

Приложение
к решению Федеральной службы по
интеллектуальной собственности

ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам рассмотрения
возражения

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 Гражданского кодекса Российской Федерации, с изменениями и дополнениями, внесенными федеральным законом №35-ФЗ от 12 марта 2014 (далее – Кодекс) и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение Лисовенко Виктора Борисовича (далее - лицо, подавшее возражение), поступившее 03.11.2015 в Федеральный орган исполнительной власти по интеллектуальной собственности (далее – Роспатент), против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2203659, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2203659 на группу изобретений «Фармацевтические композиции на основе соли микофеноловой кислоты с энтеросолюбильным покрытием» выдан по заявке № 98120360/14 компании НОВАРТИС АГ, Швейцария (далее – патентообладатель) со следующей формулой:

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса, в Федеральный орган исполнительной власти по интеллектуальной собственности поступило возражение, мотивированное несоответствием запатентованной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень» и «промышленная применимость».

Для подтверждения данных мотивов в возражении приведены следующие документы:

US 5190753, дата публикации 02.03.1993 (далее – [1]);
US 5428040, дата публикации 27.06.1995 (далее – [2]);
GB 1157099, дата публикации 02.07.1969 (далее – [3]);
GB 1157100, дата публикации 02.07.1969 (далее – [4]);
GB 1158387, дата публикации 16.07.1969 (далее – [5]);
WO 95/14023, дата публикации 26.05.1995 (далее – [6]);
Epinerre et al., Mysophenolic acid for psoriasis, Journal of the American Academy for Dermatology, Vol. 17, Number 6, December 1987 (далее – [7]);
Jones et al, Treatment of psoriasis with oral mysophenolic acid, Journal of the Investigative Dermatology, Vol. 65, No. 6, December 1975 (далее – [8]);
GB 1203328, дата публикации 26.08.1970 (далее – [9]);
US 3880995, дата публикации 29.04.1975 (далее – [10]);
US 4725622, дата публикации 16.02.1998 (далее – [11]);
WO 94/12184, дата публикации 09.04.1994 (далее – [12]);
WO 94/26266, дата публикации 24.11.1994 (далее – [13]);
WO 1996/36319, дата публикации 21.11.1996 (далее – [14]);
AU 693470, дата публикации 22.03.1995 (далее – [15]);
AU 666577, дата публикации 15.03.1994 (далее – [16]);
US 4912136, дата публикации 27.03.1990 (далее – [17]);
US 2990328, дата публикации 27.06.1961 (далее – [18]);
Br. J. clin. Pharmac. 1991, 32, 77-83 (далее – [19]);
Arthritis Rheum. 1988 Sep; 31(9): 1111-6 (далее – [20]);
Clin Pharmacol Ther. 1987 Jul; 42(1): 28-32 (далее – [21]);
Scand J Gastroenterol. 1985 Mar; 20(2): 239-42 (далее – [22]);
WO 1989/08448, дата публикации 21.09.1989 (далее – [23]);
FDA Review Documents of MYFORTIC (Pharmacological Review) 26.02.2004 (далее – [24]);
FDA Review Documents of MYFORTIC (Statistical Review) 29.02.2004 (далее – [25]);

Gastrointestinal side effects of mycophenolic acid in renal transplant patients: a reappraisal, май 2013 (далее – [26]);

Nephrol Dial Transplant, 2007, 22: 2440-2448 (далее – [27]);

Mycophenolic acid agents: Is enteric coating the answer? (Transplant Research and Risk Management); 28 Mar 2011 (далее – [28]);

Clinical Medicine: Therapeutics 2009:1 927-933 (далее – [29]);

Кондратьева Т.С., Иванова Л.А. Технология лекарственных форм. Том 2, "Медицина", Москва 1991 (далее – [30]);

Общая фармакопейная статья: Прочность таблеток на раздавливание (ОФС 42-0132-09) (далее – [31]);

SA 6804959, дата публикации 22.11.1967 (далее – [32]).

В возражении отмечено, что признаки независимых пунктов 1, 2, 3, 11, 12 формулы по оспариваемому патенту известны из источников [1] - [31], и при использовании данных признаков достигается технический результат, который заключается в снижении побочных эффектов лекарственных средств, приемлемых в качестве иммунодепрессантов для лечения отторжения трансплантата органа или ткани. По мнению стороны, подавшей возражение, данный технический результат достигается путем использования соли микофеноловой кислоты вместо морфолиноэтилового эфира микофеноловой кислоты, а также за счет нанесения энтеросолюбильного покрытия на пероральную форму лекарственного препарата.

При этом в отношении отличительного признака п.1 «в верхней части кишечного тракта» лицо, подавшее возражение, отметило, что данный признак не несет существенной смысловой нагрузки и не является существенным. Описание не показывает возможность достижения технических результатов в зависимости от конкретного места высвобождения соли «в кишечном тракте» (его «верхней» или «нижней» части). Кроме того, признак «верхняя часть кишечного тракта» является

неясным, поскольку в данной области техники не существует понятия «кишечный тракт» или «верхний кишечный тракт». Таким образом, признак «обеспечивающего высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта» по существу является идентичным признаку «обеспечивающий высвобождение указанной соли в кишечнике».

