

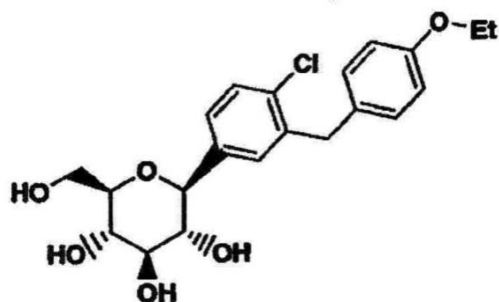
ЗАКЛЮЧЕНИЕ

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 и отдельные законодательные акты Российской Федерации», и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденными приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020 г. № 644/261, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020 № 59454 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2746132, поступившее 28.06.2022 от Закрытого акционерного общества "Канонфарма продакшн", РФ (далее – лицо, подавшее возражение), при этом установлено следующее.

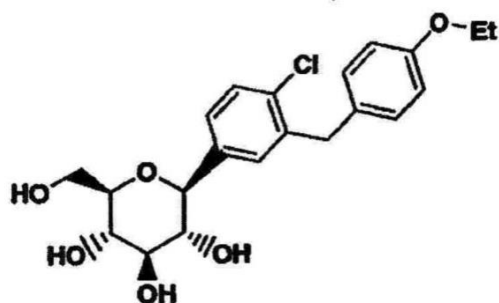
Патент Российской Федерации № 2746132 на группу изобретений «С-арил глюкозидные SGLT2 ингибиторы и способ их применения», выдан по заявке № 2020135467 с приоритетом от 20.05.2002 на имя АстраЗенека АБ (Швеция) (далее – патентообладатель). Патент действует со следующей формулой:

«1. Соединение формулы:



или его фармацевтически приемлемая соль или его сложный эфир, представляющий собой пролекарство.

2. Соединение формулы:



3. Фармацевтическая композиция, обладающая ингибирующим действием в отношении SGLT2, включающая соединение по п.1 или 2 и фармацевтически приемлемый носитель».

Против выдачи данного патента в соответствии с подпунктами 1 и 3 пункта 1 статьи 1398 указанного выше Гражданского Кодекса поступило возражение, мотивированное несоответствием изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1 и 3 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности "промышленная применимость", несоответствием изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1 и 2 формулы условию патентоспособности "новизна" и несоответствием группы изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1-3 формулы условию патентоспособности "изобретательский уровень".

К возражению приложены копии следующих материалов:

- патентный документ RU 2 262 507 С2, дата публикации 20.10.2005 (далее-[1]);
- публикация международной заявки WO 01/27128 А1, дата публикации 19.04.2001 (далее-[2]);
- публикация международной заявки WO 02/28872 А1, дата публикации 11.04.2002 (далее-[3]);
- статья Оку, Akira, et al. "T-1095, an inhibitor of renal Na⁺-glucose cotransporters, may provide a novel approach to treating diabetes", Diabetes, 1999, 48(9): 1794-1800 (далее-[4]);

- Stella VJ, Charman WN, Naringrekar VH. Prodrugs. «Do they have advantages in clinical practice?», Drugs. 1985 May; 29(5):455-73. doi: 10.2165/00003495-198529050-00002. PMID: 3891303 (в качестве справочного источника C1) (далее-[C1]).

Суть доводов возражения сводится к следующему.

По мнению лица, подавшего возражение, в описании к оспариваемому патенту отсутствуют сведения о средствах и методах, с помощью которых возможно осуществление изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1 и 3 формулы в том виде, как они охарактеризованы в любом из указанных пунктов формулы оспариваемого патента.

В отношении признаков «или его фармацевтически приемлемая соль или его сложный эфир, представляющий собой пролекарство», характеризующих соединение формулы I в независимом пункте 1 формулы отмечено, что в материалах заявки проиллюстрирован только пример получения соединения формулы I, а также несколько примеров получения только нескольких фармацевтически приемлемых солей и сложных эфиров (примеры D, E, F, G), а биологические данные представлены исключительно для соединения формулы I.

При этом в возражении отмечено, что представленные данные по биологической активности, в частности сведения, приведенные в таблице 1-3, подтверждают только ингибирующую активность только соединения формулы I в отношении основного люминального переносчика глюкозы в почечном проксимальном канальце (SGLT2). Данные по наличию или отсутствию ингибирующей активности фармацевтически приемлемых солей не представлены.

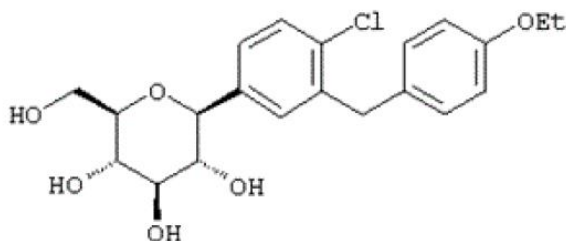
Примеры и данные, подтверждающие возможность применения сложного эфира соединения формулы I в качестве пролекарства не раскрыты в описании к оспариваемому патенту.

Кроме того, в возражении отмечено, что патентный документ [1] с приоритетом от 12.10.1999 (дата публикации 20.10.2005), может быть включен в уровень техники в части формулы, с которой состоялась регистрация изобретения, в соответствии с положениями нормативной базы, поскольку дата приоритета

патентного документа [1], предшествует дате приоритета оспариваемого патента - 20.05.2002.

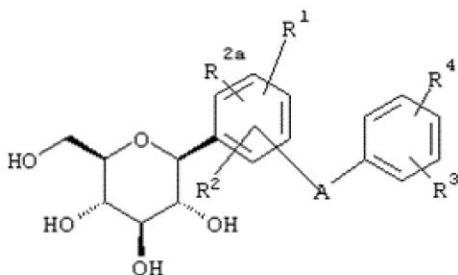
При этом, по мнению лица, подавшего возражение, все признаки независимого пункта 2 оспариваемого патента раскрыты в патентном документе [1]. Признаки независимого пункта 1 оспариваемого патента раскрыты в патентном документе [1], за исключением признака «сложный эфир, представляющий собой пролекарство».

В частности, в возражении отмечено, что в зависимом пункте 16 формулы патентного документа [1] раскрыто соединение имеющее формулу



, которая полностью идентична структурной формуле, представленной в независимых пунктах 1 и 2 формулы оспариваемого патента.

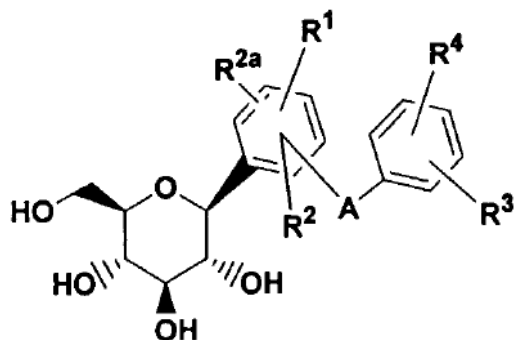
Вместе с тем, по мнению лица, подавшего возражение, в независимом пункте 1 формулы патентного документа [1] предлагаются фармацевтически приемлемые соли группы С-арилглюкозидных соединений, имеющих общую структурную формулу



Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, изобретения по независимым пунктам 1-3 формулы оспариваемого патента, а также достижение ими указанного в описании технического результата, представляются очевидными в свете имеющегося уровня техники [2]-[4], с учетом сведений раскрытых в статье [5].

