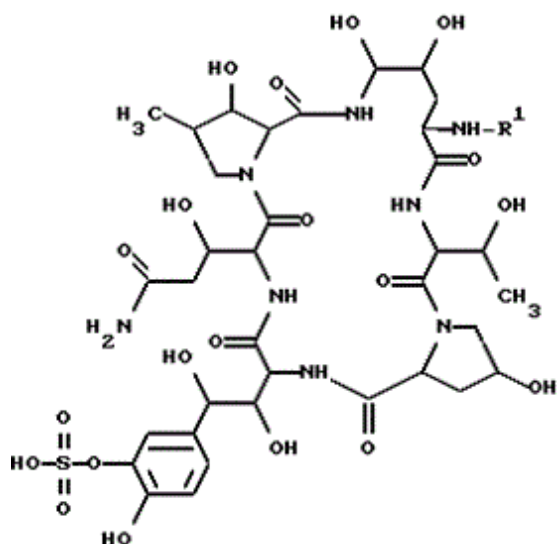


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам
рассмотрения возражения заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01.01.2008 Федеральным законом от 18.12.2006 № 231-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации» (далее – Кодекс), и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2165423, поступившее 04.02.2018 от Общества с ограниченной ответственностью "АксельФарм" (далее – лицо, подавшее возражение), при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2165423 на группу изобретений «Полипептидное соединение, способ его получения и фармацевтическая композиция» был выдан по заявке №97107338/04 с приоритетом от 07.10.1994 на имя Фудзисава Фармасьютикал Ко., ЛТД. (Япония). Согласно внесенным изменениям, опубликованным 20.04.2006 в Бюллетене Изобретений №11, 2006 патентообладателем является Астеллас Фарма Инк., (Япония), (далее – патентообладатель). Патент действует со следующей формулой:

«1. Полипептидное соединение, имеющее следующую общую формулу I



где R¹ обозначает низший алканоил, замещенный пиридиллом или пиридазинилом, каждый из которых может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкокси, высший алкокси(низший)алкил; фенил, имеющий высший алкокси; фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; пиперазинил, замещенный фенилом, имеющим высший алкокси; пиперазинил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси(высший)алкокси; и пиперазинил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; низший алканоил, замещенный 1,2,3,4-тетрагидроизохинолином, имеющим высший алкокси и низший алкоксикарбонил; низший алканоил, замещенный кумарином, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкокси и оксогруппу; низший алканоил, замещенный бензотиофенилом, который может иметь 1-3 высших алкокси; низший алканоил, замещенный бензо[b]фуранилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкокси и низший алкил; низший алканоил, замещенный бензооксазолилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкил; фенил, имеющий низший алкокси; фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил; и пиридил, имеющий высший алкокси; низший алканоил, замещенный бензимидазолилом, который может иметь 1-3 заместителя,

выбранных из группы, включающей высший алкил и фенил, имеющий низший алкокси; низший алканоил, замещенный пиперидилом или пиперазином, каждый из которых может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей фенил, имеющий высший алкокси, и нафтоил, имеющий высший алкокси; фенил(низший)алканоил, замещенный фенилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей низший алкокси, низший алкил, высший алкил, низший алкокси(высший)алкил, галоген(низший)алкокси, низший алкенилокси, галоген(высший)алкокси, и низший алкокси(высший)алкокси; нафтил(низший)алканоил, который может иметь 1-3 высших алкокси; низший алкиноил, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей нафтил, имеющий высший алкокси, и фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил; фенил(C₂-C₆)алканоил, замещенный фенилом, который имеет 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей низший алкокси, высший алкокси, низший алкил, высший алкил и фенил, имеющий низший алкокси(низший)алкил; где указанный фенил(C₂-C₆)алканоил может иметь гидроксо-, оксо-, защищенную амино-, или аминогруппу; (C₂-C₆)алканоил, замещенный нафтилом, имеющим высший алкокси; фенилокси(низший)алканоил, который может иметь 1-3 высших алкокси; фенил(низший)алкокси(низший)алканоил, который может иметь 1-3 высших алкокси; фениламино(низший)алканоил, который может иметь 1-3 высших алкокси; бензоил, замещенный пиперазином, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей фенил, имеющий низший алкокси; фенил, имеющий высший алкокси; фенил, имеющий низший алкил; фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси; фенил, имеющий высший алкенилокси; пиперидил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; цикло(низший)алкил, имеющий фенил; фенил, имеющий цикло(низший)алкил; и фенил, замещенный триазилом, имеющим оксо и

низший алкил; где указанный бензоил может иметь галоген; бензоил, замещенный изоксазолилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей высший алкил; фенил, имеющий низший алкокси; фенил, имеющий высший алкокси; фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси; и фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси(высший)алкокси; бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил; бензоил, замещенный фенилом, имеющим высший алкил; фенил(низший)алкеноил, замещенный фенилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей низший алкокси, низший алкил, высший алкил; низший алкокси(низший)алкил, галоген(низший)алкокси, низший алкенилокси, галоген(высший)алкокси и низший алкокси(высший)алкокси; бензоил, замещенный триадиазолилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей фенил, имеющий низший алкокси; фенил, имеющий высший алкокси; цикло(низший)алкил, имеющий низший алкил; фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси; фенил, имеющий цикло(низший)алкил; фенил, имеющий пиперидил; и фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси; или бензоил, замещенный оксадиазолилом, который может иметь 1-3 заместителя, выбранных из группы, включающей фенил, имеющий низший алкокси; фенил, имеющий высший алкокси; фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси; высший алкил и фенил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси, или его фармацевтически приемлемая соль.

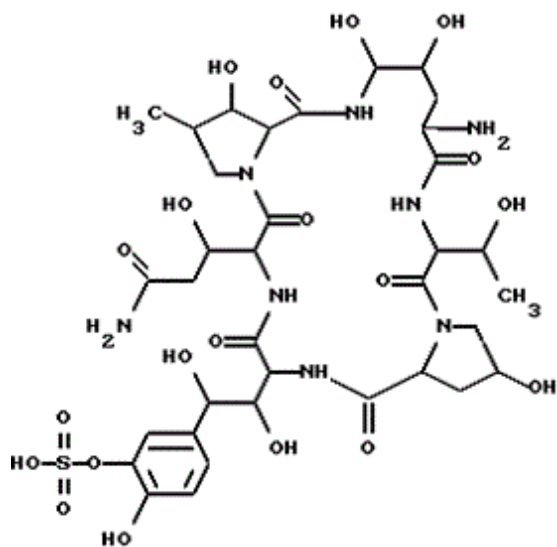
2. Соединение по п.1, где R^1 обозначает бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси(высший)алкокси, или бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил.