В качестве прототипа лицо, подавшее возражение, приводит патентный документ [4].

С учетом изложенного, группа изобретений по указанным выше независимым пунктам формулы изобретения не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Признаки зависимых пунктов также известны из вышеуказанных источников информации.

Также в возражении отмечено, что независимый пункт 11 не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость», поскольку в описании изобретения не приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в независимом пункте 11 формулы изобретения. При этом также невозможно убедиться в том, что в случае осуществления изобретения действительно возможна реализация указанного заявителем назначения. В частности, в материалах заявки не описана возможность лечения каких-либо заболеваний на основе комбинированной терапии, в то время как эффективность комбинированной терапии должна быть исследована с точки зрения совместимости использования определенных лекарственных средств.

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

В адрес патентообладателя было направлено уведомление с приложением экземпляра вышеупомянутого возражения согласно пункту 3.1 Правил ППС.

Патентообладателем 21.07.2016 был представлен отзыв и 22.07.2016 представлено дополнение к отзыву.

Патентообладатель обращает внимание на то, что в возражении в качестве наиболее близкого аналога (прототипа) изобретения по независимому пункту 1 формулы указан патентный документ [4] (патент Великобритании GB 1,157,100), в котором заявлена фармацевтическая композиция, содержащая микофеноловую кислоту или ее соли, или низшие алкильные сложные эфиры и инертный нетоксичный фармацевтически приемлемый разбавитель или носитель. В описании документа [4] приведен пример фармацевтической композиции, содержащей 250 частей микофеноловой кислоты, 30 частей фосфата кальция, 30 частей кукурузного крахмала и 12 частей стерата магния, которую получали путем смешивания и гранулирования ингредиентов с последующим прессованием для получения таблеток для перорального введения. Несмотря на то, что в описании документа [4] указано, что авторы изобретения неожиданно обнаружили, что «микофеноловая кислота и его соли и низшие алкильные сложные эфиры являются митотическими супрессантами (т.е. они ингибируют или предотвращают митоз) и они обладают противоопухолевой и иммуносупрессорной активностью» (колонка 1, строки 16-23 [4]), в документе отсутствуют какие-либо экспериментальные данные, подтверждающие наличие биологической активности композиции, ее эффективности и безопасности при лечении указанных заболеваний. Патентный документ [4] датирован 1967 годом, задолго до того, как были проведены первые клинические испытания и микофенолят был впервые разрешен к применению в качестве лекарственного средства. Поэтому в патентном документе [4] отсутствуют данные о полезных свойствах микофеноловой кислоты и не содержится сведений о параметрах биологической доступности композиции и уровне побочных эффектов, в частности, со стороны ЖКТ. Соответственно, документ [4] не содержит и

не мог содержать информации о возможности улучшения данных показателей, например, путем нанесения на композицию энтеросолюбильного покрытия.

Документы [9] - [11], которые указаны оппонентом на с. 7 возражения в скобках, также содержат лишь упоминание о микофеноловой кислоте и ее производных, и о возможности ее применения для лечения определенных заболеваний. В документе [9] раскрыта комбинация производных микофеноловой кислоты и б-меркаптопурина, обладающая противоопухолевой и иммуносупрессивной активностью. При этом в документе указано, что данная комбинация может быть использована для лечения опухоли у животного, исключая человека. В документе [10] исследуют микофеноловую кислоту и ее производные, включая соли, для возможности лечения ревматоидного артрита, а в документе [11] исследуют производные микофеноловой кислоты, в которые не входят соли микофеноловой кислоты, для лечения ревматоидного артрита. В документах [9] - [11] отсутствуют сведения о биологической доступности и уровне побочных эффектов, в частности со стороны ЖКТ, для солей микофеноловой кислоты, и, соответственно, указанные документы не содержат информации о возможности улучшения данных показателей, например, путем нанесения на композиции энтеросолюбильного покрытия.

В источнике информации [30] отсутствуют сведения о том, что нанесение энтеросолюбильного покрытия на композицию на основе соли микофеноловой кислоты могло привести к улучшению ее биологической доступности. Как известно, энтеросолюбильное покрытие может улучшить биологическую доступность терапевтического агента, который подвергается разложению в кислотной среде желудка, предотвращая тем самым такое разложение и улучшая параметры биологической доступности агента. Также было известно, что микофеноловая кислота и ее соли стабильны в кислой среде желудка и, следовательно, нанесение энтеросолюбильного покрытия