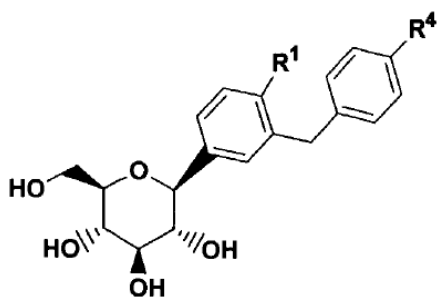
В частности, в возражении отмечено, наиболее близкий аналог по отношению к группе изобретений по оспариваемому патенту раскрыт в публикации [2] (с.8

строка 18 – с.9 строка 30, п.1 формулы), в которой описываются соединения следующей общей формулы:



(значения радикалов см. в п.1 формулы [2]).

Более конкретно, по мнению лица, подавшего возражение, публикация [2] (п.28 формулы) раскрывает соединения следующей структурной формулы:



, в которой, в одном из вариантов выполнения R1 представляет собой галоген, R4 представляет собой OR5, где R5 – алкил.

При этом в возражении отмечено, что соединение по независимым пунктам 1, 2 формулы оспариваемого патента подпадает под общую структурную формулы группы соединений, раскрытых в публикации [2]. В частности, отмечено, что в публикации [2] (с.28 строки 9-17) под алкилом понимается разветвленная или неразветвленная углеводородная цепь, содержащая от 1 до 20 углеродов, предпочтительно от 1 до 10 углеродов, более предпочтительно от 1 до 8 углеродов, в том числе этил-группа, а термин "галоген" относится к хлору, бром, фтору и йоду, причем предпочтительными являются хлор или фтор (с.32 строки 11-14 [2]).

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, из публикации [2] известно соединение, где R1 представляет собой Cl, а R4 представляет собой O-Et группу.

Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, публикация [2] также относится к фармацевтически приемлемым солям и эфирам, представляющим собой

пролекарство (с.37 строка 24-с.38 строка 13 [2]) и к фармацевтическим композициям, содержащим вышеуказанное соединение и фармацевтически приемлемый носитель (п.15 формулы [2]).

При этом в возражении отмечено, что хотя признаки, характеризующие изобретения по независимым пунктам 1-3 формулы оспариваемого патента раскрыты в публикации [2], тем не менее, соединение по независимым пунктам 1, 2 формулы оспариваемого патента не указано в публикации [2] как специально полученное и исследованное.

Между тем в возражении отмечено, что соединение по оспариваемому патенту (с.33-35 описания) является ингибитором SGLT2 и может применяться для лечения сахарного диабета. Соединение демонстрирует более высокое значение EC50 против SGLT2 по сравнению с соединением, описанным в примере 12 публикации [2] (где R4 представляет собой O-Me, а не O-Et).

При этом среднее снижение уровня глюкозы в крови по сравнению с контролем было выше для соединения формулы I по оспариваемому патенту, чем для соединения примера 12 публикации [2]. Кроме того, предложенное в оспариваемом патенте соединение больше снижало уровень глюкозы, чем соединение примера 12 публикации [2].

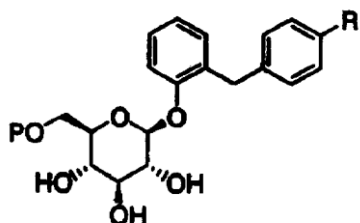
Данные эффекты по мнению лица, подавшего возражение, указывают на увеличение биологической активности соединения по пунктам 1, 2 формулы оспариваемого патента, где R4 представляет собой O-Et, по сравнению с аналогичным соединением, где R4 представляет собой O-Me.

В возражении также отмечено, что данные, приведенные в описании оспариваемого патента на (с. 33) в таблице 1 свидетельствуют о том, что значение EC50 против SGLT2 для соединения формулы I по оспариваемому патенту в 1,1 раз больше значения EC50 против SGLT2 для аналогичного соединения из публикации [2], где R4 представляет собой O-Me.

Однако, по мнению лица, подавшего возражение, из публикации [2] (реферат, формула) известно, что все соединения, подпадающие под вышеуказанную общую структурную формулу являются ингибиторами SGLT2 и могут применяться для

лечения сахарного диабета. В возражении отмечено, что в публикации [2] (с.52 строка 15-с.53 строка 7) также раскрыто, что получали и исследовали значения EC50, хотя точные значения не приведены.

Вместе с тем в возражении отмечено, что в публикации [3] (пример 10, табл.1,2) показано, что увеличение размера радикала в положении 4 дистального кольца (R) при одинаковых минимальных заместителях Р в соединении:



приводит к увеличению селективности и ингибирования SGLT2.

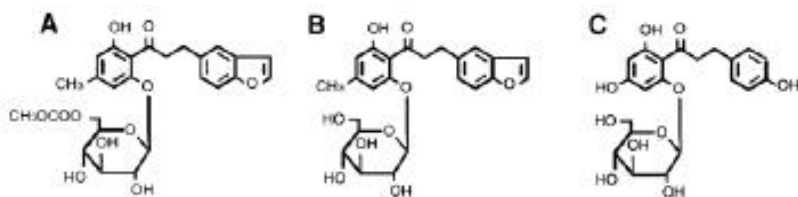
В частности, в возражении отмечено, что в публикации [3] соединение 14, где R представляет собой этил, а Р – метоксикарбонил, показало значение IC50 500 нм, тогда как, в случае R, представляющем собой метил, при том же Р (соединение 12), - 450 нм, что указывает на большую селективность первого. В публикации [3] (табл.1) также предлагается в качестве R этокси-группа, т.е. O-Et.

Таким образом, лицо, подавшее возражение, указывает на то, что в публикации [3] (табл. 2) показано, что при замене метильного радикала на этильный активность соединения увеличивается от IC50= 450 нм до IC50= 500нм, т.е. в 1,1 раза.

На основании изложенного в возражении сделан вывод о том, что увеличение активности, достигаемое соединением согласно независимым пунктам 1, 2 формулы оспариваемого патента, очевидным образом следует из уровня техники, в частности из публикации [3], и является идентичным известному увеличению активности, достигаемому при замене метильного радикала на этильный как в качественном, так и в количественном отношении.

Кроме того, в возражении обращается внимание на статью [4] (реферат, табл.1, фиг.1-3, раздел "RESULTS"), в которой показано, что увеличение размера радикала в дистальном кольце вызывает увеличение биологической активности. А

именно, в статье [4] протестированы соединения Т-1095 (А) и Т-1095А (В) в сравнении с соединением (С) (фиг.1):



При этом в возражении отмечено, что соединения (А) и (В) проявили более высокие показатели селективности в отношении SGLT2 (как показано по IC₅₀) и более высокий уровень экскреции глюкозы с мочой, тем самым большее снижение уровня глюкозы в крови.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, эффекты, указывающие на увеличение биологической активности при замене R₄ O-Me на O-Et, представляются очевидными. Следовательно, для соединений по независимым пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента не показаны какие-либо новые неизвестные для этой группы соединений свойства в качественном или количественном отношении (требования к селективному изобретению).

От патентообладателя, уведомленного в установленном порядке о поступлении и содержании возражения, на заседании коллегии, состоявшемся 02.11.2023, поступил отзыв на указанное возражение.

К отзыву приложены копии следующих материалов:

- решение Роспатента от 30.04.2022 (далее- [5]);
- приоритетная заявка US 60/158,773 с переводом на русский язык (далее- [6]);
- заявка на получение патента РФ №2002109477 (далее- [7]);
- решение Роспатента от 10.06.2022 (далее- [8]);
- евразийская заявка №200300316 (далее- [9]);
- статья Gray et al., 2000 с частичным переводом на русский язык (далее- [10]);
- статья Hongu et al., 1998 с переводом на русский язык (далее- [11]).