3. Соединение по п.1, где R^1 обозначает бензоил, замещенный пиперазином, который может иметь фенил, имеющий низший алкокси; бензоил, замещенный изоксазолилом, который может иметь фенил,

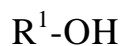
имеющий низший алкокси; бензоил, замещенный триазаолилом, который может иметь фенил, имеющий низший алкокси(высший)алкокси, или бензоил, замещенный оксадиазолилом, который может иметь фенил, имеющий низший алкокси.

4. Соединение по п.1, где R^1 обозначает фенил(низший)алкеноил, замещенный фенилом, который может иметь низший алкокси.

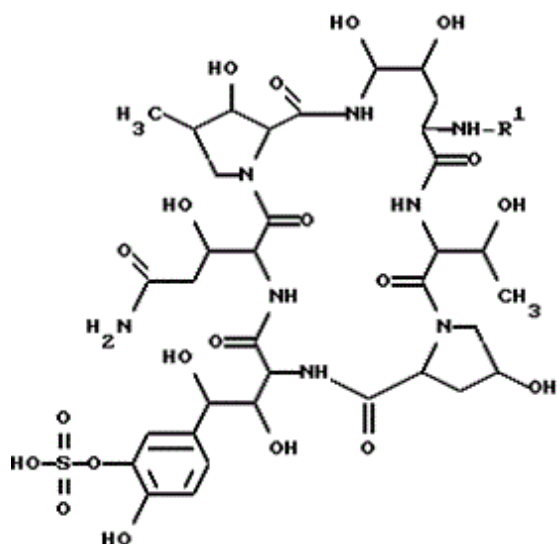
5. Способ получения полипептидного соединения формулы I по п.1, заключающийся в том, что соединение формулы II



или его производное, реакционноспособное по аминогруппе, или его соль подвергают взаимодействию с соединением формулы III



где R^1 определен в п.1, или с его производным, реакционноспособным по карбоксигруппе, или с его солью, в результате чего получают соединение формулы I



где R^1 определен, как указано в п.1,
или его соль.

6. Фармацевтическая композиция, проявляющая противогрибковую активность, отличающаяся тем, что в качестве активного ингредиента она содержит терапевтически эффективное количество соединения по п.1 или его фармацевтически приемлемой соли в смеси с фармацевтически приемлемыми носителями или наполнителями.

7. Соединения по п.1, обладающие противогрибковой активностью.

8. Соединение по п.1 или его фармацевтически приемлемая соль, пригодные для применения в качестве лекарственного средства».

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса поступило возражение, мотивированное несоответствием документов заявки на изобретение по оспариваемому патенту, представленным на дату ее подачи, требованию раскрытия сущности изобретения с полнотой, достаточной для осуществления изобретения специалистом в данной области техники, несоответствием независимого пункта 1 формулы изобретения оспариваемого патента условию патентоспособности «новизна» и несоответствием группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень».

К возражению приложены копии следующих материалов:

- патентный документ СА № 2091663, дата публикации 20.09.1993
(далее - [1]);
- патентный документ JP № 05202096, дата публикации 10.08.1993
(далее - [2]);
- патентный документ EP № 048011, дата публикации 20.05.1992
(далее - [3]);
- патентный документ EP № 0431350, дата публикации 12.06.1991
(далее - [4]);
- патентный документ JP № 06192292, дата публикации 12.07.1994
(далее - [5]);
- патентный документ EP № 0462531, дата публикации 27.12.1991
(далее - [6]);
- патентный документ СА № 2123921, дата публикации 18.11.1994
(далее - [7]);
- статья M. Debono et al., «Synthesis of new analogs of echinocandin B by enzymatic deacylation and chemical reacylation of the echinocandin B peptide: Synthesis of the antifungal agent cilofungin (LY121019)», The Journal of Antibiotics (1989), vol. XLII №(3), 389-397 (далее - [8]);
- статья K. S. R. Krishna Mohan Rao et al., «Search for physiologically active compounds. XIV. Synthesis of some 3,5-disubstituted isoxazoles and their physiological activity», Indian Journal of Chemistry (1968), 6(2), 66-68
(далее - [9]);
- патентный документ GB № 2265371, дата публикации 06.11.1994
(далее - [10]);
- статья A. Krishna Murthy et al., «Synthesis and physiological activity of 3-hydroxyphenyl-5-arylisoxazoles», Journal of the Indian Chemical Society (1973), 50(3), 213-14 (далее - [11]);
- статья Hassan A.A. Regaila, Synthesis of newer N-acetyl-, N-arylpyrazoline, -isoxazole, and -benzodioxane derivatives of biological activity,

(далее - [12]).

В отношении несоответствия изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности “новизна”, в возражении отмечено следующее.

По мнению лица, подавшего возражение, из патентного документа [3] известна фармацевтическая композиция для лечения болезней, вызванных организмом *Pneumocystis carinii*, которая в качестве активной субстанции включает в себя гексапептидное соединение общей формулы (см. структуру в пункте 1 формулы в [3]). При этом, в случае, когда радикал $R_2 = OH$, $R_3 =$ гидроксисульфоноксигруппа, $R_4 =$ карбамоил, R_5 и $R_6 = OH$, а R_1 представляет собой ацильную группу, известная субстанция охватывает все соединения формулы оспариваемого патента. Так, по мнению лица, подавшего возражение, ацильная группа имеет очень широкое значение, которое требует дополнительной трактовки.