на композицию на основе соли микофеноловой кислоты не могло привести к улучшению ее биологической доступности. В источнике [30] также отсутствуют сведения о том, что нанесение энтеросолюбильного покрытия на композицию на основе соли микофеноловой кислоты могло привести к снижению неблагоприятных побочных реакций со стороны ЖКТ, таких как диарея и изжога. Как указано в источнике [30], энтеросолюбильное покрытие может быть нанесено на лекарственный препарат, в частности, с целью защиты слизистых оболочек пищевода и желудка от разрушающего действия лекарственного вещества, т.е. от локального воздействия вещества на внутреннюю стенку желудка, что может приводить к нежелательным побочным эффектам, например к изжоге. Однако считалось, что нежелательные побочные реакции со стороны ЖКТ были вызваны не локальным разрушающим действием микофеноловой кислоты и ее солей при попадании в желудок, а системным воздействием вещества при попадании в кровоток и его биологической активностью, заключающейся в ингибировании клеточной пролиферации. Данное предположение подтверждалось тем, что микофеноловая кислота и ее соли могли быть введены в организм человека как перорально, так и парентерально. При этом способ введения данного вещества, как считалось, не влиял на уровень побочных эффектов со стороны ЖКТ, что подтверждало предположение о системном, а не локальном неблагоприятном воздействии соли микофеноловой кислоты на ЖКТ. На странице 11 возражения оппонент со ссылкой на документы [9] и [11] указал, что «наличие нежелательных побочных эффектов в ЖКТ у препарата на основе МФК было известно на дату создания изобретения по ОП». Между тем, в обоих документах указана возможность как перорального, так и парентерального введения микофеноловой кислоты или ее натриевой соли, но при этом нигде в документах не говорится о том, что уровень побочных эффектов зависел от способа введения препарата.

Иные цитируемые оппонентом источники информации [1], [2], [14] - [17], [19] - [22], в которых упоминается энтеросолюбильное покрытие, также не содержат сведений о том, что нанесение такого покрытия на композицию на основе соли микофенолята будет улучшать ее биологическую доступность и/или снижать уровень побочных эффектов со стороны ЖКТ.

В указанных в возражении на с. 10-11 источниках информации [14] - [17] и [19]-[22] также упоминается возможность использования энтеросолюбильных покрытий, но для лекарственных средств, отличных от микофеноловой кислоты и ее солей. Соответственно, материалы возражения не содержат сведений, подтверждающих известность влияния отличительного признака изобретения по оспариваемому патенту, заключающего в нанесении энтеросолюбильного покрытия на заявленную композицию, на технический результат оспариваемого изобретения, заключающийся в улучшении биологической доступности и/или уменьшении побочных эффектов заявленной фармацевтической композиции.

Таким образом, по мнению патентообладателя, в возражении не представлено доводов, позволяющих признать группу изобретений по оспариваемому патенту несоответствующей условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Кроме того, патентообладатель обращает внимание на то, что вызывают удивление рассуждения оппонента относительно того, что признак «в верхней части кишечного тракта» по независимому пункту 1 не носит существенной смысловой нагрузки и не является существенным, а описание патента не показывает возможность достижения технических результатов в зависимости от конкретного места высвобождения соли в «кишечном тракте». Данные рассуждения основаны, в частности, на утверждении, что в данной области техники не существует понятия «кишечный тракт» (абзац на с. 9-10 возражения). Патентообладатель

отмечает, что, во-первых, в описании оспариваемого патента указано, что соли микофеноловой кислоты высвобождаются в верхней части кишечника, например, в двенадцатиперстной кишке, тощей кишке и/или подвздошной кишке (с. 3, левая колонка, строки 49-52 описания патента). Во-вторых, довод оппонента о том, что в данной области техники не существует понятия «кишечный тракт» опровергается источником [30], процитированным самим оппонентом в возражении, где указано, что варьируя различными полимерами и различной толщиной пленки, можно добиться распада таблеток в определенном отделе кишечного тракта. Соответственно, оппонентом не было выявлено из уровня техники решения, имеющего признак «в верхней части кишечного тракта», что является дополнительными основанием для признания оспариваемого изобретения по независимому пункту 1 формулы соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень» в силу подпункта 2 пункта 19.5.3 Правил ИЗ.

Описание оспариваемого патента содержит исчерпывающие сведения, подтверждающие, что комбинация по независимому пункту 11 может быть использована в здравоохранении, а именно в качестве иммуносупрессанта, например, для лечения и предупреждения отторжения трансплантата. Заявленная комбинация содержит фармацевтически приемлемую соль микофеноловой кислоты с нанесенным энтеросолюбильным покрытием в сочетании с другим иммуносупрессантом, (см., например, с. 6, правая колонка оспариваемого патента) для одновременного, последовательного или раздельного введения, что подтверждает наличие в первичных материалах заявки средств и методов, с помощью которых возможно осуществление изобретения. Поскольку комбинация по пункту 11 в качестве активных ингредиентов содержит вещества, обладающие иммуносупрессорной активностью, в материалах заявки не требовалось представления дополнительных экспериментальных данных для

возможности осуществления изобретения, поскольку специалисту в данной области будет очевидна реализации его назначения. Мнение лица, подавшего возражение, что в материалах заявки не описана возможность лечения каких-либо заболеваний на основе комбинированной терапии, не основано на законе и не является доказательством принципиальной невозможности использования комбинации по независимому пункту 11 в здравоохранении в качестве иммуносупрессанта, что является необходимым условием для отрицания промышленной применимости изобретения. Соответственно, изобретение по независимому пункту 11 отвечает условию патентоспособности «промышленная применимость» в соответствии с требованием пункта 1 статьи 4 Патентного закона и подпункта 2 пункта 19.5.1 Правил ИЗ.

