

**ЗАКЛЮЧЕНИЕ**  
**коллегии по результатам рассмотрения  возражения**

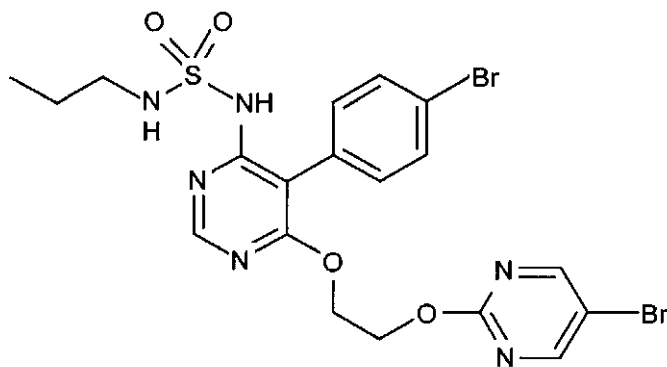
Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 1 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 231-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации и отдельные законодательные акты Российской Федерации» (далее - Кодекс) и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденные приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020, регистрационный № 59454, опубликованными на официальном интернет-портале правовой информации [www.pravo.gov.ru](http://www.pravo.gov.ru), 26.08.2020, № 0001202008260011, дата вступления в силу 06.09.2020 (далее – Правила ППС), рассмотрела поступившее 18.11.2020 возражение от ООО «БАЗИС» (далее - лицо, подавшее возражение) против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2424805, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2424805 на группу изобретений "Стабильные фармацевтические композиции, включающие пиримидинсульфамид" с конвенционным приоритетом от 12.09.2005, установленным по дате подачи заявки EP PTC/EP2005/009775, выдан на имя компании АКТЕЛИОН ФАРМАСЬЮТИКЛЗ ЛТД (СН) (далее - патентообладатель).

Патент выдан со следующей формулой изобретения:

«1. Стабильная фармацевтическая композиция, обладающая антагонистической активностью в отношении эндотелиновых рецепторов, включающая:

а) соединение формулы I или его фармацевтически приемлемую соль, сольват, гидрат или морфологическую форму



I

б) наполнитель, состоящий из моногидрата лактозы с монокристаллической целлюлозой;

в) вещество, обеспечивающее распадаемость, состоящее из натриевой соли гликолята крахмала или комбинации натриевой соли гликолята крахмала и поливинилпирролидона;

г) поверхностно-активное вещество, состоящее из полисорбата, в общем количестве от 0,1 до 3 мас.% в пересчете на полную массу фармацевтической композиции; и

е) смазывающее вещество, состоящее из стеарата магния.

2. Стабильная фармацевтическая композиция по п.1, в которой полисорбат присутствует в общем количестве от 0,1 до 1 мас.% в пересчете на полную массу фармацевтической композиции.

3. Стабильная фармацевтическая композиция по п.1 или 2, в которой полисорбат представляет собой полисорбат 80.

4. Фармацевтическая композиция по одному из пп.1-3, которая находится в форме капсулы.

5. Фармацевтическая композиция по одному из пп.1-3, которая находится в форме таблетки.

6. Применение стабильной фармацевтической композиции по любому из пп.1-5 для приготовления лекарственного средства, предназначенного для лечения легочной артериальной гипертензии».

Против выдачи данного патента, в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса, поступило возражение, мотивированное несоответствием изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень».

К возражению приложены следующие источники информации:

- книга Sarfaraz K. Niazi Handbook of Pharmaceutical Manufacturing Formulations. Compressed solid products Volume 1, CRC Press. 2004, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [1]);
- публикация патента РФ на изобретение № 2206324 (далее – [2]);
- публикация патента США № 6300359, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [3]);
- публикация заявки США № 2005/0169986 A1, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [4]);
- международная публикация WO 9944580 A1, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [5]);
- публикация евразийского патента № 000676 B1 (далее – [6]);
- международная публикация WO 02053557 A1, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [7]).

Суть содержащихся в возражении доводов сводится к тому, что из книги [1] известны таблетки альбендазола, а отличие композиции из книги Sarfaraz K. Niazi от композиции по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента состоит в том, что активным ингредиентом запатентованной композиции является соединение формулы I (мацитентан). При этом из патентов [2] (пример 4) и [3] (пример 2) известны композиции,

«отличия которых от композиции по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента состоят в том, что активным ингредиентом запатентованной композиции является соединение формулы I (мацитентан), и добавлен полисорбат от 0,1 до 3 мас. %».