Вместе с тем, в возражении отмечено, что в патентном документе [3] (с. 12-14) раскрыт огромный перечень радикалов, подпадающих под определение подходящей ацильной группы. Среди указанных значений ацильной группы упомянут ароил [т.е. бензоил, нафтоил, антрилкарбонил и т.д.], который может иметь один или несколько (предпочтительно от 1 до 5) подходящих заместителей, таких как галоген; низший алкил (например, метил, этил, пропил, бутил, трет-бутил, пентил, гексил и т.д.). вышеуказанный алкил низший алкокси (например, метокси, этокси, пропокси, бутокси, трет-бутокси, пентилокси, гексилокси и т.д.), которые могут иметь один или несколько (предпочтительно от 1 до 10) подходящих заместителей, таких как указанные выше низший алкокси, вышеуказанный галоген, вышеуказанный арил или им подобные группы; высший алкокси (например, гептилокси, октилокси, 2-этилгексилокси, нонилокси, децилокси, 3,7-диметилоктилокси, ундецилокси, тридецилокси, тетрадецилокси, пентадецилокси, 3-метил-10-этилд о децилокси, гексадецилокси, октадецилокси, нонадецилокси, икозилокси и т.д.),

которые могут иметь один или несколько (предпочтительно от 1 до 17) подходящих заместителей, таких как вышеуказанный галоген, высший алкенилокси (например, 3-гептенилокси, 7-октенилокси, 2,6-октадиенилокси, 5-ноненилокси, 1-деценилокси, 3,7-диметил-6-октенилокси, 3,7-диметил-2,6-октадиенилокси, 8-ундеценилокси, 3,6,8-додекатриенилокси, 5-тридеценилокси, 7-тетрадеценилокси, 1,8-пентадекадиенилокси, 15-гексадеценилокси, гептадеценилокси, 7-октадеценилокси, 10-нонадеценилокси, 18-икозенилокси и т.д.); карбоксы; вышеуказанная арильная группа, которая может иметь один или несколько (предпочтительно, от 1 до 3) подходящих заместителей, таких как высший алкокси; арилокси (например, фенокси, нафтилокси, антрилокси и т.д.), который может иметь один или несколько (предпочтительно, от 1 до 3) подходящих заместителей, таких как указанные выше низший алкокси или вышеуказанный высший алкокси; или им подобные группы.

Также в возражении отмечено, что в патентном документе [3] в определении ацильной группы указано, что ей может быть «арильная группа, которая может иметь один или несколько групп (предпочтительно от 1 до 5), выбранных из галогена, низшего алкила, высшего алкила, карбоксы, низшей алкокси, у которой может быть один или несколько (предпочтительно от 1 до 10) атомов галогена, низшей алкокси(низшей)алкокси группы, арил(низшей)алкокси группы, высшей алкокси группы, у которой может быть один или несколько (предпочтительно от 1 до 7) атомов галогена, высшей алкенилокси-группы, арильной группы, у которой может быть один или несколько (предпочтительно от 1 до 3), выбранных из высшей алкокси- или арилокси-группы, у которой может иметься один или несколько (предпочтительно от 1 до 3) заместителей, выбранных из низшей алкокси или высшей алкокси-группы».

В возражении сделан вывод о том, что под это определение подпадает, по меньшей мере, соединение 22 из оспариваемого патента, которое раскрыто в зависимом пункте 2 формулы оспариваемого патента и охватывается

соответствующей формулировкой в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента.

В отношении несоответствия изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности “изобретательский уровень”, в возражении отмечено следующее.

По мнению лица, подавшего возражение, изобретение по оспариваемому патенту относится к производным эхинокандинов - противогрибковых препаратов, препятствующих синтезу глюканов в клеточной стенке через неконкурентное ингибирование фермента 1,3-Р-глюкан-синтазы. Первый представитель этого класса соединений, эхинокандин В, его аналог цилофунгин, известен из статьи [8].

В возражении отмечено, что водорастворимыми производными противогрибковых препаратов на основе циклических гексапептидов типа эхинокандина с минимальной ингибирующей концентрацией (МИК) в отношении грибов *Candida albicans* являются гидроксисульфонилокси НОSO₂O- и дигидроксифосфорилокси (НО)₂P(O)O-замещенные аналоги раскрытые в общем виде и конкретным образом в патентных документах [1]-[7].

Так, по мнению лица, подавшего возражение, соединения, известные из патентного документа [1] пункты 1 и 10 формулы), когда R' = NH₂C(O)NH₂, R'' и R''' = метил, R = OH, R^y = OH, R₇ = OH, R₁ = гидроксисульфонилокси. имеют значительное сходство с соединениями по оспариваемому патенту. Основные различия, по мнению лица, подавшего возражение, касаются значений радикала R₂.

При этом, в возражении отмечено, что в патентном документе [1] раскрыты конкретные соединения, у которых МИК в отношении грибов *Candida albicans* ниже самого минимального значения для соединений по

оспариваемому патенту (см. таблицу 2 (МИК = 0,05 мкг/мл для соединения из примера 25, 22, 35 и 89).

Вместе с тем, по мнению лица, подавшего возражение, конкретные соединения, известные из патентного документа [1] отличаются отсутствием гидроксисульфонилокси группы в фенильном кольце (Таблицы 4 A-D из документа R1 = H вместо HSO₃O-), в сравнении с соединениями по оспариваемому патенту, но в их структуре содержится основной определяющий их активность фрагмент - это гексапептидное ядро и боковая ацильная группа.

Из патентного документа [2] (с.8, таблица 1) также известны соединения, которые имеют идентичное, полипептидное ядро с соединениями по оспариваемому патенту.

По мнению лица, подавшего возражение, различия заключаются только в природе боковой ацильной группы.

При этом, в возражении отмечено, что значение МИК для соединения с кодовым обозначением FP579 (строение радикала соединения показано на с. 13 в таблица 7 [2]) в отношении грибков *Candida albicans* имеет МИК = 0,1 мкг/мл, что примерно сопоставимо или лучше значений МИК для схожих соединений из Таблиц 1 и 2 в описании к оспариваемому патенту.

В соответствии с изложенным в возражении сделан вывод о том, что соединения 24 и 103 по оспариваемому патенту в отношении возможности их получения и проявляемых ими свойств очевидны для специалиста в данной области техники.

Так, в возражении отмечено, что согласно формулировке “R1 обозначает бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкокси(высший)алкокси” очевидно, что алкокси-группа может включать также алкокси-группу, замещенную алкокси и вполне очевидна замена атома

водорода в гидроксидной (высшей) алкокси-группе на алкил с получением высшей алкокси(высшей)алкокси группы.