На заседании коллегии сторона, подавшая возражение, отсутствовала. При этом стороны, участвующие в рассмотрении возражения, были уведомлены о дате и времени заседания корреспонденцией от 16.06.2016.

В соответствии с п. 4.3 Правил ППС неявка любого лица, имеющего право участвовать в рассмотрении дела и уведомленного о дате и месте проведения заседания коллегии, не может явиться препятствием к рассмотрению дела.

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

На дату международной подачи заявки № 98120360/14 (10.04.1997), по которой был выдан оспариваемый патент, действовали следующие нормативные правовые акты, необходимые для проверки изобретения в отношении условия патентоспособности «изобретательский уровень» и «промышленная применимость», а именно:

Патентный закон Российской Федерации, введенный в действие с 14.10.1992 Постановлением Верховного Совета Российской Федерации за № 3517-1 от 23.09.1992 (далее Закон) и Правила составления, подачи и

рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные Председателем Роспатента 20 сентября 1993 года и зарегистрированные в Минюсте РФ 5 ноября 1993 г. N 386 (далее - Правила ИЗ).

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

Как отмечалось ранее, мотивом возражения является несоответствие группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в свете информации раскрытой в источниках [1]-[30], а также несоответствие изобретения по независимому пункту 11 формулы изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость».

Согласно пункту 1 статьи 4 Закона изобретению представляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Раскрывая данные положения Закона в отношении условия патентоспособности «промышленная применимость» подпункты (1)-(3) пункта 19.5.1 Правил ИЗ указывают, что, в соответствии с пунктом 1 статьи 4 Закона, изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности. При установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения. Проверяется также, описаны ли в первичных материалах заявки средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в независимом пункте Формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в материалах заявки допустимо, чтобы указанные средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения. Кроме того,

следует убедиться в том, что в случае осуществления изобретения действительно возможна реализация указанного заявителем назначения. Если установлено, что на дату приоритета изобретения соблюдены все указанные требования, изобретение, охарактеризованное в данном независимом пункте формулы, признается соответствующим условию промышленной применимости. При несоблюдении хотя бы одного из указанных требований делается вывод о несоответствии изобретения условию промышленной применимости.

В отношении условия патентоспособности «изобретательский уровень» подпункты (1)-(3) пункта 19.5.3 Правил ИЗ указывают, что в соответствии с пунктом 1 статьи 4 Закона изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники. Проверка изобретательского уровня проводится в отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте формулы, и включает: определение наиболее близкого аналога в соответствии с пунктом 3.2.4.2 настоящих Правил; выявление признаков, которыми отличается заявленное изобретение от наиболее близкого аналога (отличительных признаков); выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения. Изобретение признается соответствующим условию изобретательского уровня, если не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Не признаются соответствующими условию изобретательского уровня -изобретения, основанные, в частности: на дополнении известного средства какой-либо известной частью (частями), присоединяемой (присоединяемыми) к нему по известным правилам, для достижения

технического результата, в отношении которого установлено влияние именно таких дополнений.

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

Как отмечалось выше, формула оспариваемого патента на изобретение содержит группу изобретений, представленных независимыми пунктами 1, 2, 3, 11, 12.

Следует согласиться с лицом, подавшим возражение, что наиболее близким аналогом (прототипом) изобретения, отраженного в пункте 1 формулы оспариваемого патента, в соответствии с пунктом 3.2.4.2 Правил ИЗ следует признать патентный документ Великобритании [4], где раскрыта фармацевтическая композиция, проявляющая противоопухолевую и иммуносупрессорную активность, в частности в форме таблеток, пилюль, капсул, содержащая микофенольную кислоту или ее соль. Согласно единственному примеру описания прототипа, композиция содержит 250 частей микофеноловой кислоты, 30 частей фосфата кальция, 30 частей кукурузного крахмала и 12 частей стерата магния и ее которую получали путем смешивания и гранулирования ингредиентов с последующим прессованием для получения таблеток для перорального введения в терапевтических целях.

Отличие изобретения по пункту 1 формулы оспариваемого патента от прототипа заключается в том, что композиция состоит из ядра, включающего активный агент (в частности мофетил микофенолят, выступающий в виде соли микофеноловой кислоты), и нанесенного на него энтеросолюбильного покрытия, обеспечивающего высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта.

Технические результаты от использования композиции по оспариваемому патенту заключаются в следующем:

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

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

- композиции по оспариваемому изобретению переносятся лучше, чем микофеноловая кислота, вызывая менее выраженные побочные действия в отношении желудочно-кишечного тракта, в частности, такие как диарея и изжога.