В отзыве патентообладатель выразил несогласие с доводами возражения.

В отношении соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость» в отзыве отмечено следующее:

В описании к оспариваемому патенту указано назначение группы изобретений.

Кроме того, по мнению патентообладателя, в описании к оспариваемому патенту указаны средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в любом из пунктов формулы изобретения.

В частности, в отношении сложных эфиров, представляющих собой пролекарство, в отзыве отмечено, что в описании к оспариваемому патенту (с.14, строки 29-42) указано: «Термин "сложные эфиры, представляющие собой пролекарства", используемый здесь, относится к сложным эфирам и карбонатам, полученным при взаимодействии одного или более гидроксильных соединений формулы I с алкил-, алкокси- или арил-замещенным ацилирующим агентом при использовании методов для получения ацетатов, пивалатов, метилкарбонатов, бензоатов и им подобных соединений, хорошо известных специалистам в данной области. Кроме того, из уровня техники известны сложные эфиры, на основе карбоновых и фосфорных кислот, такие как метиловый, этиловый, бензиловый и т.д.». Примеры таких эфиров в описании приведены.

Кроме того, в отзыве отмечено, что специалисту в данной области техники понятно, что производные соединения формулы I, в частности, сложные эфиры, представляющие собой пролекарство, могут быть получены на основании сведений, приведенных в описании к оспариваемому патенту, и такие производные будут обладать свойствами, аналогичными свойствам соединения формулы I, и будут определяться самой химической структурой соединения. Поэтому приведение в описании к патенту дополнительных экспериментальных данных, касающихся сложных эфиров, представляющих собой пролекарство, не требовалось для того, чтобы специалист в данной области смог сделать обоснованный вывод о возможности осуществления изобретения и достижения технического результата в

объеме всей совокупности признаков изобретения независимых пунктов 1 и 3 формулы.

При этом в отзыве отмечено, что в источнике информации [4] не содержится информации о снижении или ухудшении фармакологической активности сложных эфиров, представляющих собой пролекарства, по отношению к исходным биологически активным соединениям.

В отношении солей соединения формулы I, отмечено, что получение фармацевтически приемлемых солей биологически активных соединений основано на общеизвестных рутинных методах, в частности, на смешении основания с подходящим солеобразователем. Также отмечено, что общеизвестно, что соли биологически активных соединений обладают тем же видом активности, что и основание.

В отношении возможности реализации назначения изобретения, в отзыве отмечено, что в описании к оспариваемому патенту (с.22-31) показано получение соединения формулы I и приведены его физико-химические характеристики, а также приведены (с.32-36) данные его биологической активности и селективности по сравнению с известным соединением примера 12, раскрытым в публикации [2], с достижением технического результата группы изобретений при реализации назначения - эффективного и селективного ингибирующего воздействия на рецептор SGLT2, за счет чего достигается ингибирование натрий-зависимых переносчиков глюкозы путем введения млекопитающим соединения формулы I.

В отношении соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» по отношению к патентному документу [1] в отзыве отмечено следующее:

Патентный документ [1] не может быть противопоставлен, как содержащий сведения, порочащие новизну изобретений по независимым пунктам 1, 2 формулы оспариваемого патента, поскольку, по мнению патентообладателя, приоритет изобретения по пункту 16 формулы патентного документа [1] может быть установлен по дате поступления в Роспатент дополнительных материалов - 20.12.2004, что позднее даты приоритета изобретения по оспариваемому патенту -

20.05.2002. При этом поясняется, что соединение формулы I, не было раскрыто в материалах заявки 2002109477, по которой был выдан патент [1] на дату ее подачи, и оно было включено только на стадии экспертизы по существу в ответе на запрос экспертизы 21.06.2004 в зависимый от пункта 1 пункт 16 формулы.

Следовательно, изобретение по пункту 16 формулы патентного документа [1] не может быть включено в уровень техники для проверки новизны изобретения по оспариваемому патенту. При этом, по мнению патентообладателя, доводы, изложенные в решении [8] подтверждают данную позицию.

В отношении соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» по отношению к сведениям, раскрытым в публикации [2], в отзыве отмечено следующее:

Патентообладатель подтверждает, что соединение формулы I, лежащее в основе группы изобретений по оспариваемому патенту подпадает под общую структурную формулу группы известных соединений, раскрытых в публикации [2], при этом не описано как специально полученное и исследованное.

Вместе с тем, патентообладатель не согласен с доводом возражения о том, что для соединения по оспариваемому патенту не показаны какие-либо новые неизвестные свойства в качественном или количественном отношении, по сравнению с группой соединений, известной из публикации [2].

В частности отмечено, что результаты *in vitro* испытаний, приведенные в таблице 1 показывают, что соединение формулы I является высокоселективным (в 1263 раза выше) в отношении SGLT2 по сравнению с SGLT1 и примерно в 1,7 раза более селективным в отношении SGLT2 по сравнению с SGLT1 относительно соединения, раскрытого в примере 12 публикации [2], считавшегося наиболее перспективным кандидатом из всех описанных и исследованных соединений, подпадающих под общую структурную формулу соединений, раскрытых в публикации [2].

Кроме того, патентообладатель отмечает, что в описании оспариваемого патента также показаны результаты испытаний *in vivo* на животных моделях, демонстрирующие, что соединение формулы I значительно эффективнее снижает

уровень глюкозы в крови и плазме по сравнению с соединением примера 12 публикации [2].

При этом, по мнению патентообладателя, доводы, изложенные в решении [5] подтверждают данную позицию.

Также в отзыве отмечено, что доводы возражения, об известности влияния замены метильного радикала на этильный на биологическую активность соединений, описанных в публикации [3] и источнике информации [4], которые имеют иную структуру, нежели соединения, описанные в публикации [2], являются необоснованными, носят антинаучный характер, содержат очевидные фактические ошибки и, соответственно, не могут свидетельствовать об очевидности соединения формулы 1 по оспариваемому патенту.

Так, патентообладатель приводит копию евразийской заявки [9], которая является региональной фазой международной РСТ заявки, по которой осуществлена публикация [3], в которой на с. 12-22 приведены ссылочные примеры 1-17, а на с. 22-26 примеры 1-22. При этом в отзыве подчеркнуто, что соединения, полученные согласно ссылочным примерам 1-17, не имеют ничего общего с соединениями, полученными согласно примерам 1-22. Соответственно, по мнению патентообладателя, значения IC50 для соединений согласно ссылочным примерам 12 и 14, не имеют никакого отношения к соединениям согласно примерам 12 и 14, следовательно, довод возражения ошибочен.

Кроме того, в отношении сути значения IC50, патентообладатель отмечает, что в действительности IC50 (концентрация полумаксимального ингибирования) является показателем концентрации лекарственного вещества, необходимого для 50% ингибирования тестовой реакции (см. статью [10]). Таким образом, чем ниже цифровое значение IC50 для определенного соединения, тем выше показатель его активности, а не наоборот, как ошибочно указано в возражении. Вместе с тем, патентообладатель отмечает, что показатель IC50 не является характеристикой селективности соединения, при этом в публикации [3] вообще не исследовалась селективность полученных соединений в отношении ингибирующей активности к SGLT2 по сравнению с SGLT1.

В подтверждение своих доводов патентообладатель приводит сопоставление значений IC50, приведенное в таблице 2 публикации [3] со структурой соответствующих соединений согласно ссылочным примерам 11-17, что, по мнению патентообладателя, в действительности, свидетельствует об отсутствии корреляции активности с размером заместителя и о непредсказуемости влияния заместителей на активность.

