

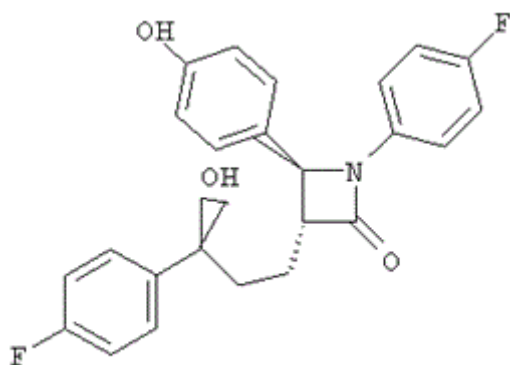
ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам
рассмотрения возражения заявления

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 № 2356550, поступившее 11.03.2020 от ООО Курышев и Партнеры (далее – лицо, подавшее возражение), при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2356550 на изобретение «Комбинация активатора (активаторов) рецептора, активируемого пролифератором пероксисом (РАПП), и ингибитора (ингибиторов) всасывания стерина и лечение заболеваний сосудов» выдан по заявке № 2003126184 с приоритетом от 26.01.2001 на имя ШЕРИНГ КОРПОРЕЙШН (США). Согласно записи в Государственном реестре от 19.04.2013 об изменении наименования патентообладателя в настоящее время патентообладателем является компания МЕРК ШАРП И ДОУМ КОРП. (США) (далее – патентообладатель). Патент действует со следующей формулой:

«1. Фармацевтическая композиция, обладающая свойствами агента для лечения или предупреждения сосудистого патологического состояния, диабета, ожирения или снижения концентрации стерина в плазме млекопитающего, включающая

(a) ингибитор всасывания стерина формулы (II)



(II)

или его фармацевтически приемлемые соли или сольваты,

- (b) моногидрат лактозы,
- (c) микрокристаллическую целлюлозу,
- (d) поливинилпирролидон,
- (e) натриевую соль кроскармелозы,
- (f) лаурилсульфат натрия, и
- (g) стеарат магния.

2. Фармацевтическая композиция по п.1, содержащая от около 0,1 до около 1000 мг соединения формулы (II) или его фармацевтически приемлемой соли или сольвата.

3. Фармацевтическая композиция по п.2, содержащая от около 0,25 до около 50 мг соединения формулы (II) или его фармацевтически приемлемой соли или сольвата.

4. Фармацевтическая композиция по п.3, содержащая около 10 мг соединения формулы (II) или его фармацевтически приемлемой соли или сольвата.

5. Фармацевтическая композиция по п.1, содержащая от около 0,1 до около 90 мас.% моногидрата лактозы в расчете на полную массу композиции.

6. Фармацевтическая композиция по п.5, содержащая около 55 мг моногидрата лактозы.

7. Фармацевтическая композиция по п.1, содержащая от около 0,1 до около 90 мас.% микрокристаллической целлюлозы в расчете на полную массу композиции.

8. Фармацевтическая композиция по п.7, содержащая около 20 мг микрокристаллической целлюлозы.

9. Фармацевтическая композиция по п.1, содержащая от около 0,1 до около 90 мас.% поливинилпирролидона в расчете на полную массу композиции.

10. Фармацевтическая композиция по п.9, содержащая около 4 мг поливинилпирролидона.

11. Фармацевтическая композиция по п.1, содержащая от около 0,1 до около 90 мас.% натриевой соли кроскармелозы в расчете на полную массу композиции.

12. Фармацевтическая композиция по п.11, содержащая около 8 мг натриевой соли кроскармелозы.

13. Фармацевтическая композиция по п.1, содержащая от около 0,1 до около 90 мас.% лаурилсульфата натрия в расчете на полную массу композиции.

14. Фармацевтическая композиция по п.13, содержащая около 2 мг лаурилсульфата натрия.

15. Фармацевтическая композиция по п.1, содержащая от около 0,1 до около 90 мас.% стеарата магния в расчете на полную массу композиции.

16. Фармацевтическая композиция по п.15, содержащая около 1 мг стеарата магния.

17. Фармацевтическая композиция по п.1, дополнительно включающая, по крайней мере, один активатор рецептора, активируемого пролифератором пероксисом.

18. Фармацевтическая композиция по п.17, в которой, по крайней мере, один активатор рецептора, активируемого пролифератором пероксисом, представляет собой производное фибриновой кислоты,

выбранное из группы, включающей фенофибрат, клофибрат, гемфиброзил, ципрофибрат, безафибрат, клинофибрат, бинифибрат, лифиброл и их смеси.

19. Фармацевтическая композиция по п.18, в которой производное фибриновой кислоты представляет собой фенофибрат.