При этом значения МИК соединений 24 и 103 составляет 0,1 и 0,2 мкг/мл, что по мнению лица, подавшего возражение, не вносит какого-то количественного улучшения в сравнении со значениями МИК для ранее известных аналогичных соединений.

В отношении водорастворимых производных эхинокандинов, известных из патентного документа [4], в возражении отмечено, что для их общей структурной формулы раскрыты и такие значения радикалов как “R1 представляет собой водород или гидроксид, R2 представляет собой водород или гидроксид, R3 представляет собой гидроксисульфонилокси, при условии что, когда R1 представляет собой водород, R2 является водородом”.

Также в возражении отмечено, что схожие с соединениями по оспариваемому патенту гидроксисульфонилокси замещенные производные эхинокандинов, растворимые в воде раскрыты в формулах изобретения патентных документов [5]-[7], для которых представлены исследования по измерению МИК в отношении грибков *Candida albicans*.

При этом отмечено, что конкретные соединения, известные из патентных документов [5]-[7], подпадают под общую формулу патентного документа [3].

В возражении отдельно представлены доводы в отношении очевидности для специалиста в данной области техники возможности получения соединения 25 по оспариваемому патенту и того факта, что данное соединение будет проявлять противогрибковые свойства.

Так, в возражении отмечено, что такая очевидность для специалиста основана на сведениях, известных из источников информации [1]-[8], которые раскрывают соединения с гексапептидным ядром и боковой алкильной цепью,

и с учетом сведений, раскрытых в источниках информации [9]-[12], которые показывают наличие противогрибковой активности у 3,5-диарилизоксазольных соединений.

В частности, по мнению лица, подавшего возражение, в статье [9] (реферат), раскрыто, что были синтезированы 3,5-дизамещенные изоксазолы, где среди заместителей присутствует метоксифенил, фенил или этоксифенил, при этом известные соединения были исследованы на предмет противогрибковой активности.

По мнению лица, подавшего возражение, в патентном документе [10] раскрыт способ борьбы с грибами на месте с помощью соединения общей формулы I или его соли, в которой X представляет собой необязательно замещенный алкил, алкенил, циклоалкил, гетероарил или арильную группу, не включая гидроксифенильную группу, R представляет собой атом водорода или галогена или алкил, галогалкил, гидроксильную, нитро-, циано или алкоксигруппу и Q представляет собой необязательно замещенную арильную или гетероарильную группу.

При этом в возражении отмечено, что в соединении 25 по оспариваемому патенту присутствует фрагмент в котором X = фенил, R = H, Q = замещенная арильная группа (в рассматриваемом случае она замещена C(O)NH-гексапептид), а в пункте 2 формулы оспариваемого патента раскрыто, что X представляет собой фенильную группу, необязательно замещенную группой с общей формулой -OCH₂R₁, в которой R₁, помимо прочего, представляет собой алкильную группу.

Анализируя структуру и активность соединения 25 по оспариваемому патенту в возражении делается вывод о том, что соединения 46 и 89 не охватываемые формулой по оспариваемому патенту, но подпадающие под структурные формулы известных соединений могут быть модифицированы, например, путем замены фенильной группы в соединении 46 на

изоксазолилную без улучшения противогрибковой активности, что очевидно при сравнении МИК соединений 25 и 89 (см. таблицу 2 в описании к оспариваемому патенту)

В отношении достижения технического результата изобретением по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента в возражении отмечено, что задача изобретения состоит только в расширении арсенала технических средств и очевидность для специалиста в данной области техники возможности реализации соединениями из оспариваемого патента указанного в описании назначения, будет свидетельствовать об отсутствии неожиданного технического результата, и как следствие, несоответствии изобретения по независимому пункту 1 формулы условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Что касается несоответствия документов заявки на изобретение по оспариваемому патенту, представленных на дату ее подачи, требованию раскрытия сущности изобретения с полнотой, достаточной для осуществления изобретения специалистом в данной области техники, то в возражении представлены доводы только в отношении соединения 25.

В частности отмечено, что соединение 25 не было достаточно полно охарактеризовано в материалах заявки. Так, по мнению лица, подавшего возражение, представленный масс-спектр показывает только массу молекулярного иона + масса натрия. Метод масс-спектрометрии, который бы показывал осколочные ионы не был использован. ИК спектр также по мнению лица. Подавшего возражение, не информативен, т.к. нет отнесения полос к конкретным группам. Не содержит описание пояснений по ЯМР спектру с отнесением сигналов к конкретным группам, например, пояснения сигналов изоксазолилной группы, фенильных групп гексапептидного ядра и бокового заместителя.

В отношении соответствия условиям патентоспособности способа получения по независимому пункту 5 формулы оспариваемого патента, фармацевтической композиции по независимому пункту 6 формулы и в отношении зависимых пунктов 3-4, 7-8 формулы какие-либо доводы в возражении не представлены.

Второй экземпляр возражения в установленном порядке был направлен в адрес патентообладателя, отзыв от которого поступил в корреспонденции от 30.09.2020.

В отношении соответствия изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности "новизна" в отзыве отмечено следующее.

Патентообладатель не согласен с мнением лица, подавшего возражение в том, что патентный документ [1] раскрывает соединение по примеру 22, входящее в объем признаков по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента, в отношении которого в возражении приведены доводы о несоответствии его условию патентоспособности "новизна".

Так, в отзыве отмечено, что соединение 22 имеет определенную структуру ацильного радикала R1. Упомянутый радикал, по мнению патентообладателя, однозначно раскрыт в зависимом пункте 2. Так ацильный радикал в соединении 22 охватывается признаком "бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил". Между тем, определение, приведенное в патентном документе [3] и цитируемое в Возражении, включает признак "ароильная группа (которая включает бензоил [примечание патентообладателя]), которая может иметь одну или несколько (предпочтительно от 1 до 5) групп, выбранных из арильной группы, у которой может быть один или несколько (предпочтительно от 1 до 3), выбранных из высшей алкокси- или арилоксигруппы".

При этом низшая алкильная группа, служащая заместителем в фенильном кольце соединения 22 по оспариваемому патенту, отлична от

высшей алкокси- или арилокси группы, как это определено в патентном документе, как это определено в патентном документе [3].