В отношении сведений раскрытых в статье [4], в которой исследовалось изменение активности соединений А, В и С в отношении рецептора SGLT, патентообладатель отмечает, что в отличие от довода возражения о том, что биологическая активность соединений А и В увеличивалась исключительно в связи с увеличением размера радикала в дистальном кольце, в действительности, как видно из структур соединения А и В отличаются от соединения С не только увеличенным размером радикала в дистальном кольце, но и иными радикалами, а именно, одновременной заменой нескольких функциональных групп на алкильную, сложноэфирную и гетероарильную группы, каждая из которых, безусловно, влияет на биологическую активность соединений.

Вместе с тем, патентообладатель приводит статью [11], в которой раскрыто, что соединение, имеющее 4-метоксигруппу в дистальном кольце, приводило к экскреции 340 мг глюкозы с мочой в течение 24-часового периода при пероральном введении (с.6 перевода [11]). Оно было значительно более активно, чем соединение, которое имеет 4-этоксигруппу на дистальном кольце, и приводило к экскреции только 124 мг глюкозы с мочой в течение 24-часового периода при пероральном введении. Соответственно, по мнению патентообладателя, в статье [4] было показано, что 4-этоксигруппа почти в три раза менее эффективна, чем метоксигруппа.

Таким образом, в отзыве сделан вывод о том, что специалист в данной области техники, изучив статью [4] не получит никаких предпосылок к замене метоксигруппы в соединении по примеру 12 публикации [2] на более крупную этоксигруппу, поскольку этоксизамещенное соединение продемонстрировало самые низкие результаты в проведенных исследованиях.

В корреспонденции, поступившей 25.11.2022, лицом, подавшим возражение, представлены дополнительные пояснения по возражению, в которых доводы о несоответствии группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», которые по существу повторяют доводы возражения.

Вместе с тем, в дополнениях отмечено, что примеры D, E, F в описании к оспариваемому патенту нельзя рассматривать в качестве примеров фармацевтически приемлемых солей или сложных эфиров, представляющих собой пролекарство соединения формулы I, поскольку они относятся исключительно к производным соединения формулы I, которые служат промежуточными соединениями.

В отношении приоритета изобретений, раскрытых в патентном документе [1], лицом, подавшим возражение, отмечено, что согласно данным официальной публикации от 20.10.2005 Бюл. № 29, приоритет установлен от 12.10.1999 согласно первой заявке US 60/158,773. Иные сведения по приоритету в официальной публикации и общедоступном реестре отсутствуют. Следовательно, никаких изменений в установление приоритета изобретений по патентному документу [1] внесено не было.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, патентный документ [1] включен в уровень техники для оценки новизны правомерно.

При этом в дополнении к возражению лицом, подавшим возражение, указано новое основание, а именно несоответствие изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента в части сложного эфира, представляющего собой пролекарство соединения формулы I, соединения формулы I по независимому пункту 2 формулы и фармацевтической композиции по независимому пункту 3 формулы в части соединения формулы I, сложного эфира, представляющего собой пролекарство соединения формулы I условию патентоспособности новизна по отношению к сведениям, раскрытым в публикации [2].

В частности отмечено, что из публикации [2] известно соединение по оспариваемому патенту в случае, когда в соединении общей структурной формулы, раскрытой в публикации [2] (пункт 27 формулы) R1 представляет собой галоген, R4

- OR5, где R5 – алкил и в соответствии с описанием к публикации [2] (с.28, с 32), R1 является Cl, а R4 является O-Et группой.

При этом, по мнению лица, подавшего возражение, доводы, изложенные в решении [8], подтверждают данную позицию, поскольку публикация [2] указана в упомянутом решении как источник [3].

Вместе с тем, в дополнениях отмечено, что в публикации [2] (с.37 строка 24 – с.38 строка 13) раскрыты эфиры, представляющие собой пролекарство. При этом раскрыты те же самые примеры пролекарств, что и в описании к оспариваемому патенту (см. с. 14).

Кроме того, в дополнениях отмечено, что в публикации [2] (реферат, формула) раскрыто, что все соединения, подпадающие под общую структурную формулу, являются ингибиторами SGLT2 и могут применяться для лечения сахарного диабета. Из публикации [2] (пункты 15-17 формулы) известны фармацевтические композиции, содержащие соединение и фармацевтически приемлемый носитель.

В свою очередь, на заседании коллегии, состоявшемся 06.12.2022, патентообладателем было представлено дополнение к отзыву (см. приложение 1 к протоколу заседания коллегии) по мотивам дополнений к возражению, в котором доводы технического характера по существу повторяют доводы отзыва.

При этом в отношении признака, характеризующего «сложные эфиры, представляющие собой пролекарство», патентообладатель подчеркивает, что данный признак характеризует не просто сложные эфиры, а именно «сложные эфиры, представляющие собой пролекарство», т.е. включает в себя только сложные эфиры, имеющие привлекательные для фармацевтической промышленности фармакокинетические и физико-химические характеристики биологически активного соединения.

Кроме того, в дополнениях отмечено, что соединение формулы I подпадает под общую структурную формулу группы известных соединений, раскрытую в публикации [2]. При этом соединение формулы I не описано в публикации [2] как специально полученное и исследованное. Данное обстоятельство является достаточным, по мнению патентообладателя, для того, чтобы признать изобретение

по оспариваемому патенту соответствующим условию патентоспособности «новизна» по отношению к сведениям, раскрытым в публикации [2].

При этом, по мнению патентообладателя, выводы сделанные Роспатентом в решении [5] по аналогичному спору по данному патенту в отношении публикации [2], подтверждают данную позицию.

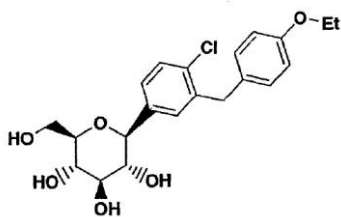
Кроме того, патентообладатель по прежнему настаивает на том, что патентный документ [1] не может быть включен в уровень техники для оценки соответствия группы изобретений условию патентоспособности «новизна».

Вместе с тем на заседании коллегии, состоявшемся 06.12.2022, в ходе рассмотрения спора, патентообладатель ходатайствовал о предоставлении возможности внесения изменений в объём правовой охраны группы изобретений по оспариваемому патенту (измененная формула на данном заседании коллегии не представлялась).

В корреспонденции, поступившей 16.01.2023, лицом подавшим возражение представлено определение Суда по интеллектуальным правам по делу № СИП-795/2022 (далее – [12]).

На заседании коллегии, состоявшемся 15.02.2023, лицом, подавшим возражение, представлены комментарии в отношении документа [12].

В корреспонденции, поступившей 09.03.2023, патентообладатель ходатайствовал о приобщении к материалам дела измененной формулы, из которой исключены независимые пункты 1 и 2 формулы, с которой состоялась выдача оспариваемого патента, при этом из независимого пункта 3 формулы, характеризующего фармацевтическую композицию на основе соединений по пунктам 1 и 2, исключены отсылки на данные пункты, активное вещество композиции охарактеризовано в виде соединения следующей структуры:



При этом необходимо отметить, что лицом, подавшим возражение, в частности на заседании коллегии, состоявшемся 14.03.2023 (см. приложение 1 к протоколу заседания коллегии) и в корреспонденции, поступившей 20.03.2023, была изложена позиция о необходимости отклонения измененной формулы по причине нарушения процедуры ее предоставления.

Вместе с тем, в корреспонденции, поступившей 27.03.2023, патентообладателем представлены пояснения в отношении представленной 09.03.2023 измененной формулы изобретения по оспариваемому патенту, в которых доводы технического характера по существу повторяют доводы патентообладателя, представленные ранее в отзыве и дополнениях к нему.