Что касается технических результатов, связанных с:

а) введением меньших стандартных дозируемых форм, чем для микофеноловой кислоты;

б) лучшей переносимостью композиции по оспариваемому изобретению по сравнению с микофеноловой кислотой (вызывает менее выраженные побочные действия в отношении желудочно-кишечного тракта, в частности, такие как диарея и изжога), то подтверждение данных технических результатов отсутствует в описании оспариваемого патента. Представленные патентообладателем источники информации в отзыве на возражение от 21.07.2016 (Bunnapradist et al., «Mycophenolate mofetil dose reductions and discontinuations after gastrointestinal complications are associated with renal transplant graft failure », Transplantation, Vol. 82, No. 1, July 15, 2006

- далее [33], Chan et al., " Patient-Reported Gastrointestinal Symptom Burden and Health-Related Quality of Life following Conversion from Mycophenolate Mofetil to Enteric-Coated Mycophenolate Sodium ", Transplantation, Volume 81, Number 9, May 15, 2006 - далее [34], Bolin et al. " Improvement in 3-Month Patient-Reported Gastrointestinal Symptoms After Conversion From Mycophenolate Mofetil to Enteric-Coated Mycophenolate Sodium in Renal Transplant Patients", Transplantation, Volume 84, Number 11, December 15, 2007 - далее [35]) для подтверждения данных результатов опубликованы позже даты приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту и не могут быть включены в уровень техники, с учетом положений пункта 22.3 Правил ИЗ и пункта 1 статьи 4 Закона, при оценке на соответствие условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В описании оспариваемого патента присутствуют показатели биодоступности AUC и C_{max} для композиции с покрытием, высвобождающейся в верхней части кишечного тракта, которые выше, чем у средств без покрытия, что подтверждает технический результат, связанный с эффективностью действия композиции за счет улучшения показателей биодоступности.

При этом в представленных в возражении источниках информации [9] - [11], [30] отсутствовал признак «энтеросолюбильного покрытия, обеспечивающего высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта».

С учетом информации из уровня техники - источник (Lee et al , "Bioavailability Improvement of Mycophenolic Acid Through Amino Ester Derivatization", Pharmaceutical Research, Vol. 7, No. 2, 1990, (далее – [36]) - представленной патентообладателем в отзыве, об устойчивости мофетила микофенолята, выступающего в виде соли микофеноноловой кислоты, к гидролизу в кислой среде, достижение технического результата, связанного с улучшением биодоступности при использовании энтеросолюбильного

покрытия, обеспечивающего высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта было трудно спрогнозировать на основании известного уровня техники.

Что касается утверждения лица, подавшего возражения, в отношении того, что признак «верхняя часть кишечного тракта» является неясным, поскольку в данной области техники не существует понятия «кишечный тракт» или «верхний кишечный тракт», то оно не является убедительным

В частности, на с. 187 источника [30] указан определенный отдел кишечного тракта, а описание оспариваемого патента указывает, что композиция высвобождается в верхней части кишечника, например в двенадцатиперстной кишке, тощей кишке и/или подвздошной кишке.

Та же самая позиция отражена и в отзыве патентообладателя.

С учетом изложенного независимый пункт 1 оспариваемого патента признается соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень» с учетом положений подпункта 2 пункта 19.5.3 Правил ИЗ.

В отношении независимого пункта 2 необходимо отметить следующее.

Наиболее близким аналогом (прототипом) изобретения, отраженного в пункте 2 формулы оспариваемого патента, в соответствии с пунктом 3.2.4.2 Правил ИЗ следует признать патентный документ Великобритании [4], где раскрыта фармацевтическая композиция, проявляющая противоопухолевую и иммуносупрессорную активность, в частности в форме таблеток, пилюль, капсул, содержащая микофенольную кислоту или ее фармацевтически приемлемую соль. Согласно единственному примеру описания прототипа, композиция содержит 250 частей микофеноловой кислоты, 30 частей фосфата кальция, 30 частей кукурузного крахмала и 12 частей стерата магния, и ее получали путем

смешивания и гранулирования ингредиентов с последующим прессованием для получения таблеток для перорального введения в терапевтических целях.

Отличие изобретения по независимому пункту 2 по оспариваемому патенту от прототипа заключается в том, что на лекарственное средство нанесено энтеросолюбильное покрытие.

Технические результаты от композиции по независимому пункту 2 по оспариваемому патенту заключаются в следующем:

- соли микофеноловой кислоты с энтеросолюбильным покрытием, являются эффективными, хорошо переносимыми лекарственными средствами, в частности, для показаний, связанных с иммунодепрессией, особенно для лечения или предупреждения отторжения аллотрансплантата или ксенотрансплантата органа, ткани или клетки, например, после трансплантации или для лечения или предупреждения заболеваний, обусловленных иммунной системой (аутоиммунные заболевания), и обладают представляющими интерес характеристиками биологической доступности и стабильности;

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

- композиции по оспариваемому изобретению переносятся лучше, чем микофеноловая кислота, вызывая менее выраженные побочные действия в отношении желудочно-кишечного тракта, такие как диарея и изжога.