Таким образом, в отзыве сделан вывод о том, что сведения, известные из патентного документа [3] не раскрывают все признаки полипептидного соединения, заявленного в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента.

В отношении соответствия изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности “изобретательский уровень” в отзыве отмечено следующее.

Между соединениями, раскрытыми в патентном документе [1] и соединениями общей формулы I, приведенной в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента, имеются существенные различия не только в химической структуре ацильного радикала, но и в химической структуре циклического гексапептидного ядра. Химические соединения, указанные в описании к патентному документу [1], отличаются отсутствием гидроксисульфонилокси группы в фенильном кольце.

Вместе с тем, по мнению патентообладателя, структурные различия между описанными в патентном документе [1] конкретными соединениями, в отношении радикала R2, и соединениями формулы I по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента очень велики.

Кроме того, в отзыве отмечено, что в патентном документе [1] отсутствуют какие-либо сведения, которые могли бы натолкнуть специалиста в данной области техники на мысль, что посредством замены ацильных радикалов, описанных в патентном документе [1], на ацильные радикалы, раскрытые в оспариваемом патенте, могут быть получены новые соединения, которые также будут обладать противогрибковой активностью и высокой эффективностью в качестве противогрибковых средств.

В отзыве сделан вывод о том, соединения по оспариваемому патенту не следуют явным образом из сведений, раскрытых в патентном документе [1].

В отношении сведений, раскрытых в патентном документе [2] в отзыве отмечено следующее.

Структурные различия между описанными в патентном документе [2] соединениями, несущими указанные в упомянутом документе ацильные радикалы, и соединениями формулы I по независимому пункту 1 формулы изобретения оспариваемого патента также очень велики.

В частности отмечено, что в формуле изобретения отсутствует признак "R1 обозначает бензоил, замещенный фенилом, имеющим (низший)алкокси(низший)алкокси(высший)алкокси", который отмечен в возражении и мог бы охватывать значение ацильного радикала в соединении по примеру 103. Таким образом, соединение по примеру 103 не входит в объем формулы оспариваемого патента.

При этом отмечено, что довод лица, подавшего возражение, о том, что "вполне очевидна замена атома водорода в гидроксидной(высшей)алкокси-группе на алкил с получением высшей алкокси(высшей)алкокси группы" ничем не обоснован.

Кроме того, по мнению патентообладателя, упомянутый довод о том, что замена атома водорода в гидроксильной группе на алкильный радикал, результатом которой является образование простой эфирной группировки, не должна сказываться каким-либо образом на активности соединения, несущего такую замену, также лишено каких бы то ни было оснований.

В отзыве сделан вывод о том, соединения по оспариваемому патенту не следуют явным образом из сведений, раскрытых в патентном документе [2].

В отношении сведений, раскрытых в патентном документе [2] в отзыве отмечено следующее.

Патентообладатель обращает внимание на то, что в патентном документе [4] отсутствуют какие-либо сведения, которые могли бы натолкнуть специалиста в данной области техники на мысль о том, что посредством замены известного из патентного документа [4] пальмитоильного радикала на ацильные радикалы, раскрытые в формуле оспариваемого

патента, могут быть получены новые соединения, которые также будут обладать противогрибковой активностью, а также высокой эффективностью в качестве противогрибковых средств.

При этом патентообладатель в отзыве подчеркивает, что описание к оспариваемому патенту содержит экспериментальные данные относительно биологической активности широкого спектра соединений (31 соединение), в которых ацильный радикал R1 варьируется по своей структуре в широких пределах и характеризуется наличием заместителей, различных по своей химической природе. При всем разнообразии структуры ацильных радикалов все исследованные соединения по оспариваемому патенту характеризуются значением MIC в узком диапазоне от 0,05 до 0,39 мкг/мл.

В отношении сведений, раскрытых в патентном документе [5] в отзыве отмечено следующее.

Патентный документ [5] раскрывает, что (см. параграф [0024]) предпочтительными примерами "ацильной группы" являются "ароильная группа, которая может иметь один или более (предпочтительно от 1 до 5) высших алкокси, и, среди них, более предпочтительными примерами являются от 1 до 3. Бензоильная группа, необязательно имеющая (C7-C16)алкокси, нафтоильная группа, имеющая 1-3 (C7-C16)алкокси, и наиболее предпочтительным примером является 4-п-октилоксибензоил, 6-н-гептилокси-2-нафтоил и 6-н-октилокси-2-нафтоил.

По мнению патентообладателя, описание к патентному документу [5] (см. параграфы [0057]-[0071]) не раскрывает никаких иных соединений, полипептидное ядро которых идентично полипептидному ядру соединений по оспариваемому патенту, кроме соединений, содержащих октилоксинафтоил (Примеры 5, 3 (минорный компонент), 10, 12, 14) или октилоксибензоил (Примеры 1, 4, 5, 6, 7, 8, 11, 16, 19, 20) в качестве ацильного радикала R3.

Таким образом, в отзыве сделан вывод о том, что в патентном документе [5] раскрываются соединения, содержащие полипептидное ядро, идентичное полипептидному ядру соединений по оспариваемому патенту, в

котором радикал, представляющий собой ацильную группу, является ароильной группой, которая может иметь один или более (предпочтительно от 1 до 5) высших (C7-C16)алкокси.

Таким образом, по мнению патентообладателя, структурные различия между описанными в патентном документе [5] соединениями, несущими раскрытые в указанном документе ацильные радикалы, и соединениями формулы I по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента очень велики.

В отношении сведений, раскрытых в патентных документах [6] и [7] в отзыве отмечено следующее.

Патентообладатель акцентирует внимание на том, что между перечнем возможных значений ацильного радикала, приведенным в описании и в формуле изобретения патентных документов [6] и [7], и перечнем значений ацильного радикала R1, приведенным в независимом пункте 1 формулы изобретения оспариваемого патента, отсутствует какое-либо пересечение.

В отношении сведений, раскрытых в статье [9] в отзыве отмечено, что в данной статье даже не упоминается, что механизм фунгистатического действия 3,5-диарильных производных изоксазола может быть связан с ингибированием фермента β -1,3-глюкансинтазы. Напротив, как отмечает патентообладатель, в статье [9] (с. 66, левый столбец, абзац 1) сообщается о том, что известно, что изоксазольные производные обладают антибактериальной, противотуберкулезной и противовирусной активностью, являются ингибиторами моноаминоксидазы и находят применение в психотерапии.