На заседании коллегии, состоявшемся 30.03.2023, лицом, подавшим возражение, представлено мотивированное мнение в отношении изобретения по измененной формуле от 09.03.2023, к которой приложены решение [8] и определение [12].

При этом лицом, подавшим возражение, отмечено, что фармацевтическая композиция не соответствует условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень».

При этом отмечено, что в описании к оспариваемому патенту отсутствует пример получения композиции согласно представленной измененной формуле изобретения, а также отсутствует пример с указанием ингредиентов, их характеристики и количественного соотношения.

Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, фармацевтическая композиция не соответствует условию патентоспособности «новизна» в свете сведений раскрытых в патентном документе [1], поскольку признак, характеризующий назначение композиции, а именно «обладающая ингибирующим действием в отношении SGLT2» раскрыт в названии патентного документа [1].

Вместе с тем, по мнению лица, подавшего возражение, фармацевтическая композиция по измененной формуле не соответствует условию патентоспособности «новизна» по отношению к сведениям раскрытым в публикации [2]. При этом

доводы технического характера повторяют доводы, изложенные лицом, подавшим возражение, в дополнениях от 25.11.2022.

При этом, по мнению лица, подавшего возражение, доводы, изложенные в решении [8] подтверждают данную позицию, поскольку публикация [2] указана в упомянутом решении как источник [3]. Также отмечено, что правомерность решения [8], подтверждена определением [12].

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

С учетом даты начала отсчета срока действия патента, соответственно, с учетом даты подачи заявки (15.05.2003) и с учетом разъяснений, изложенных в пункте 27 Постановления Пленума Верховного Суда Российской Федерации от 23 апреля 2019 г. N 10 (см. также дело № СИП-570/2022), правовая база для оценки патентоспособности группы изобретений по оспариваемому патенту включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 № 3518-1 с учетом изменений и дополнений, внесенных Федеральным законом № 22 – ФЗ от 07.02.2003 "О внесении изменений и дополнений в Патентный закон Российской Федерации" (далее - Закон) и Правила составления и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 17.04.1998 №82, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 22.09.1998 № 1612, с изменениями от 8 июля 1999 г., 13 ноября 2000 г. (далее – Правила). При этом дата фактического поступления материалов заявки в федеральный орган исполнительной власти (28.10.2020) служит основанием для установления правовой базы для оценки правомерности проведения административных процедур, предшествующих выдаче оспариваемого патента, что с учетом доводов возражения в данном споре не требуется.

Согласно пункту 27 Постановления Пленума Верховного Суда Российской Федерации от 23 апреля 2019 г. N 10 г. Москва от "О применении части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации", При оспаривании решений Роспатента и федерального органа исполнительной власти по селекционным достижениям суды должны учитывать: заявки на выдачу патента, заявки на

товарный знак, а также заявки на наименование места происхождения товара подлежат рассмотрению в порядке, установленном законодательством, действовавшим на дату подачи заявки, а международные заявки на изобретение, промышленный образец или товарный знак и преобразованные евразийские заявки - на дату поступления заявки в Роспатент.

По возражениям против выдачи патента, предоставления правовой охраны товарному знаку, наименованию места происхождения товара основания для признания недействительным патента, предоставления правовой охраны товарному знаку, наименованию места происхождения товара определяются исходя из законодательства, действовавшего на дату подачи заявки в Роспатент или в федеральный орган исполнительной власти по селекционным достижениям. Основания для признания недействительным патента на изобретение, выданного по международной заявке на изобретение или по преобразованной евразийской заявке, признания недействительным предоставления правовой охраны промышленному образцу или товарному знаку по международной регистрации определяются исходя из законодательства, действовавшего на дату поступления соответствующей международной или преобразованной евразийской заявки в Роспатент, если иное не предусмотрено международным договором Российской Федерации.

Вместе с тем подлежит применению порядок рассмотрения соответствующих возражений, действующий на момент обращения за признанием недействительными патента, предоставления правовой охраны товарному знаку, наименованию места происхождения товаров.

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

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.1. Правил при установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения.

Проверяется также, описаны ли в первичных материалах заявки средства и

методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в любом из пунктов формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в материалах заявки допустимо, чтобы указанные средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения.

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

Согласно пункту 1 статьи 4 Закона изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники.

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

При установлении новизны изобретения в уровень техники также включаются при условии их более раннего приоритета все поданные в Российской Федерации другими лицами заявки на изобретения и полезные модели, с документами которых вправе ознакомиться любое лицо, и запатентованные в Российской Федерации изобретения и полезные модели.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.2. Правил, в соответствии с пунктом 1 статьи 4 Закона изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники.

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

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.2. Правил в уровень техники, с даты приоритета, включаются также все изобретения и полезные модели, запатентованные (в том числе и тем же лицом) в Российской Федерации (т.е. зарегистрированные в соответствующих Государственных реестрах СССР и Российской Федерации).

Зapatентованные в Российской Федерации изобретения и полезные модели включаются в уровень техники только в отношении формулы, с которой

состоялась регистрация изобретения или полезной модели в соответствующем Государственном реестре Российской Федерации.

Согласно подпункту 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, включая характеристику назначения.

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

Датой, определяющей включение источника информации в уровень техники опубликованных описаний к охраняемым документам является указанная на них дата опубликования.

Согласно подпункту 8 пункта 19.5.2. Правил в отношении изобретения, для которого установлено несоответствие условию новизны, проверка изобретательского уровня не проводится.

Согласно пункту 1 статьи 4 Закона изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.3. Правил изобретение признается не следующим для специалиста явным образом из уровня техники, в частности, в том случае, когда не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Проверка соблюдения указанных условий включает:

- определение наиболее близкого аналога
- выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);

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

Согласно подпункту 4 пункта 19.5.3. Правил условию изобретательского уровня соответствуют, в частности, 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).

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.4. Правил если заявлена группа изобретений, проверка патентоспособности проводится в отношении каждого из входящих в нее изобретений. Патентоспособность группы может быть констатирована только тогда, когда патентоспособны все изобретения группы.

Если установлено, что патентоспособны не все изобретения группы, то заявителю сообщается об этом и предлагается представить свое мнение относительно приведенных доводов и, при необходимости, исключить из формулы независимые пункты, в которых охарактеризованы непатентоспособные изобретения, либо представить эти пункты в скорректированном виде.

Согласно пункту 40 Правил ППС в рамках рассмотрения возражения патентообладатель вправе ходатайствовать с представлением материалов об изменении предоставленного патентом объема правовой охраны изобретения, при условии, что это не повлечет расширения объёма правовой охраны.

Ходатайство может быть подано, если испрашиваемые изменения устраняют причины, которые должны повлечь признание предоставления правовой охраны результатам интеллектуальной деятельности недействительным либо в случае если без внесения соответствующих изменений предоставление правовой охраны (патент) должно быть признано недействительным полностью, а при их внесении – частично.

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

В отношении соответствия группы изобретений по пунктам 1 и 3 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость» установлено следующее.

В описании к оспариваемому патенту указано назначение группы изобретений, заключающееся в получении С-арил глюкозидного соединения формулы I, которое обладает способностью ингибировать натрий-зависимые переносчики глюкозы, обнаруживаемые в кишечнике и почках у млекопитающих, а также фармацевтической композиции, включающей соединение формулы I.

В отношении указания средств и методов, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в любом из указанных пунктов формулы изобретения, необходимо отметить следующее.