20. Фармацевтическая композиция по п.1, в которой ингредиенты взяты в следующем количественном соотношении, мас. %:

Соединение формулы (II)	10
Лактозы моногидрат	55
Микрокристаллическая целлюлоза	20
Поливинилпирролидон	4
Натриевая соль кроскармелозы	8
Лаурилсульфат натрия	2
Стеарат магния	1

21. Фармацевтическая композиция по п.1, в которой ингредиенты взяты в следующем количестве, мг:

Соединение формулы (II)	10
Лактозы моногидрат	55
Микрокристаллическая целлюлоза	20
Поливинилпирролидон	4
Натриевая соль кроскармелозы	8
Лаурилсульфат натрия	2
Стеарат магния	1

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

К возражению приложены копии следующих материалов:

- заявка WO 9508532, дата публикации 30.03.1995 (далее – [1]), дополнительно приложен патентный документ RU 2138480 (патент получен по заявке [1]);

- статья Josef B Schwartz et al. «Oral Solid Dosage Forms», 1990, pp.1633-1647 (далее – [2]),

- заявка WO 9909959, дата публикации 04.03.2000 (далее – [3]), дополнительно приложен патентный документ EA 3663 (патент получен по заявке [3]);

- заявка WO 0032189, дата публикации 08.06.2000 (далее – [4]), дополнительно приложен патентный документ ЕА 3363 (патент получен по заявке [4]);

- заявка WO 02058732, дата публикации 01.08.2002, на основании которой получен оспариваемый патент (далее – [5]);

- уведомление/протокол ЕПВ по экспертизе заявки [5] от 10.11.2005 (далее – [6]);

- патентный документ EP 1353696, дата публикации 20.12.2006 (далее – [7]).

В отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость» в возражении отмечено следующее.

Как отмечает лицо, подавшее возражение, независимый пункт 1 формулы оспариваемого патента содержит только перечисленные в нем ингредиенты без указания их количественного содержания.

При этом, по мнению лица, подавшего возражение, количественные содержания компонентов являются существенными признаками изобретения, без которых не реализуется назначение изобретения и не достигается заявленный технический результат.

Так, в возражении акцентируется внимание на том, что любое произвольное соотношение компонентов, в частности, ингибитора всасывания стерина формулы (II) и вспомогательных компонентов - (b) моногидрата лактозы, (c) микрокристаллической целлюлозы, (d) поливинилпирролидона, (e) натриевой соли кроскармелозы, (f) лаурилсульфата натрия и (g) стеарата магния, не позволит получить фармацевтическую композицию, обладающую свойствами агента для лечения или предупреждения сосудистого патологического состояния, диабета, ожирения или снижения концентрации стерина в плазме млекопитающего, то есть назначение изобретения не будет реализовано.

Кроме того, в возражении отмечено, что экспериментальные данные, представленные в описании к оспариваемому патенту, не подтверждают возможность достижения технического результата во всем объеме, охватываемом формулой изобретения.

По мнению лица, подавшего возражение, в описании патента не предоставлено доказательств того, что композиции с другим количественным содержанием компонентов, кроме количества, указанного на с.119-120, смогут обеспечить реализацию назначения изобретения и достижение технического результата.

Дополнительно лицом, подавшим возражение, отмечено, что оспариваемый патент получен в результате перевода на национальную фазу международной заявки PCT/US2002/002009 (номер публикации WO 02/058732). При этом, по мнению лица, подавшего возражение, решаемая изобретением по оспариваемому патенту техническая задача и ее контекст должны рассматриваться в том виде, как они были указаны в первоначальных материалах международной заявки. Как отмечено в возражении, в упомянутых материалах однозначно указано, что изобретение представляет собой композицию, содержащую комбинацию, по меньшей мере, двух активных ингредиентов, в частности:

а) по меньшей мере, одного активатора рецептора, активируемого пролифератором пероксисом; и

б) по меньшей мере, одного ингибитора всасывания стерина формулы I (включая эзетимиб).

При этом в возражении отмечено, что статистически значимый результат лечения обеспечивает только одновременный прием двух активных ингредиентов (см. также мнение, изложенное в протоколе ЕПВ [6]).

Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что в описании к оспариваемому патенту не приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в независимом пункте 1 формулы изобретения.

В отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении представлено три пути доказывания упомянутого несоответствия.

Первый путь основан на том, что изобретение не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» в виду известности из уровня техники источников информации [1] и [2] в комбинации.

Второй основан на комбинации сведений, раскрытых в источниках информации [1], [2] и [3].

И третий путь основан на известности из уровня техники источников информации [1] и [4].

При этом во всех случаях в качестве наиболее близкого аналога изобретения по оспариваемому патенту лицом, подавшим возражение, выбрано техническое решение, известное из заявки [1].

Как отмечено в возражении, композиция по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента отличается от раскрытого в заявке [1] технического решения тем, что кукурузный крахмал заменен на четыре вспомогательных вещества, а именно, на микрокристаллическую целлюлозу, поливинилпирролидон (ПВП), натриевую соль кроскармелозы и лаурилсульфат натрия.