В отзыве отмечено, что в патентном документе [10] описаны тесты, проводившиеся с целью изучения фунгицидной активности полученных соединений. Указанные тесты проводились исключительно в отношении фитопатогенных грибов: возбудителя ложной мучнистой росы винограда (*Plasmopara viticola*) (a, b); возбудителя серой гнили винограда (*Botrytis cinerea*) (c); возбудителя пятнистости листьев пшеницы (*Leptosphaeria*

nodorum) (d); возбудителя настоящей мучнистой росы ячменя (*Erysiphe graminis* f. sp. *hordei*) (e); возбудителя бурой ржавчины пшеницы (*Puccinia recondite*) (f); возбудителя пирикуляриоза риса (*Pyricularia oryzae*) (g); возбудителя альтернариоза томатов (*Alternaria solani*) (h); возбудителя глазковой пятнистости пшеницы (*Pseudocercospora herpotrichoides*) (i); возбудителя фузариоза (*Fusarium species*) (j). Для разных соединений фунгицидная активность в отношении различных фитопатогенных грибов варьировала в широких пределах: от менее чем 50% контроля заболевания (что не исключает возможность полного отсутствия фунгицидной активности) до (с. 42-44, таблица 5) более чем 80% контроля заболевания. При этом, как отмечено в отзыве, нигде в патентном документе [10] даже не упоминается, что механизм фунгицидного действия 3,5-диарильных производных изоксазола может быть связан с ингибированием фермента β -1,3-глюкансинтазы.

В отзыве отмечено, что в статье [11] описано получение и свойства ряда 3,5-диарилзамещенных изоксазолов. Фунгистатическую активность полученных соединений измеряли в отношении *Aspergillus niger* в качестве тест-микроорганизма

Патентообладателю представляется необоснованным экстраполировать возможность оказания наблюдаемого фунгистатического действия на все возможные возбудители грибковых заболеваний, в том числе возбудители грибковых заболеваний человека и животных, в частности, на *Pneumocystis carinii*. Аналогичный вывод сделан патентообладателем в отношении сведений, раскрытых в статье [12].

При этом патентообладателем акцентируется внимание на том, что (низший)алкилокси-изоксазолил-фенильный фрагмент, входящий в состав соединения по примеру 25 оспариваемого патента, является частью ацильного радикала. Между тем ни одно из 3,5-диарильных производных изоксазола, раскрытых в статье [9] (10 соединений, Таблица 3), патентном документе [10] (43 соединения, Таблица 5), статье [11] (16 соединений, Таблица 1), статье [12]

(3 соединения), не содержит карбоксильной группы в качестве заместителя одного из арильных колец.

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

С учетом даты подачи заявки (29.09.1995), по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности группы изобретений по данному патенту включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 № 3517-1 (далее – Закон) и Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные Роспатентом 20 сентября 1993 года, зарегистрированные в Минюсте РФ 05 ноября 1993 года, рег. № 386, (далее – Правила).

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

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

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

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

В соответствии с подпунктом (3) пункта 3.2.4.5 Правил если изобретение относится к группе (ряду) новых индивидуальных химических соединений с установленной структурой, описываемых общей структурной формулой, подтверждается возможность получения всех соединений группы (ряда) путем приведения общей схемы способа получения, а также примера получения конкретного соединения группы (ряда), а если группа (ряд) включает соединения с разными по химической природе радикалами - примеров, достаточных для подтверждения возможности получения соединений с этими разными радикалами.

Для полученных соединений приводятся также их структурные

формулы, подтвержденные известными методами, физико-химические константы, доказательства возможности реализации указанного назначения с подтверждением такой возможности в отношении некоторых соединений с разными по химической природе радикалами.

Если новые соединения являются биологически активными, приводятся показатели активности и токсичности для этих соединений, а в случае необходимости - избирательности действия и другие показатели.

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

В соответствии с подпунктом (2) пункта 3.3.1. Правил формула изобретения должна быть полностью основана на описании, т.е. характеризовать изобретение понятиями, содержащимися в его описании.

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

В соответствии с подпунктом (5) пункта 19.5.2 Правил если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, содержащей зависимые пункты, соответствует условию новизны, то анализ уровня техники в отношении зависимых пунктов не проводится.

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

Проверка изобретательского уровня проводится в отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте формулы, и включает:

- определение наиболее близкого аналога в соответствии с пунктом 3.2.4.2 настоящих Правил;

- выявление признаков, которыми отличается заявленное изобретение от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);

- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения.

В соответствии с пунктом 3.2.4.2 Правил в качестве аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений, ставших общедоступными до даты приоритета изобретения, характеризующее совокупностью признаков, сходной с совокупностью существенных признаков изобретения. При описании группы изобретений сведения об аналогах приводятся для каждого изобретения в отдельности.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.3 Правил изобретение признается соответствующим условию изобретательского уровня, если не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

В соответствии с подпунктом (4) пункта 19.5.3 Правил условию изобретательского уровня соответствуют, в частности:

- способы получения новых индивидуальных соединений (класса, группы) с установленной структурой;

- индивидуальное соединение, подпадающее под общую структурную формулу группы известных соединений, но не описанное как специально полученное и исследованное, и при этом проявляющее новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении (селективное изобретение).

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

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

В отношении доводов возражения, касающихся несоответствия документов заявки на изобретение по оспариваемому патенту, представленных на дату ее подачи, требованию раскрытия сущности изобретения с полнотой, достаточной для осуществления изобретения специалистом в данной области техники необходимо отметить, что согласно вышеуказанной правовой базе, оценка такого соответствия и, соответственно, анализ упомянутого довода не предусмотрены.

Анализ доводов возражения и отзыва патентообладателя, касающихся соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень» показал следующее.

Изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента относится к группе индивидуальных химических соединений, а именно к полипептидным соединениям с установленной структурой, описываемым общей структурной формулой I. В общей структурной формуле все заместители, кроме радикала R1 имеют конкретные значения, которые непосредственно отражены в самой структурной формуле. Заместитель R1 присоединен к циклическому пептидному ядру через аминогруппу (-NH-) образуя пептидную/амидную связь (-NH-CO-), при этом значения радикала R1 перечислены в вышеприведенной формуле группы изобретений.