В описании к оспариваемому патенту приведено достаточно схем, иллюстрирующих возможные пути получения целевого соединения. При этом следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что получение фармацевтически приемлемых солей биологически активных соединений основано на общеизвестных рутинных методах, в частности, на смешении основания с подходящим солеобразователем. При этом общеизвестно, что фармацевтически приемлемые соли биологически активных соединений обладают тем же видом активности, что и основание.

В отношении сложных эфиров, представляющих собой пролекарства, в описании к оспариваемому патенту (с.14, строки 29-42) указано, что они относятся к сложным эфирам и карбонатам, полученным при взаимодействии одного или более гидроксильных соединений формулы I с алкил-, алкокси- или арил-замещенным ацилирующим агентом при использовании методов для получения ацетатов, пивалатов, метилкарбонатов, бензоатов и им подобных соединений, хорошо известных специалистам в данной области. Кроме того, в описании к оспариваемому патенту указано, что из уровня техники известны сложные эфиры, на основе карбоновых и фосфорных кислот, такие как метиловый, этиловый, бензиловый и т.д. Примеры таких эфиров приведены.

Таким образом, специалисту в данной области техники понятно, что производные соединения формулы I, такие как фармацевтически приемлемые соли и сложные эфиры, представляющие собой пролекарство, могут быть получены на основании сведений, приведенных в описании к оспариваемому патенту, и такие производные будут обладать свойствами, аналогичными свойствам соединения формулы I, поскольку будут определяться самой химической структурой соединения.

При этом, что касается возможности реализации назначения предложенными изобретениями, то в описании к оспариваемому патенту (с.22-31) показано получение соединения формулы I и приведены его физико-химические характеристики, а также приведены (с.32-36) данные его биологической активности и селективности по сравнению с известным соединением примера 12, раскрытым в публикации [2], с достижением технического результата группы изобретений при реализации назначения - эффективного и селективного ингибирующего воздействия на рецептор SGLT2, за счет чего достигается ингибирование натрий-зависимых переносчиков глюкозы путем введения млекопитающим соединения формулы I.

Следовательно, приведение в описании к патенту дополнительных экспериментальных данных, касающихся получения солей и получения сложных эфиров, представляющих собой пролекарство, не требуется для того, чтобы специалист в данной области смог сделать обоснованный вывод о возможности осуществления изобретения и достижения технического результата в объеме всей совокупности признаков изобретения независимых пунктов 1 и 3 формулы.

Вместе с тем следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что в справочном источнике информации [C1] не содержится информации о снижении или ухудшении фармакологической активности сложных эфиров, представляющих собой пролекарства, по отношению к исходным биологически активным соединениям.

Таким образом, необходимо констатировать, что не выявлено препятствий для признания предложенных в независимых пунктах 1-3 формулы по

оспариваемому патенту изобретений, соответствующими условию патентоспособности «промышленная применимость» (пункт 1 статьи 4 Закона, пункт 19.5.1 (1) Правил).

В отношении соответствия группы изобретений по пунктам 1-3 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «новизна» по отношению к сведениям, раскрытым в формуле изобретения патентного документа [1] установлено следующее.

Оспариваемый патент на группу изобретений (RU № 2746132) выдан по заявке № 2020135467 (дата начала отсчета срока действия патента 15.05.2003, дата фактического поступления материалов заявки в федеральный орган исполнительной власти 28.10.2020).

Заявка № 2020135467, по которой выдан оспариваемый патент, на данный момент является последним звеном цепочки выделенных заявок.

При этом основанием для выделений послужила заявка № 2004137489 от 15.05.2003 (также являлась датой отсчета срока действия патента, однако действие патента было досрочно прекращено) является переведенной на национальную фазу в РФ международной заявкой PCT/US2003/015591, дата подачи 15.05.2003, (номер публикации WO 03/099836, дата публикации 04.12.2003) с приоритетом от 20.05.2002, установленным по первой заявке US 10/151,436.

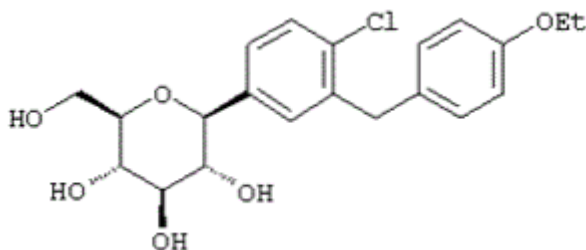
Таким образом, приоритет по оспариваемому патенту правомерно установлен от 20.05.2002 в соответствии с заявкой № 2004137489, послужившей основанием для каскада выделений.

При этом согласно данным официальной публикации от 20.10.2005 Бюл. № 29, приоритет изобретений по патентному документу [1] установлен от 12.10.1999 согласно первой заявке US 60/158,773 [6]).

Следует согласиться с доводом лица, подавшего возражение, что иные сведения о приоритете изобретений по патентному документу [1] в официальной публикации и общедоступном реестре отсутствуют. Следовательно, никаких изменений в установление приоритета изобретений по патентному документу [1] внесено не было.

Соответственно, патентный документ [1], имеющий более раннюю дату приоритета (12.10.1999) по отношению к дате приоритета изобретений по оспариваемому патенту (20.05.2002) включается в уровень техники для целей проверки новизны в отношении формулы, с которой состоялась регистрация изобретения в соответствующем реестре (пункт 19.5.2 (2) Правил).

При этом следует констатировать, что в патентном документе [1], в зависимом пункте 16 формулы, раскрыто соединение имеющее формулу



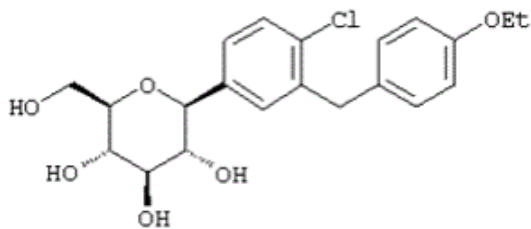
которая полностью идентична структурной формуле соединения, представленной в независимых пунктах 1 и 2 формулы оспариваемого патента.

При этом в патентном документе [1], сведений о существовании конкретного соединения упомянутой выше формулы в виде соли или в виде сложных эфиров, представляющих собой пролекарство, не представлено.

Вместе с тем в формуле изобретения патентного документа [1] не раскрыта какая-либо фармацевтическая композиция.

Что касается признака пункта 3 формулы оспариваемого патента, характеризующего, что фармацевтическая композиция обладает ингибирующим действием в отношении SGLT2, то следует отметить, что в формуле изобретения, с которой патентный документ [1] включен в уровень техники, сведений об активности соединений не содержится. В отношении довода лица, подавшего возражение, о том, что сведения об активности раскрыты в названии группы изобретений по патентному документу [1] следует отметить, что согласно положениям действовавшей нормативно-правовой базы (пункт 19.5.2 (2) Правил), название не включается в уровень техники, а кроме того, не является объектом патентных прав.

Таким образом, следует констатировать, что изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента в части соединения структуры



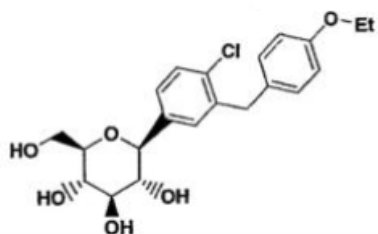
и изобретение по независимому пункту 2 формулы в полном объеме не соответствуют условию патентоспособности «новизна» по отношению к соединению пункта 16 формулы патентного документа [1] (пункт 1 статьи 4 Закона, подпункт 1 пункта 19.5.2. Правил).