При этом из публикаций [4]-[6] известно применение крахмалгликолята натрия, микрокристаллической целлюлозы, лактозы и поливинилпирролидона в качестве вспомогательных фармацевтических ингредиентов для изготовления таблеток, а само соединение I (мацитентан) известно из международной публикации [7], которое, как говорит лицо, подавшее возражение, ни в одном из упомянутых источников информации [1]-[7] не описано как «нестабильное».

Материалы возражения в установленном порядке были направлены в адрес патентообладателя, который представил 01.03.2021 отзыв по мотивам возражения.

Доводы, озвученные в отзыве, подкреплены сведениями из следующих источников информации:

- Справочник Volker Buhler Generic Drug Formulations, стр. 1, 2 и 40 (на 3 стр.) с переводом на русский язык (далее – [8]);
- Техническая информация Ludipress®, стр. 1 и 2 (на 2 стр.), с переводом на русский язык (далее – [9]);
- Техническая информация Soluble Kollidon® grades, стр. 1 и 4 (на 2 стр.), с переводом на русский язык (далее – [10]);
- Ответ Патентообладателя от 13 декабря 2010 г. по заявке 2008113869/15 (далее – [11]);
- Технология лекарственных форм: Том 2/ Р.В. Бобылев, Г.П. Грядунова, Л.А.Иванова и др., под ред. Л.А.Ивановой. М.: Медицина, 1991, стр. 1, 2, 21 (далее – [12]);
- Воскобойникова И.В., Авакян СБ., Сокольская Т.А. и соавт. Современные вспомогательные вещества в производстве таблеток.

Использование высокомолекулярных соединения для совершенствования лекарственных форм и оптимизации технологического процесса // Хим.-фарм. журнал, Т. 39, №1, 2005; стр. 22-28 (далее – [13]);

-Ю.Хоружая Т.Г., Чучалин В.С. Биофармация - научное направление в разработке и совершенствовании лекарственных препаратов: Учебное пособие. Томск: Лаб. оперативной полиграфии СибГМУ, 2006, стр. 1-2, 8-9 (далее – [14]);

- Декларация Оливье Ламбэра на английском языке, с переводом на русский язык (на 18 стр.) (далее – [15]);

- Декларация Марка Шрадера на английском языке, с переводом на русский язык (далее – [16]).

По мнению патентообладателя, изобретение по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку ни в одном из представленных в возражении источников информации [1]-[7] не содержится сведений как о композиции, включающей соединение I или его фармацевтически приемлемую соль, сольват, гидрат или морфологическую форму, так и о композиции, содержащей b) наполнитель, состоящий из моногидрата лактозы с микрокристаллической целлюлозой; c) вещество, обеспечивающее распадаемость, состоящее из натриевой соли гликолята крахмала или комбинации натриевой соли гликолята крахмала и поливинилпирролидона; d) поверхностно-активное вещество, состоящее из полисорбата, в общем количестве от 0,1 до 3 мас.% в пересчете на полную массу фармацевтической композиции; и e) смазывающее вещество, состоящее из стеарата магния.

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

С учетом даты международной подачи заявки (11.09.2006) заявки, по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки соответствия изобретения по оспариваемому патенту условиям

патентоспособности включает Патентный закон Российской Федерации № 3517-1 от 23 сентября 1992 года, в редакции Федеральных законов от 07.02.2003 N 22-ФЗ, от 02.02.2006 N 19-ФЗ, с изменениями, внесенными Федеральными законами от 27.12.2000 N 150-ФЗ, от 30.12.2001 N 194-ФЗ, от 24.12.2002 N 176-ФЗ (далее - Патентный закон), а также 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 ИЗ).

Согласно пункту 1 статьи 4 Патентного 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. Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности.

Согласно подпункту 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.

При этом проверка соответствия изобретения условию патентоспособности изобретательский уровень 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;

- анализ уровня техники с целью установления известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 3.2.4.2. Правил ИЗ, в качестве аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений, ставших общедоступными до даты приоритета изобретения. В качестве наиболее близкого к изобретению указывается тот, которому присуща совокупность признаков, наиболее близкая к совокупности существенных признаков изобретения.