Для определения значений радикала R1 используются термины «низший» и «высший» по отношению к химическим группам алкил, алкокси и их замещенным производным. Термины «низший» и «высший» по отношению к упомянутым группам с указанием их конкретных значений раскрыты в описании к оспариваемому патенту (с.6, левая колонка, строки 14-49). Так, термин «низший» предполагает содержание в радикале от 1 до 6

атомов углерода (C1-C6), а термин «высший» от 7 до 20 атомов углерода (C7-C20).

В патентном документе [3] раскрывается фармацевтическая композиция для профилактики и/или лечения инфекции, вызванной *Pneumocystis carinii*, в которой в качестве активного компонента содержится соединение, которое в части радикалов соответствует соединениям по оспариваемому патенту.

В частности, когда в патентном документе [3] радикалы с соединении имеют следующие значения:

- R1 представляет собой ацильную группу;
- R2 представляет собой гидроксигруппу;
- R3 представляет собой гидроксисульфонилокси группу;
- R4 представляет собой кабамоил,
- R5 и R6 представляют собой гидроксигруппу.

При этом значение радикала R1 в патентном документе [3] выражено в очень широкой степени обобщения признака (ацильная группа), характеризующего структуру соединений. Следовательно, можно констатировать, что полипептидные соединения по оспариваемому патенту подпадают под общую структурную формулу группы известных из патентного документа [3] соединений, в случае, когда значения радикалов R2-R6, такие как упомянуто выше.

Вместе с тем, при обращении к представленному описанию к патентному документу [3] установлено, что ацильные радикалы в значении R1 имеют принципиальные структурные отличия по отношению к указанным в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента значениям соответствующего радикала.

В частности, в отношении довода возражения о том, соединение, полученное в примере 22 оспариваемого патента, подпадает под значения ацильного радикала приведенного в патентном документе [3] необходимо отметить следующее.

Соединение по примеру 22 характеризуется в части значения радикала R1 по оспариваемому патенту как "бензоил, замещенный фенилом, имеющим низший алкил".

При этом в перечне радикалов (с.12-14 [3]), отмеченном в возражении, наиболее близким к значению радикала R1 в соединении по примеру 22 может быть отмечено значение "ариольная группа (включает бензоил), которая может иметь одну или несколько (предпочтительно от 1 до 5) групп, выбранных из арильной группы, у которой может быть один или несколько (предпочтительно от 1 до 3), выбранных из высшей алкокси- или арилоксигруппы».

Здесь можно согласиться с мнением патентообладателя, что низшая алкильная группа, служащая заместителем в фенильном кольце соединения по примеру 22 оспариваемого патента, отлична от высшей алкокси-или арилоксигруппы в значениях ацильной группы для соединений по патентному документу [3].

Кроме того, важно акцентировать внимание на том, что в патентном документе [3] соединения по оспариваемому патенту не описаны как специально полученные и исследованные, следовательно, оспариваемое изобретение является «селективным» по отношению к известному уровню техники, и, следовательно, соответствуют условию патентоспособности «новизна» (пункт 1 статьи 4 Закона).

На заседании коллегии, состоявшемся 16.11.2020 лицом, подавшим возражение, также был озвучен довод о том, что изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента является селективным по отношению к изобретению, раскрытому в патентном документе [3].

Однако, для сравнения в качественном и количественном отношении с соединениями по оспариваемому патенту в качестве специально полученных и исследованных привлекались не соединения как таковые полученные в патентном документе [3], а соединения, полученные в патентных документах

[5] - [7], подпадающие под общую структуру соединений, раскрытую в патентном документе [3].

При этом необходимо отметить, что в патентных документах [5] и [6] противогрибковая активность МИК определялась в общей сумме всего для трех соединений, которые действительно, подпадают под определение ацильный радикал, данное в патентном документе [3], но при этом не подпадают под определение значения радикала R1 в структурной формуле соединений по оспариваемому патенту.

Так, в патентном документе [5] подвергалось исследованию соединение по примеру 3 (соединение I), в котором ацильный радикал представляет собой ароильную группу, которая может иметь один или более (предпочтительно от 1 до 5) высших (C7-C16) алкокси, а именно 6-н-октилокси-2 нафтоил, который не пересекается со значениями, указанными для соединений по оспариваемому патенту.

Патентный документ [6] раскрывает сведения о противогрибковой активности против *S. albicans* для двух соединений, а именно для соединений по примеру 2 (с. 20-21, таблица 2) и по примеру 12 (с. 21, таблица). В упомянутых соединениях ацильный радикал имеет одинаковую химическую природу и представляет собой ароил, замещенный высшим (C7-C16) алкокси, а именно 6-н-октилокси-2 бензоил и 6-н-октилокси-2 нафтоил, которые как отмечено выше (см. также определения высшей и низшей групп данные выше), не пересекается со значениями, указанными для соединений по оспариваемому патенту.

Что касается соединений, раскрытых в патентном документе [7], то необходимо отметить, что исследованию в отношении противогрибковой активности в данном документе подвергалось одно соединение (соединение по примеру 19), которое отличается от соединений по оспариваемому патенту не только значениями ацильного радикала, но и самой структурой циклического гексапептидного ядра, а именно, в положении, соответствующем атому

водорода (радикал R1 в соединении согласно [7]) содержится гидроксильная группа, а также отличается иной химической природой радикала R4.

При этом целесообразно отметить, что в описании к оспариваемому патенту содержатся экспериментальные данные относительно биологической активности широкого спектра соединений (31 соединение, таблица 2), в которых ацильный радикал R1 варьируется по своей структуре в широких пределах и характеризуется наличием заместителей, различных по своей химической природе. При всем разнообразии структуры ацильных радикалов все исследованные в оспариваемом патенте соединения характеризуются значением МИК в узком диапазоне от 0,05 до 0,39 мкг/мл и являются высокоэффективными.

Таким образом, соединения по оспариваемому патенту, являясь селективными по отношению к соединениям, раскрытым в общей структурной формуле патентного документа [3], не описаны как специально полученные и исследованные в патентных документах [3], [5]-[7] и обладая высокой противогрибковой эффективностью, соответствуют требованиям, предъявляемым к селективным изобретениям (см. п.19.5.3 (4) Правил).