Забегая вперед целесообразно отметить, что в ходе рассмотрения спора, патентообладатель на заседании коллегии, состоявшемся 06.12.2022, ходатайствовал о предоставлении ему возможности внесения изменений в объем правовой охраны группы изобретений по оспариваемому патенту.

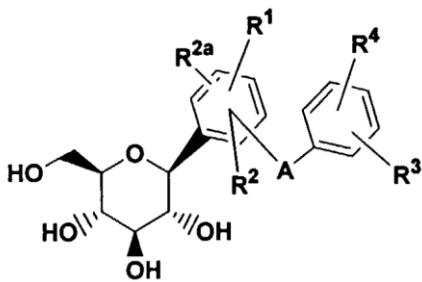
В отношении соответствия группы изобретений по пунктам 1-3 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «новизна» по отношению к сведениям, раскрытым в публикации [2] установлено следующее.

Публикация международной заявки [2] осуществлена до даты приоритета группы изобретений по оспариваемому патенту, следовательно публикация [2] включена в уровень техники в полном объеме (пункт 22.3 Правил).

Соединение, раскрытое в независимых пунктах 1 и 2 формулы оспариваемого патента



подпадает под общую структурную формулу группы соединений, известных из публикации [2], в частности, в случае, когда в соединении общей формулы



радикалы R1, R2 и R2a независимо друг от друга обозначают водород или галоген, R3 и R4 независимо обозначают водород или -OR5a и R5a означает алкил, A означает (CH2)n, где n означает 1.

Соединение по независимому пункту 1 формулы группы изобретений по оспариваемому патенту, в случае, когда оно представлено в виде его фармацевтически приемлемой соли, также подпадает под общую структурную формулу группы известных из публикации [2] соединений, когда его радикалы имеют упомянутые выше значения и оно находится в виде его фармацевтически приемлемых солей.

Однако соединение по независимым пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента не описано в публикации [2] (см. также заявку [7]) как специально полученное и исследованное, и при этом проявляет новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении (анализ см. ниже в настоящем заключении при оценке изобретательского уровня).

Таким образом, соединение по независимым пунктам 1, 2 формулы, а также фармацевтически приемлемые соли соединения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента соответствуют требованию, предъявляемому к «селективным изобретениям», что является предметом проверки соответствия таких изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень», что в смысле положений подпункта 8 пункта 19.5.2 Правил позволяет сделать вывод о том, что изобретения по независимым пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента априори соответствуют условию патентоспособности «новизна» по отношению к сведениям, раскрытым в публикации [2] (пункт 19.5.2 (1) Правил).

В отношении довода возражения о том, что в описании публикации [2] раскрыты сложные эфиры, пролекарства соединения по оспариваемому патенту,

следует отметить, что в описании публикации [2] (с.37) содержатся сведения о том, что термин «пролекарственные сложные эфиры, употребляемый в данном описании включает.....», однако в данном описании термин «пролекарственные сложные эфиры» употребляется не по отношению к целевым соединениям, выраженным общей структурной формулой (что так же однозначно вытекает из формулы публикации [2] (пролекарства не отражены в формуле), а по отношению к сырью в способе получения целевых соединений (см. оригинал описания публикации [2]).

Соответственно, фармацевтическая композиция по независимому пункту 3 формулы оспариваемого патента, в основе которой лежат соединения по пунктам 1, 2 формулы, также соответствует условию патентоспособности «новизна» по отношению к патентному документу [2] (пункт 19.5.2 (1) Правил).

В отношении соответствия группы изобретений по независимым пунктам 1-3 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «изобретательский уровень» в свете источников информации [2]-[4] установлено следующее.

Как отмечено выше, соединение, лежащие в основе группы изобретений по оспариваемому патенту является селективным по отношению к группе соединений, выраженных общей структурной формулой в публикации [2].

При этом в описании к оспариваемому патенту (с.31-32, биологические данные, соединение формулы I (Пример)) раскрыто, что соединение, структура которого раскрыта в независимых пунктах 1 и 2 формулы, является активным и селективным ингибитором основного люминального переносчика глюкозы в почечном проксимальном канальце (SGLT2). При этом соединение обладает повышенной селективностью к SGLT2 по сравнению с SGLT1.

Сравнительные данные активности ингибирования SGLT2 и SGLT1 для соединения по оспариваемому патенту и соединения примера 12, известному из публикации [2] приведены в таблице 1 описания к оспариваемому патенту.

Здесь целесообразно отметить, что соединение по примеру 12 описания публикации [2] является наиболее близким по своей структуре к соединению по оспариваемому патенту и отличается тем, что в положении соответствующем

радикалу R4 (в общей формулу обозначает –OR5а и R5а означает алкил) вместо группы -OEt находится группа –OMe.

Вместе с тем, в описании публикации [2] не представлено экспериментальных данных по исследованию биологической активности каких-либо соединений, лишь отмечено, что все соединения являются ингибиторами натрий-зависимых переносчиков глюкозы, обнаруживаемых в кишечнике и почках (ингибиторы SGLT2).

При этом из упомянутой выше таблицы 1 (с.33 описания к оспариваемому патенту) следует, что соединение по оспариваемому патенту является высокоселективным в отношении SGLT2 по сравнению SGLT1 (в 1,263 раза) и более селективным в этом направлении, чем соединение примера 12 (в 1,7 раза).

В отношении публикации [3] целесообразно отметить, что полный перевод с японского языка в возражении и в ходе делопроизводства по возражению не был представлен, однако евразийская заявка [9], представленная патентообладателем, являющаяся региональной фазой международной заявки PCT, по которой осуществлена публикация [3] позволяет ознакомиться с полным текстом описания на русском языке.

С учетом изложенного, в отношении сведений, раскрытых в публикации [3], следуют согласиться с доводом патентообладателя о том, что в описании публикации [3] (см. также [9]) ссылочные примеры 1-17 и примеры 1-22 относятся к разным соединениям. Так, в частности, соединения по примерам 11-22 (табл.1 [3]) получали, используя соединения, предварительно полученные в ссылочных примерах 12-17. Соответственно, значения IC50 (табл.3 [3]) для соединений согласно ссылочным примерам 12 и 14, не имеют отношения к соединениям согласно примерам получения целевых соединений 12 и 14, в которых R представляет собой, метил и этил, а P – метоксикарбонил (табл.1 [3]).

Кроме того, действительно, как отмечено патентообладателем, специалист в данной области техники осведомлен (см., например, источник информации [10]) о том, что IC50 (концентрация полумаксимального ингибирования) свидетельствует о

том, что чем ниже цифровое значение IC50 для определенного соединения, тем выше показатель его активности, а не наоборот, как указано в возражении.

Также общеизвестно, что показатель IC50 не является характеристикой селективности соединения. Вместе с тем в публикации [3] не исследовалась селективность полученных соединений в отношении ингибирующей активности к SGLT2 по сравнению с SGLT1.

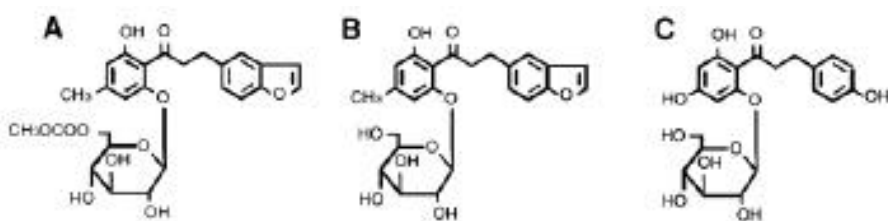
Следовательно, можно согласиться с мнением патентообладателя, что довод возражения о том, что увеличение размера радикала в положении 4 дистального кольца (R) при одинаковых минимальных заместителях Р в соединениях, раскрытых в публикации [3], т.е. замена метильного радикала на этильный, для специалиста однозначно означает увеличение селективности и ингибирования SGLT2, неверен.