Что касается технических результатов, связанных с:

а) представляющими интерес характеристиками биологической доступности и стабильности;

б) введением меньших стандартных дозируемых форм, чем для микофеноловой кислоты;

в) лучшей переносимостью композиции по оспариваемому изобретению по сравнению с микофеноловой кислотой (вызывает менее выраженные побочные действия в отношении желудочно-кишечного тракта, в частности, такие как диарея и изжога), то подтверждение данных технических результатов отсутствует в описании оспариваемого патента применительно к данному независимому пункту. Источники информации [33]-[35], представленные патентообладателем для подтверждения данных результатов, опубликованы позже даты приоритета группы изобретений и не могут быть включены в уровень техники, с учетом положений пункта 22.3 Правил ИЗ и пункта 1 статьи 4 Закона, при оценке на соответствие условию патентоспособности «изобретательский уровень».

При этом из приведенного в возражении источника информации [30] известно нанесение энтеросолюбильного покрытия на таблетку, содержащую лекарственное средство, для целей локализации, пролонгации действия лекарственного вещества, содержащегося в таблетке или защиты слизистых желудочно-кишечного тракта от действия лекарственного средства (с. 184, 188 источника [30]).

Доводы патентообладателя в отношении данного объекта, приведенные в отзыве, связаны в основном с признаком, отсутствующим в данном независимом пункте, а именно «высвобождение в верхней части кишечного тракта».

Таким образом, независимый пункт 2 нельзя признать соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку он явным образом следует из уровня техники и основан на дополнении известного средства какой-либо известной частью (частями), присоединяемой (присоединяемыми) к нему по известным правилам, для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно таких дополнений (подпункт 3 пункт 19.5.3 Правил ИЗ).

В отношении независимого пункта 3 необходимо отметить, что наиболее близким аналогом (прототипом) изобретения, отраженного в пункте 3 формулы оспариваемого патента, в соответствии с пунктом 3.2.4.2 Правил ИЗ, также следует признать патентный документ Великобритании [4], где раскрыта фармацевтическая композиция, проявляющая противоопухолевую и иммуносупрессорную активность, в частности в форме таблеток, пилюль, капсул, содержащая микофенольную кислоту или ее фармацевтически приемлемую соль, а также фармацевтически приемлемые ингредиенты. Согласно единственному примеру описания прототипа, композиция содержит 250 частей микофеноловой кислоты, 30 частей фосфата кальция, 30 частей кукурузного крахмала и 12 частей стерата магния, и ее получали путем смешивания и гранулирования ингредиентов с последующим прессованием для получения таблеток для перорального введения в терапевтических целях.

Отличие изобретения по независимому пункту 3 формулы оспариваемого патента от прототипа заключается в том, что на лекарственное средство нанесено энтеросолюбильное покрытие, при этом средство предназначено для предупреждения или лечения отторжения трансплантата, являющегося аллотрансплантатом или ксенотрансплантатом нативного или трансгенного органа, ткани или клетки, а также для лечения или предупреждения опосредованных иммунной системой и/или воспалительных заболеваний, причем фармацевтическую композицию можно использовать в сочетании с другим иммунодепрессантом, при одновременном или отдельном его введении.

Технические результаты от использования композиции по независимому пункту 3 по оспариваемому патенту заключаются в следующем:

- соли микофеноловой кислоты с энтеросолубильным покрытием, являются эффективными, хорошо переносимыми лекарственными средствами, в частности, для показаний, связанных с иммунодепрессией, особенно для лечения или предупреждения отторжения аллотрансплантата или ксенотрансплантата органа, ткани или клетки, например, после трансплантации или для лечения или предупреждения заболеваний, обусловленных иммунной системой (аутоиммунные заболевания), и обладают представляющими интерес характеристиками биологической доступности и стабильности;

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

- композиции по оспариваемому изобретению переносятся лучше, чем микофеноловая кислота, вызывая менее выраженные побочные действия в отношении желудочно-кишечного тракта, в частности, такие как диарея и изжога.

Что касается технических результатов связанных с:

а) представляющим интерес характеристиками биологической доступности и стабильности;

б) введением меньших стандартных дозируемых форм, чем для микофеноловой кислоты;

в) лучшей переносимостью композиции по оспариваемому изобретению по сравнению с микофеноловой кислотой (вызывает менее выраженные побочные действия в отношении желудочно-кишечного тракта, в частности, такие как диарея и изжога), то подтверждение данных технических результатов отсутствует в описании оспариваемого патента применительно к данному независимому пункту. Источники информации [33]-[35], представленные патентообладателем для подтверждения данных результатов, опубликованы позже даты приоритета группы изобретений и не могут быть включены в уровень техники, с учетом положений пункта

22.3 Правил ИЗ и пункта 1 статьи 4 Закона, при оценке на соответствие условию патентоспособности «изобретательский уровень».

При этом из источника информации [30] известно нанесение энтеросолубильного покрытия на таблетку, содержащую лекарственное средство, для целей локализации, пролонгации действия лекарственного вещества, содержащегося в таблетке или защиты слизистых желудочно-кишечного тракта от действия лекарственного средства (с. 184, 188 источника [30]).

