соответствии с пунктом 22.3 Правил ИЗ при определении уровня техники общедоступными считаются сведения, содержащиеся в источнике информации, с которым любое лицо может ознакомиться само, либо о содержании которого ему может быть законным путем сообщено.

Датой, определяющей включение источника информации в уровень техники, является:

- для опубликованных описаний к охраняемым документам – указанная на них дата опубликования;
- для отечественных печатных изданий и печатных изданий СССР - указанная на них дата подписания в печать;
- для отечественных печатных изданий и печатных изданий СССР, на которых не указана дата подписания в печать, а также для иных печатных изданий - дата выпуска их в свет, а при отсутствии возможности ее установления - последний день месяца или 31 декабря указанного в издании года, если время выпуска в свет определяется соответственно лишь месяцем или годом;
- для отчетов о научно- исследовательских работах, пояснительных записок к опытно-конструкторским работам и другой конструкторской, технологической и проектной документации, находящейся в органах научно-технической информации, - дата их поступления в эти органы.

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

Формула изобретения по оспариваемому патенту содержит 36 независимых пунктов. При этом независимый пункт 1 и зависимый от него пункт 2 формулы относятся к гидрату А арипипразола, а независимый пункт 3 и зависимые от него пункты 4-6 формулы к способам получения гидрата А арипипразола. Независимые пункты 7, 19 и зависимые пункты 8-12 формулы относятся к кристаллам В безводного арипипразола; независимый пункт 13 и зависимые от него пункты 14-18 формулы относятся к способам получения кристаллов В безводного арипипразола; независимые пункты 20,29 и зависимые от них пункты 21-22, 30-31 формулы относятся к фармацевтическим композициям, содержащим кристаллы В безводного арипипразола; независимые пункты 23-26,45-46, 50, 55 формулы относятся к способам получения фармацевтического твердого перорального препарата; независимые пункты 32-40 формулы относятся к способам лечения; независимый пункт 41 и зависимый пункт 42 формулы относятся к лекарственным средствам; независимые пункты 43 – 44, 49, 54 формулы - к способам получения гранул кристаллов В безводного арипипразола; независимые пункты 47-48, 51-53, 56-57 формулы - к фармацевтическому твердому пероральному препарату.

Анализ доводов сторон, касающийся оценки наличия в формуле изобретения по оспариваемому патенту признаков, отсутствовавших в первоначальных материалах заявки, показал следующее.

Действительно, в процессе экспертизы заявки, по которой был выдан оспариваемый патент, в формулу изобретения было внесено уточнение, заключающееся в замене признака: «кристаллы В ангидрида арипипразола» (пункты 13, 15- 79 первоначальной формулы изобретения) на признак: «кристаллы В безводного арипипразола». Указанное уточнение было обусловлено обнаруженной очевидной для специалиста в данной области ошибкой (возможно связанной с двойным переводом материалов заявки с

японского языка на английский и с английского языка на русский), заключающейся в замене термина «anhydrous» (безводный) на термин «anhydride» (ангидрид) при переводе материалов приоритетной японской заявки на английский язык.

На заседании коллегии палаты по патентным спорам 12.03.2012 патентообладателем был представлен заверенный перевод с японского языка абзацев [001], [0012], [009] приоритетной заявки [29], в которых речь идет о получении именно безводных кристаллов арипипразола для длительного хранения лекарственных средств. Кроме того, из представленных словарей [30] следует, что в японском языке для обозначения терминов «безводный» и «ангидрид» используется одно и то же сочетание двух иероглифов.

При этом в первоначальном описании, представленном при переводе заявки на национальную фазу в Российское патентное ведомство, содержатся термины и «безводная форма арипипразола» и «ангидрид арипипразола» и «кристаллы безводного ангидрида арипипразола». Вместе с тем, анализ первоначального описания к заявке, по которой выдан оспариваемый патент, показывает, что объектом изобретения являлись именно «кристаллы В безводного арипипразола». Так, на листах 2-4 первоначального описания содержится информация о создании безводной кристаллической формы арипипразола. Кроме того, термин «безводный» упоминается при описании кристаллического вещества В: «Было также обнаружено, что эта форма арипипразола с пониженной гигроскопичностью является кристаллическим веществом, определенным здесь, как ангидрид В. Был также открыт конкретный способ получения этого безводного кристаллического вещества».