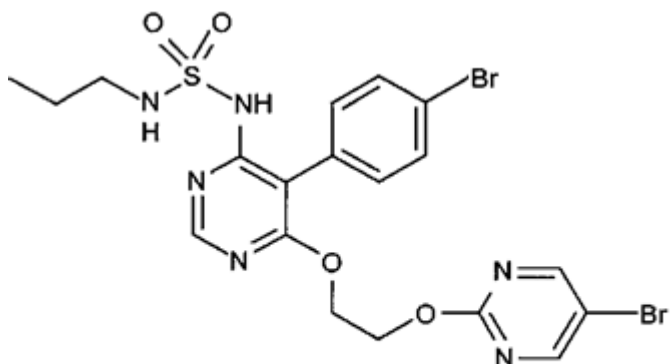
Группе изобретений по оспариваемому патенту представлена правовая охрана в объеме признаков, содержащихся в приведенной выше формуле.

Формула оспариваемого патента содержит два независимых пункта, в которых охарактеризованы следующие объекты: «Стабильная фармацевтическая композиция, обладающая антагонистической активностью в отношении эндотелиновых рецепторов...» (независимый пункт 1 приведенной выше формулы) и «Применение стабильной фармацевтической композиции по любому из пп.1-5 для приготовления лекарственного средства, предназначенного для лечения легочной артериальной гипертензии» (независимый пункт 6 приведенной выше формулы).

Приведенные в возражении доводы указаны только в отношении независимого пункта 1 приведенной выше формулы, характеризующей группу изобретений. Возражение не содержит доводов в отношении независимого пункта 6 формулы, приведенной выше.

Анализ доводов сторон показал следующее.

Активным веществом композиции по оспариваемому патенту, согласно независимому пункту 1 вышеприведенной формулы, является соединение



I

(мацитентан).

Из описания к оспариваемому патенту следует, что изобретение обеспечивает стабильную фармацевтическую композицию соединения I (мацитентана), обладающую благоприятным профилем растворения (см. реферат; стр.11 последняя строка-стр.12, абз 1-6; стр. 27, строка 30-стр.30; строка 11, чертеж, стр. 31). Таким образом, технический результат от реализации изобретения по оспариваемому патенту заключается в стабильности композиции и в благоприятном профиле растворения.

Согласно действующему на дату подачи заявки, по которой выдан оспариваемый патент, законодательству, в качестве ближайшего аналога рассматривается известное из уровня техники средство того же назначения, которому присуща совокупность признаков, наиболее близкая к совокупности существенных признаков изобретения (см. пункт 3.2.4.2. Правил ИЗ, правовая база выше).

Исходя из сведений, представленных в возражении и фигурируемых в нем источниках информации [1]-[7], ближайшим аналогом является средство, раскрытое в публикации [7], содержащее мацитентан и используемое для лечения расстройств, связанных с ролью эндотелина.



Так, например, в публикации [7] содержатся сведения о том, что фармацевтические композиции могут содержать соединения формулы I, в частности мацитентан, а также их фармацевтически приемлемые соли в сочетании с неорганическими и/или органическими наполнителями, которые обычно используются в фармацевтической промышленности, такими как лактоза, крахмал или его производные, тальк, стеариновая кислота или соли этих материалов (см. пп. 12,13 формулы изобретения, стр.16, строки 20-30, стр.17, абз.2).

Отличием композиции по оспариваемому патенту от известной из публикации [7] является наличие в ней: наполнителя, состоящего из моногидрата лактозы с микрокристаллической целлюлозой; вещества, обеспечивающего распадаемость, состоящего из натриевой соли гликолята крахмала или комбинации натриевой соли гликолята крахмала и поливинилпирролидона; поверхностно-активного вещества, состоящего из полисорбата, в общем количестве от 0,1 до 3 мас.% в пересчете на полную массу фармацевтической композиции; и смазывающего вещества, состоящего из стеарата магния.

При этом ни один из источников [2]-[7] не содержит сведений об использовании поверхностно-активного вещества, состоящего из полисорбата, в фармацевтических композициях вообще и в общем количестве от 0,1 до 3% по весу в расчете на полную массу фармацевтической композиции, как это отражено в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента.