Опровержение данной позиции в отношении сведений, раскрытых в публикации [3], лицом, подавшим возражение, представлено не было.

Таким образом, сведения, раскрытые в публикации [3] не могут мотивировать специалиста в данной области техники к замене группы OMe на группу OEt в соединении, полученном в публикации [2] с целью увеличения селективности и ингибирования SGLT2.

Статья [4] относится к синтетическим агентам А (Т-1095) и В (Т-1095А), полученным из соединения С (флоризин), являющимся специфическим ингибитором котранспортеров натрий+глюкозы (ингибиторы SGLT).

При этом, необходимо констатировать, что сведения, раскрытые в статье [4] демонстрируют, что структуры соединения А и В отличаются от структуры соединения С (см. структуры ниже) не только увеличенным размером радикала в дистальном кольце, но и иными радикалами а именно, одновременной заменой нескольких функциональных групп на алкильную, сложноэфирную и гетероарильную группы, каждая из которых оказывает влияние на биологическую активность соединений.



Поэтому не представляется возможным сделать вывод о влиянии только одной замены группы в дистальном кольце.

При этом также необходимо отметить, что в статье [4] исследовалась ингибирующая активность соединений в отношении любых рецепторов SGLT, а не специфическая активность в отношении рецептора SGLT2 в соответствии с группой изобретений по оспариваемому патенту.

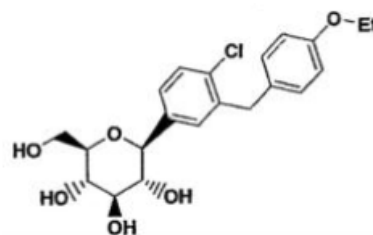
Кроме того, следует также обратить внимание на статью [11], в которой те же авторы исследовали влияние непосредственно алкильной и алкоксигруппы на активность соединения С, и пришли к выводу что соединение имеющее 4-ОМе группу (метоксигруппа) в дистальном кольце было значительно более активным чем соединение имеющее 4-ОEt группу (этоксигруппа) в том же кольце (см. табл. 1 [11]).

Таким образом, каких-либо предпосылок для специалиста в данной области техники для замены метоксигруппы в соединении по примеру 12 публикации [2] на этоксигруппу на основании исследований активности соединений А, В и С известный уровень техники не демонстрирует.

В соответствии с изложенным, следует констатировать, что изобретения по независимым пунктам 1, 2 формулы соответствуют требованию, предъявляемому к «селективным изобретениям», проявляет новые неизвестные для этой группы свойства в качественном и количественном отношении (пункт 19.5.3. (4) Правил).

Соответственно, фармацевтическая композиция по независимому пункту 3 формулы оспариваемого патента, в основе которой лежат соединения по пунктам 1 и 2 формулы, также соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 19.5.3. (1) Правил ИЗ).

Возвращаясь к изменённой формуле, представленной патентообладателем в корреспонденции, поступившей 09.03.2022, необходимо отметить, что она не изменяет объём испрашиваемой охраны по существу и фармацевтическая



композиция, содержащая соединение формулы в свете
изложенного выше соответствует всем условиям патентоспособности.

Мотивированное мнение лица, подавшего возражение, в отношении измененной формулы, по существу повторяет доводы возражения и дополнений к нему, проанализированы выше и не меняют сделанного вывода.

В отношении мнения лица, подавшего возражение, о том, что измененная формула не может быть принята к рассмотрению по причине нарушения процедуры ее предоставления, следует отметить следующее.

Пункт 40 Правил ППС не содержит каких-либо временных ограничений предоставления и рассмотрения коллегией измененной формулы.

Что касается решений Роспатента [5] и [8], упоминаемых сторонами спора, то необходимо отметить что решение [8] касается только вывода о том, что признаки, характеризующие соединение пункта 16 формулы патентного документа [1], раскрыты в описании на дату его подачи, при этом каких-либо иных выводов в решении [8] не сделано. Следует отметить, что правомерность выводов, сделанных в решении [8], подтверждена в определении Суда по интеллектуальным правам по делу № СИП-795/2022. Вместе с тем, выводы, сделанные в решение [5] и в определении [12] не касаются вопросов новизны и изобретательского уровня, не пересекаются с доводами возражения и, соответственно, не влияют на сделанный выше вывод.

В решении [5] сделан вывод о том, изобретения по независимым пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента соответствуют требованию, предъявляемому к «селективным изобретениям» (пункт 19.5.3 (4) Правил) и, соответственно, фармацевтическая композиция по независимому пункту 3 формулы оспариваемого патента имеет изобретательский уровень, поскольку для специалиста явным образом не следует из уровня техники (пункт 19.5.3 (1) Правил). При этом уровень техники в решении [5] основан на сведениях, раскрытых в публикации [2]

(патентный документ [1] в решении [5]). Следовательно, каких-либо противоречий в выводах, сделанных в настоящем заключении выше и в решении [5] нет.

Указанное выше обуславливает вывод о том, что возражение содержит доводы, позволяющие признать оспариваемый патент недействительным частично и признать измененную формулу, представленную 09.03.2023 соответствующей всем условиям патентоспособности.

При этом следует обратить внимание, что на дату заседания коллегии, на котором была сформирована резолютивная часть, оспариваемый патент являлся действующим. Однако в связи с тем, что 15.05.2023 срок действия оспариваемого патента закончился и, учитывая резолютивную часть, представленную ниже, следует считать, что патент РФ на изобретение № 2746132 действовал с даты начала отсчета срока в объёме формулы, представленной 09.03.2023.

На заседании, состоявшемся 24.04.2023, коллегия пришла к выводу о наличии оснований для принятия Роспатентом следующего решения:

удовлетворить возражение, поступившее 28.06.2022, патент Российской Федерации на изобретение № 2746132 признать недействительным частично и выдать патент на изобретение с формулой, представленной 09.03.2023.

(21) 2020135467

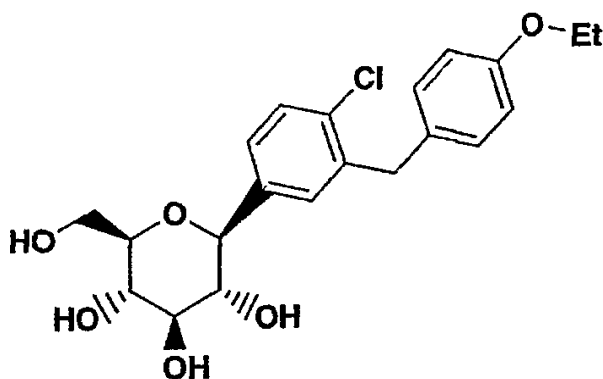
(51) МПК

C07H 7/04 (2006.01)

A61K 31/70 (2006.01)

(57)

1. Фармацевтическая композиция, обладающая ингибирующим действием в отношении SGLT2, включающая соединение формулы



и фармацевтически приемлемый носитель.

- (56) WO 01/27128 A1, 19.04.2001
WO 98/31697 A1, 23.07.1998
WO 94/11030 A1, 26.05.1994
US 5965540 A, 12.10.1999
SU 1567124 A3, 23.05.1990

ПРИМЕЧАНИЕ: Название изобретения скорректировано в соответствии с измененной формулой изобретения от 09.03.2023.