Следует согласиться с лицом подавшим возражение, что из патентных документов [1] и [2] следует возможность использования как самой микофеноловой кислоты, так и ее соли для предупреждения или лечения отторжения трансплантата, являющегося аллотрансплантатом или ксенотрансплантатом нативного или трансгенного органа, ткани или клетки, а также для лечения или предупреждения опосредованных иммунной системой и/или воспалительных заболеваний, причем фармацевтическую композицию можно использовать в сочетании с другим иммунодепрессантом, при одновременном или отдельном его введении ([1]: кол. 1-2, раздел "Summary of Invention"; кол. 5-7; [2]: кол. 5, строки 28-39, кол. 6, строки 45-62, кол. 46 строки 36-47)

Доводы патентообладателя в отношении данного объекта, приведенные в отзыве, связаны в основном с признаком, отсутствующим в данном независимом пункте, а именно «высвобождение в верхней части кишечного тракта».

Кроме того, доводы патентообладателя также подтверждают известность из уровня техники использования соли микофеноловой кислоты для предупреждения или лечения отторжения трансплантата, являющегося аллотрансплантатом или ксенотрансплантатом нативного или трансгенного органа, ткани или клетки, а также для лечения или

предупреждения опосредованных иммунной системой и/или воспалительных заболеваний (с. 14 отзыва)

Таким образом, независимый пункт 3 нельзя признать соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку он явным образом следует из уровня техники и основан на дополнении известного средства какой-либо известной частью (частями), присоединяемой (присоединяемыми) к нему по известным правилам, для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно таких дополнений (подпункт 3 пункт 19.5.3 Правил ИЗ).

В отношении независимого пункта 11 необходимо отметить следующее.

Независимый пункт 11 содержит указание на независимые пункты 1-3 и, следовательно, в пункте 11 формулы отражены альтернативные выполнения комбинации с учетом признаков, изложенных в независимых пунктах 1-3.

Наиболее близким аналогом (прототипом) изобретения по пункту 11 формулы оспариваемого патента, с учетом всех присутствующих в данном пункте альтернатив, в соответствии с пунктом 3.2.4.2 Правил ИЗ следует признать патентный документ США [1], где раскрыто использование фармацевтической композиции, содержащую как саму микофеноловую кислоту, так и ее соль, в составе комбинации для предупреждения или лечения отторжения трансплантата, являющегося аллотрансплантатом или ксенотрансплантатом нативного или трансгенного органа, ткани или клетки, а также для лечения или предупреждения опосредованных иммунной системой и/или воспалительных заболеваний, причем фармацевтическую композицию можно использовать в сочетании с другим иммунодепрессантом, при одновременном или отдельном его введении ([1], кол. 1-2, раздел "Summary of Invention"; кол. 5-7).

Отличие изобретения по независимому пункту 11 в части альтернативного выполнения с использованием признаков независимого пункта 1 от прототипа заключается в том, что на лекарственное средство нанесено энтеросолюбильное покрытие, обеспечивающего высвобождение указанной соли в верхней части кишечного тракта.

Отличие изобретения по независимому пункту 11 в части альтернативного выполнения с использованием признаков независимого пункта 2 от прототипа заключается в том, что на лекарственное средство нанесено энтеросолюбильное покрытие.

Отличие изобретения по независимому пункту 11 в части альтернативного выполнения с использованием признаков независимого пункта 3 от прототипа также заключается в том, что на лекарственное средство нанесено энтеросолюбильное покрытие.

С учетом вышеизложенных доводов в отношении независимых пунктов 2 и 3, изобретение по независимому пункту 11 в части альтернативных выполнений с использованием признаков независимых пунктов 2 и 3 также не будет соответствовать условию патентоспособности «изобретательский уровень» (подпункт 3 пункт 19.5.3 Правил ИЗ)

Изобретение по независимому пункту 11 в части альтернативного выполнения с использованием признаков независимого пункта 1, с учетом вышеизложенных доводов в отношении указанного пункта 1, будет соответствовать условию патентоспособности «изобретательский уровень» (подпункт 3 пункт 19.5.3 Правил ИЗ)

Таким образом, независимый пункт 11 нельзя признать соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку в части альтернативных выполнений с использованием признаков независимых пунктов 2 и 3 он явным образом следует из уровня техники и основан на дополнении известного средства какой-либо известной частью (частями), присоединяемой (присоединяемыми) к нему по известным

правилам, для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно таких дополнений (подпункт 3 пункт 19.5.3 Правил ИЗ).

Те же самые доводы в отношении условия патентоспособности «изобретательский уровень», что приведены для независимого пункта 11, относятся к независимому пункту 12.

Что касается мотива лица, подавшего возражение, относительно несоответствия независимого пункта 11 условию патентоспособности «промышленная применимость», то следует согласиться с мнением патентообладателя, представленного в отзыве, что описание оспариваемого патента содержит сведения, подтверждающие, что комбинация по независимому пункту 11 может быть использована в здравоохранении, а именно в качестве иммуносупрессанта, например, для лечения и предупреждения отторжения трансплантата. Заявленная комбинация содержит фармацевтически приемлемую соль микофеноловой кислоты с нанесенным энтеросолюбильным покрытием в сочетании с другим иммуносупрессантом, (см., например, с. 6, правая колонка оспариваемого патента) для одновременного, последовательного или отдельного введения, что подтверждает наличие в первичных материалах заявки средств и методов, с помощью которых возможно осуществление изобретения. Поскольку комбинация по пункту 11 в качестве активных ингредиентов содержит вещества, обладающие иммуносупрессорной активностью и это известно, в частности, из патентных документов [1] и [2], которые приводит само лицо, подавшее возражение, то в уровне техники представлены сведения, подтверждающие реализацию заявленного назначения.