Здесь целесообразно отметить, что согласно сведениям, содержащимся в словаре [24] «ангидрид – соединение (обычно кислота), из которого удалена вода», а «безводный – соединение, которое полностью лишено воды». При этом специалисту понятно, что при простом нагревании гидрата арипипразола мог быть получен только безводный арипипразол, а не продукт

конденсации арипипразола, поскольку в данном соединении нет легко разрываемых связей, и, следовательно, нет объективной возможности превращения арипипразола в ангидрид арипипразола.

Таким образом, в результате анализа первоначального описания заявки, по которой был выдан оспариваемый патент, специалисту очевидно, что заявлены различные полиморфные формы (безводные и гидратные) одного и того же известного фармакологически активного вещества – арипипразола, а не его производные (продукты химической модификации).

Исходя из вышеизложенного можно констатировать, что в возражении отсутствуют основания для признания наличия в формуле изобретения признаков, отсутствовавших в первоначальных материалах заявки.

Анализ доводов сторон, касающийся оценки соответствия изобретения по пункту 7 формулы оспариваемого патента, а также изобретений по пунктам 8-11, 13-26, 29-57 данной формулы условию патентоспособности «промышленная применимость», показал следующее.

Доводы лица, подавшего возражение, относящиеся к условию патентоспособности «промышленная применимость», непосредственно касаются изобретений по пунктам 7, 12, 27, 28 формулы оспариваемого патента, а несоответствие данному условию патентоспособности изобретений по остальным пунктам формулы оспаривается со ссылкой на указанные четыре пункта.

В качестве доводов о несоответствия изобретения по независимому пункту 7 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость» в возражении указано на то, что формула оспариваемого патента не основана на описании. Так, величины эндотермических пиков в термогравиметрическом/дифференциальном термическом анализе и дифференциальной сканирующей калориметрии в независимом пункте 7 данной формулы представлены в виде точечных значений 141, 5⁰С и 140,7⁰ С без использования уточняющих признаков «приблизительно» и «около», тогда как в описании оспариваемого патента

содержатся сведения о том, что безводные кристаллы В арипипразола, полученные по примеру 2, содержащемуся в описании к оспариваемому патенту, имеют в термогравиметрическом/ дифференциальном термическом анализе эндотермический пик приблизительно около $141,5^{\circ}\text{C}$, а при дифференциальной сканирующей калориметрии – приблизительно около 140°C .

В отношении данных доводов следует отметить, что представление цифровых значений пиков на термограммах и в спектрах всегда носит приближенный характер, поскольку данные значения зависят от условий проведения анализа и используемого оборудования, и специалисту понятно, что в любом случае возможны отклонения от указанной конкретной величины в пределах погрешности измерения, при этом независимо от формы представления, указанное точечное значение рассматривается с определенной степенью приближения.

Вместе с тем, в описании к оспариваемому патенту описаны средства и методы проведения термогравиметрического/дифференциального термического анализа и дифференциальной сканирующей калориметрии.

Что касается пунктов 12, 27, и 28 формулы оспариваемого патента, в которых содержится признак «кристаллы В безводного арипипразола не будут превращаться в водную форму арипипразола при сохранении должным образом» при определенной влажности и температуре в течении длительного времени, то специалисту понятно, что указанные признаки характеризуют условия хранения кристаллов безводного арипипразола, а именно температуру и влажность. Что касается признака «при сохранении должным образом», то специалисту понятно, что данный признак говорит только о том, что в обычных условиях хранения кристаллы В безводного арипипразола не будут превращаться в водную форму арипипразола. С учетом того, что в указанных пунктах формулы приведены конкретные условия хранения кристаллов В безводного арипипразола признак: «при сохранении должным образом», является идентифицируемым.