Что касается источника информации [1], то в нем отсутствуют сведения как о наличии активного вещества мацитентана, так и о поверхностно-активном веществе, состоящем из полисорбата в общем количестве от 0,1 до 3% по массе в пересчете на общий вес фармацевтической композиции, которое влияло бы на стабильность любого активного ингредиента, не говоря уже о стабильности мацитентана.

Следует отметить, что источники информации [1]-[6] относятся к фармацевтическим композициям активных ингредиентов, которые имеют абсолютно иную химическую структуру и свойства, чем мацитентан, содержащийся в композиции по оспариваемому патенту. При этом в возражении отсутствуют доказательства того, что составы, раскрытые в упомянутых источниках информации [1]-[6] для совершенно разных соединений, будут применимы к составу для мацитентана, который присутствует в композиции по оспариваемому патенту. В композициях, раскрытых в источниках [1]-[6], используются активные вещества с другими назначениями, нежели по оспариваемому патенту, а именно: в композиции [1] используется противоглистное средство-альбендазола; в композиции [2] – ингибитор HMG CoA редуктазы для лечения гиперхолестеринэмии и атеросклероза; в композиции [4] - регулятор потенции - силденафила; в композиции [5] -противовоспалительные средства ибупрофена; в композиции [6] - ингибитор ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) - каптоприла.

Таким образом, ни одна из композиций, раскрытых в источниках информации [1]-[6], не включает в качестве активного компонента соединение формулы I (мацитентан-МНН) по оспариваемому патенту.

При этом существенным признаком композиции по оспариваемому патенту является определенное сочетание вспомогательных веществ с мацитентином и заявленными концентрациями полисорбата.

Кроме того, из учебника [12] известно, что «...ни один фармацевтический фактор не оказывает столь сложного и значительного влияния на действующие вещества, как вспомогательные вещества, их природа, количество. Являясь своеобразной матрицей активных веществ, постоянно контактируя с ними, вспомогательные вещества сами обладают определенными физико-химическими свойствами, которые в различных условиях могут проявляться по-разному и во всех случаях применения, так или иначе, воздействуют на систему: лекарственное вещество - организм» (см. стр. 21, 2 абзац).

Также можно обратить внимание на известные специалистам сведения о том, что в зависимости от химической структуры, физико-химических свойств лекарственного вещества, используемых вспомогательных компонентов, более выраженным может быть эффект того или другого супердезинтегранта. Так, например, растворимость нифедипина в таблетках, содержащих гликолят крахмала или натрия кроскармеллозу, была значительно выше, чем в таблетках, содержащих кросповидон (см., например Хим-фарм журнал [13] (стр. 22, 23, 25, 26) . При этом, например, в композиции с ибупрофеном вводят лимонную кислоту, для уменьшения высвобождения ибупрофена *in vitro* и его всасывания *in vivo*. В то время как использование гидроксипропилметилцеллюлозы и лимонной кислоты оказывало существенное влияние на высвобождение кетансерина из таблеток. Причем увеличение концентрации лимонной кислоты обеспечивало преобладание механизма диффузии и увеличение скорости высвобождения лекарственного вещества, тогда как пропорциональное увеличение гидроксипропилметилцеллюлозы приводило к уменьшению скорости растворения (см. учебное пособие [14], стр.8-9).

Таким образом, каждое вспомогательное вещество обладает совокупностью специфических технологических и биофармацевтических характеристик, оказывающих в конечном итоге значимое влияние на параметры готовой лекарственной формы и высвобождение действующего вещества, причем один и тот же с химической точки зрения наполнитель/адьювант может проявлять совершенно разные технологические свойства в разных фармацевтических композициях.

Источники [8]-[11], [15], [16] представлены в отзыве для сведений справочного характера и в контексте данного заключения не являются необходимыми для оценки изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень».

На основании изложенного можно констатировать, что возражение не содержит доводов, позволяющих сделать вывод о несоответствии изобретения,

охарактеризованного в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента, условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. пункт 1 статьи 4 Патентного закона).

Поскольку независимый пункт 6 формулы оспариваемого патента включает в себя все признаки изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента, то оно также не может быть признано несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень», в свете доводов, приведенных в настоящем возражении.

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

**отказать в удовлетворении возражения, поступившего 18.11.2020, патент Российской Федерации на изобретение № 2424805 оставить в силе.**