Таким образом, изобретение по независимому пункту 11 соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» в соответствии с требованием пункта 1 статьи 4 Закона и подпункта 2 пункта 19.5.1 Правил ИЗ.

В связи с тем, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту, а также изобретения, охарактеризованные в независимых пунктах 11 и 12 в части альтернативных выполнений с использованием признаков независимого пункта 1, в рамках настоящего возражения были признаны патентоспособными, на основании пункта 4.9 Правил ППС, патентообладателю было предложено представить уточненную формулу изобретения.

Патентообладатель на заседании коллегии представил уточненную формулу изобретения в следующей редакции:

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

2. Композиция по пункту 1, в форме таблетки.

3. Композиция по п. 2, в которой ядро таблетки имеет твердость от 10 до 70 Н.

4. Композиция по п. 1, в форме пилюль или гранул.

5. Композиция по п. 4, в которой пилюли или гранулы помещены в капсулы.

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

7. Композиция по п. 6, в которой моонатриевая соль микофеноловой кислоты находится в кристаллической форме.

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

9. Комбинация, содержащая фармацевтическую композицию по п. 1 и другой иммунодепрессант для одновременного, последовательного или отдельного введения.

10. Способ подавления иммунитета у пациента, включающий введение терапевтически эффективного количества фармацевтической композиции по п. 1 пациенту, нуждающемуся в такой иммунодепрессии.

11. Способ по п. 10, в котором пациенту дополнительно одновременно или отдельно вводят другой иммунодепрессант.

12. Способ по п. 11, в котором другой иммунодепрессант представляет собой циклоспорин.

13. Способ по пп. 10-12, в котором фармацевтически приемлемая соль микофеноловой кислоты представляет собой моносодиевую соль.

14. Фармацевтическая композиция по п. 1 или комбинация по п. 9, в которой фармацевтически приемлемая соль микофеноловой кислоты представляет собой моносодиевую соль.

15. Фармацевтическая композиция по п. 1 или комбинация по п. 9, в которых присутствует другой иммунодепрессант, например, циклоспорин.

Данная формула уточнена патентообладателем путем исключения непатентоспособных независимых пунктов и альтернатив, связанных с признаками, отражающими нанесение на лекарственное средство по оспариваемому патенту энтеросолюбильного покрытия, что не требует проведения дополнительного информационного поиска.

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

удовлетворить возражение, поступившее 03.11.2015, патент Российской Федерации на изобретение № 2203659 признать недействительным частично и выдать новый патент с формулой, уточненной патентообладателем.

(21) 98120360/14

(51)МПК

A61K 31/343 (2000.01),

A61K 9/22 (2000.01),

A61K 9/48 (2000.01),

A61P 37/06 (2000.01),

A61P 35/00 (2000.01),

A61P 31/12 (2000.01)

(57)

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

2. Композиция по пункту 1, в форме таблетки.

3. Композиция по п. 2, в которой ядро таблетки имеет твердость от 10 до 70 Н.

4. Композиция по п. 1, в форме пилюль или гранул.

5. Композиция по п. 4, в которой пилюли или гранулы помещены в капсулы.

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

7. Композиция по п. 6, в которой моонатриевая соль микофеноловой кислоты находится в кристаллической форме.

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

9. Комбинация, содержащая фармацевтическую композицию по п. 1 и другой иммунодепрессант для одновременного, последовательного или отдельного введения.

10. Способ подавления иммунитета у пациента, включающий введение терапевтически эффективного количества фармацевтической композиции по п. 1 пациенту, нуждающемуся в такой иммунодепрессии.

11. Способ по п. 10, в котором пациенту дополнительно одновременно или отдельно вводят другой иммунодепрессант.

12. Способ по п. 11, в котором другой иммунодепрессант представляет собой циклоспорин.

13. Способ по пп. 10-12, в котором фармацевтически приемлемая соль микофеноловой кислоты представляет собой моонатриевую соль.

14. Фармацевтическая композиция по п. 1 или комбинация по п. 9, в которой фармацевтически приемлемая соль микофеноловой кислоты представляет собой моонатриевую соль.

15. Фармацевтическая композиция по п. 1 или комбинация по п. 9, в которых присутствует другой иммунодепрессант, например, циклоспорин.

(56)

US5190753, 02.03.1993.

US5428040, 27.06.1995.

GB1157099, 02.07.1969.

GB1157100, 02.07.1969.

GB 1158387, 16.07.1969.

WO9514023, 26.05.1995.

КОНДРАТЬЕВ Т.С. и др., Технология лекарственных форм. Том 2,
"Медицина", Москва 1991, с. 184-187

При публикации сведений будет использовано описание в редакции
заявителя.