Таким образом, в возражении отсутствуют основания для признания группы изобретений по оспариваемому патенту несоответствующей условию патентоспособности "промышленная применимость".

Анализ доводов сторон, касающийся оценки соответствия изобретения по независимому пункту 7 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «новизна», показал следующее.

В независимом пункте 7 формулы оспариваемого патента указана конкретная форма арипипразола – «кристаллы В безводного арипипразола», которые характеризуются спектром порошковой дифракции рентгеновских лучей, имеющим характеристические пики порошковой дифракции рентгеновских лучей при $2\Theta = 11,0^\circ, 16,6^\circ, 19,3^\circ, 20,3^\circ$ и $22,1^\circ$; характерные инфракрасные полосы поглощения при 2945, 2812, 1678, 1627, 1448, 1377, 1173, 960 и 779 см⁻¹ на ИК-спектре (KBr); эндотермический пик при 141,5°C в термогравиметрическом/ дифференциальном термическом анализе (скорость нагрева: 5°C/мин); эндотермический пик при 140,7° в дифференциальной сканирующей калориметрии (скорость нагрева 5°C/мин).

В качестве источника информации, из которого известны кристаллы безводного арипипразола, имеющие вышеуказанные характеристики, в возражении приведены статья [1], а также патентный документ [2].

В статье [1] содержатся сведения о полиморфных формах арипипразола, в том числе о безводных кристаллах Типа 1, имеющих точку плавления 140⁰ С.

Однако, в статье [1] отсутствуют признаки :

- кристаллы имеют спектр дифракции рентгеновских лучей при $2\Theta = 11,0^\circ, 16,6^\circ, 19,3^\circ, 20,3^\circ$ и $22,1^\circ$;

- кристаллы имеют характерные инфракрасные полосы поглощения при 2945, 2812, 1678, 1627, 1448, 1377, 1173, 960 и 779 см⁻¹ на ИК-спектре (KBr);

- эндотермический пик при 141,5°C в термогравиметрическом/ дифференциальном термическом анализе (скорость нагрева: 5°C/мин);

- эндотермический пик при $140,7^{\circ}$ в дифференциальной сканирующей калориметрии (скорость нагрева $5^{\circ}\text{C}/\text{мин}$).

Здесь следует отметить, что в статье [1] на фиг. 3 действительно приведена общая картина дифракции рентгеновских лучей для каждого из упомянутых в статье [1] полиморфных форм кристаллов арипипразола: Типа 1, Типа 2, Типа 3. Однако картины дифракции приведены в очень мелком масштабе и без указания шкал и численных величин, т.е. по приведенному изображению невозможно установить присущность кристаллам безводного арипипразола Типа 1 значений пиков спектра дифракции рентгеновских лучей при $2\Theta = 11,0^{\circ}$, $16,6^{\circ}$, $19,3^{\circ}$, $20,3^{\circ}$ и $22,1^{\circ}$, т.к. по изображению в статье их невозможно идентифицировать.

Вместе с тем, изобретение, относящееся к новой форме известного соединения, охарактеризованное соответствующими признаками (например, данными рентгеноструктурного анализа) признается соответствующим условию новизны, если в уровне техники до даты приоритета не была известна данная форма соединения, характеризующаяся аналогичными данными. Такой же вывод делается в случае, если была известна одна кристаллическая форма этого соединения, а заявлена другая кристаллическая форма этого же соединения с другими характеристиками и свойствами.

В возражении содержатся доводы о том, что вышеперечисленные характеристики были присущи кристаллам безводного арипипразола, известным из статьи [1]. Для подтверждения указанных доводов к возражению приложены результаты экспериментальных исследований, отраженные в отчетах [3] и [4]. Однако, данные отчеты [3] и [4] имеют дату более позднюю, чем дата приоритета оспариваемого патента, соответственно, они не могут быть использованы при анализе.