Здесь следует отметить, что в соответствии с вышеизложенным, сведения, раскрытые в патентных документах [5]-[7], как по отдельности, так и в совокупности, также не могут порочить соответствие изобретения по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Лицом, подавшим возражение, не выбран наиболее близкий аналог изобретения по оспариваемому патенту, в возражении отмечено, что изобретение явным образом следует из источников информации [1]-[4].

Сведения, раскрытые в патентном документе [3] проанализированы выше.

В отношении сведений, раскрытых в патентном документе [1] необходимо отметить следующее.

В патентном документе [1] на противогрибковую активность испытывались соединения, которые в боковой цепи циклического гексапептидного ядра не содержат гидроксисульфоноксигруппы в фенильном кольце, которая является обязательно присутствующей в структуре соединений по оспариваемому патенту.

При этом, согласно сведениям, раскрытым патентообладателем в отзыве и лицом, подавшим возражение, упомянутый заместитель обеспечивает растворимость соединений в воде.

Кроме того, различия в структуре ацильного радикала в соединениях, известных из патентного документа [1] и структуре радикала R1 в соединениях по оспариваемому патенту также велики.

В частности, в возражении противопоставлены соединения, имеющие в качестве ацильного радикала группы, выбранные из фенил-фенилоксиундеcanoилов, гексилокси-нафтоилов и адамантил-этилокси-фенил-бензоилов, которые не охарактеризованы в формуле по оспариваемому патенту.

В соответствии с изложенным, следует констатировать, что сравнение показателей противогрибковой активности соединений исследованных в патентном документе [1] и соединений по оспариваемому патенту некорректно в силу значительных отличий в их структуре.

Таким образом, сведения раскрытые в патентном документе [1] не мотивируют специалиста модифицировать гексапептильное ядро и каким-либо образом варьировать структуру ацильного радикала для получения соединений с высокой противогрибковой эффективностью.

В отношении сведений, раскрытых в патентном документе [2] необходимо отметить, что на противогрибковую активность испытывалось соединение I, которое показало высокую эффективность со значением МИК 0,1 мг/мл (с.8, таблица). Однако соединение I, раскрытое в патентном документе [2] в качестве ацильного радикала имеет группу гептаноилокси-нафтоил (нафтоил, который замещен группой высший алкокси), который не

пересекается со значениями радикала R1 в соединениях по оспариваемому патенту.

При этом следует отметить, в патентном документе [2] не содержится какой-либо иной информации, показывающей, что модификация ацильной группы предсказывает получение нового соединения с высокой противогрибковой эффективностью.

В патентном документе [4] раскрыты полипептидные соединения, в которых радикал, соответствующий радикалу R1 в соединениях по оспариваемому патенту четко определен в общей структуре как остаток пальмитиновой кислоты (пальмитоил), который является конкретным представителем группы высших алканоилов. Высшие алканоилы сами по себе не предусмотрены в качестве значений радикала R1 в соединениях по оспариваемому патенту.

Следует подчеркнуть, что, как отмечено выше, в патентном документе [4] не предусмотрено какое-либо варьирование радикала соответствующего радикалу R1 в структуре соединений по оспариваемому патенту. Таким образом, специалист в данной области техники не может быть мотивирован к изменению пальмитоида на какой-либо иной радикал с целью получения соединений, обладающих высокой противогрибковой эффективностью.

В отношении доводов возражения о несоответствии условию патентоспособности соединения по примеру 25, входящего в объём изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента необходимо отметить следующее.

Полипептидные соединения по оспариваемому патенту, в частности соединение по примеру 25, являются ингибиторами фермента β -1,3 глюкансинтазы, обладают противомикробной, в частности противогрибковой активностью и характеризуются минимальной ингибирующей концентрацией в отношении микроорганизма *Candida albicans* в диапазоне от 0,05 до 0,39 мкг/мл (соединение 25 имеет значение 0,05 мкг/мл).

(Низший)алкилокси-изоксазол-фенильный фрагмент, входящий в состав соединения по примеру 25, является частью ацильного радикала. Между тем ни одно из 3,5-диарильных производных изоксазола, раскрытых в статье [9] (10 соединений, Таблица 3), патентном документе [10] (43 соединения, Таблица 5), статье [11] (16 соединений, Таблица 1), статье [12] (3 соединения), не содержит карбоксильной группы в качестве заместителя одного из арильных колец. Соответственно, в указанных документах отсутствует какая-либо информация о противогрибковой активности таких соединений, которые могли бы рассматриваться как близкие аналоги соединения по примеру 25 оспариваемого патента.

В отношении статьи [8] необходимо отметить, что она описывает циклофунгин, полусинтетический аналог эхикандинов, предшественник гидроксисульфонилокси-замещенных производных эхикандина. Данная статья приведена в возражении для понимания общего уровня техники.

Данные обстоятельства обуславливают вывод о том, что соединения по независимому пункту 1 и зависимым от него пунктам 2-4, 7-8 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту имеют преимущества, как в качественном, так и в количественном отношении по сравнению с известным уровнем техники [1]-[12], не содержащим, как изложено выше, сведений о возможности получения новых производных эхикандинов с высокой противогрибковой эффективностью, т.е. явным образом, не следует из уровня техники.

Таким образом, изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункту 1 статьи 4 Закона).

Изобретение по независимому пункту 5 раскрывает способ получения соединений формулы I по пункту 1, изобретение по независимому пункту 6 раскрывает фармацевтическую композицию на основе соединений формулы I по пункту 1. Отличительным признаком объектов по независимым пунктам 5

и 6 формулы являются новые полипептидные соединения общей структурной формулы I.

Доводов о несоответствии изобретений по независимым пунктам 5 и 6 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении не представлено. Вместе с тем, в возражении не приведено источников информации свидетельствующих об известности упомянутых выше отличительных признаков (иное строение полипептидных соединений) в уровне техники и, соответственно, известности их влияния на технический результат.

Таким образом, возражение не содержит доводов, позволяющих признать группу изобретений по оспариваемому патенту несоответствующей условиям патентоспособности (пункт 1 статьи 4 Закона).

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 04.02.2020, патент Российской Федерации на изобретение № 2165423 оставить в силе.