Кроме того, следует отметить, что в отчетах [3] и [4] содержится информация о том, что исследуемые кристаллы безводного арипипразола были получены способом, известным из статьи [1]. Однако, в указанной статье имеется только информация о том, что содержащие воду кристаллы

Типа 3 превращали в безводные кристаллы Типа 1 путем нагревания при 80°C , но при этом не раскрыт полностью способ получения кристаллов Типа 1.

Вместе с тем, кристаллы В безводного арипипразола по независимому пункту 7 формулы оспариваемого патента получают путем нагревания гидрата А арипипразола по пункту 1 или 2 данной формулы при температуре $90-125^{\circ}\text{C}$ в течение 3-50 часов. При этом в возражении отсутствуют доводы о несоответствии условиям патентоспособности гидрата А арипипразола по пункту 1 или 2 формулы оспариваемого патента.

Таким образом, из статьи [1] не известно средство, содержащее все признаки изобретения по независимому пункту 7 формулы оспариваемого патента.

Что касается патентного документа [2], то в данном документе содержатся сведения о синтезе самого арипипразола с получением кристаллов в виде хлопьев, имеющих температуру плавления $139,0-139,5^{\circ}\text{C}$, при этом отсутствуют сведения о кристаллах безводного арипипразола, имеющих характеристики указанные в независимом пункте 7 формулы оспариваемого патента.

Исходя из вышеизложенного, можно констатировать, что в возражении не содержится доводов, позволяющих признать изобретение по независимому пункту 7 формулы оспариваемого патента несоответствующим условию патентоспособности "новизна".

Что касается доводов возражения о несоответствии изобретений по независимым пунктам 20, 29, 51 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «новизна», то указанные пункты формулы содержат признак: «кристаллы В безводного арипипразола по пункту 7 формулы», следовательно, изобретения по пунктам 20, 29, 51 формулы оспариваемого патента также нельзя признать несоответствующими условию патентоспособности «новизна».

Что касается оценки соответствия изобретений по пунктам 13, 23-26, 32-57 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «изобретательский уровень», то все указанные пункты формулы содержат признак: «кристаллы В безводного арипипразола по пункту 7 формулы», следовательно, изобретения по данным пунктам формулы нельзя признать несоответствующими условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Анализ приложенных к возражению материалов показал следующее.

Отчеты [5] – [7], [16], также как и отчеты [3] – [4], не могут быть использованы при анализе по указанным выше причинам.

Патентный документ [18] также не может быть принят для анализа, поскольку имеет дату более позднюю, чем дата приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту.

Другие приложенные к возражению материалы не содержат сведений о признаках группы изобретений по оспариваемому патенту, так:

- сведения из Интернет [11] относятся к анализатору SDT Q – 600 термогравитометрическому (кроме того, в материалах возражения отсутствует документальное подтверждение даты размещения данных сведений в сети Интернет);

- в книге [9] содержатся только общие сведения о функциональных производных карбоновых кислот - ангидридах;

- в источниках информации [14] и [15] содержатся общие сведения о процессах измельчения, просеивания и сушки твердых тел применительно к лекарственным средствам;

- источник информации [17] содержит общие сведения о порошковой дифрактометрии в материаловедении;

- в релевантной части патентного документа [18] приведены только сведения о гигроскопичности аморфных и кристаллических веществ;

- энциклопедия [19] содержит общие сведения об изготовлении фармацевтических форм;

- из учебников [20] и [21] известны сведения об удалении растворителей и воды из проб химических веществ.

Что касается доводов, изложенных в «особом мнении», поступившем 14.03.2012, то они проанализированы в настоящем заключении выше.

Учитывая вышеизложенное, коллегия палаты по патентным спорам пришла к выводу о возможности

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 19.08.2011, патент Российской Федерации на изобретение № 2259366 оставить в силе.