При этом лицом, подавшим возражение, отмечено, что до даты приоритета изобретения по оспариваемому патенту, специалисту были хорошо известны вспомогательные вещества, используемые в композиции по независимому пункту 1 формулы, а также их влияние на технический результат, указанный в реферате оспариваемого патента.

Так, в возражении отмечено, что каждое из вспомогательных веществ и их функция раскрыты в Главе 89 «Твердые лекарственные формы для перорального применения» статьи [2] (с. 1633-1647). Данные вспомогательные вещества известны, как разрыхлители (дезинтегранты) или суперразрыхлители (супердезинтегранты), то есть, из уровня техники известно, что они улучшают растворимость таблетки. Таким образом, по мнению лица, подавшего

возражение, композиция по пункту 1 формулы оспариваемого патента для специалиста следует явным образом из уровня техники, а именно, из комбинации источников информации [1] и [2].

В отношении быстро дезинтегрирующейся таблетки для перорального введения, раскрытой в заявке [3], в возражении отмечено, что согласно приведенным в заявке [3] экспериментальным данным, растворимость таблеток, содержащих крахмал вместо микрокристаллической целлюлозы, была ниже.

Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, в заявке [3] указано, что одним из предпочтительных разбавителей является микрокристаллическая целлюлоза и для получения легко диспергируемой таблетки используют дополнительные компоненты, такие, как смачивающие агенты, связующее вещество, смазку, а также супердизинтегрант. При этом предпочтительными вспомогательными агентами являются лаурилсульфат натрия (как смачивающий агент), стеарат магния (смазка), поливинилпирролидон, в частности повидон (K29/32) (связующее вещество), натрия крахмал гликолят Explotab (супердизинтегрант). В качестве дезинтегранта, альтернативного Explotab, указана натрийкарбоксиметилцеллюлоза, то есть натриевая соль кроскармелозы. При этом таблетки, раскрытые в заявке [3] (примеры 2, 4, 5), демонстрируют высокую скорость растворения. Замена крахмала на микрокристаллическую целлюлозу, лаурилсульфат натрия, стеарат магния на натриевую соль кроскармелозы, не обеспечивает достижение какого-либо неожиданного технического результата.

Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что для специалиста очевидно, что использование упомянутых вспомогательных веществ улучшит растворимость таблетки. Следовательно, влияние вспомогательных веществ, используемых в изобретении по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента, на улучшение растворимости таблеток известно из источников информации [2] и [3].

В отношении фармацевтического состава для перорального применения, известного из заявки [4], в возражении отмечено, что он характеризуется наличием в составе всех вспомогательных веществ, указанных в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента, и приводит к улучшению растворимости таблетки.

Так, в возражении отмечено, что среди предпочтительных вспомогательных веществ в заявке [4] упоминаются лактоза, микрокристаллическая целлюлоза, натриевая соль кроскармеллозы, поливинилпирролидон, лаурилсульфат натрия. При этом лактоза, микрокристаллическая целлюлоза и натриевая соль кроскармеллозы обеспечивают высокую способность к разрушению гранул композиций, а поливинилпирролидон и лаурилсульфат натрия обеспечивают повышенную биодоступность.

Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что композиция по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента, а также по зависимым от него пунктам, для специалиста следует явным образом из уровня техники, а именно, из комбинации источников информации [1] и [4], и не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

При этом в возражении подчеркнуто, что данные, представленные в описании к оспариваемому патенту, не подтверждают возможность достижения технического результата во всем объеме, охватываемом формулой изобретения, в том числе и в объеме признаков зависимых пунктов 2 и 3 формулы оспариваемого патента. По мнению лица, подавшего возражение, согласно описанию к оспариваемому патенту, статистически значимый результат лечения обеспечивает только одновременный прием двух активных ингредиентов, а именно: 200 мг тонкоизмельченного фенофибрата LIPANTHYL® и 10 мг соединения II (лечение D, с. 118-119 описания к оспариваемому патенту).

Второй экземпляр возражения в установленном порядке был направлен в адрес патентообладателя, отзыв от которого поступил на заседании коллегии, состоявшемся 21.09.2020.

К отзыву приложен ответ на запрос по заявке 2003126184 от 13.12.2006 г. на 7 л., а также следующие материалы (копии):

- статья VAN HEEK et al. " In Vivo Metabolism-Based Discovery of a Potent Cholesterol Absorption Inhibitor, SCH58235, in the Rat and Rhesus Monkey through the Identification of the Active Metabolites of SCH48461", THE JOURNAL OF PHARMACOLOGY AND EXPERIMENTAL THERAPEUTICS, 1997, pp. 157-163, с переводом релевантной части на 8 л. (далее – [8]);

- В.Л. Багирова и соавт. «Современные аспекты использования вспомогательных веществ в технологии лекарственных препаратов», Фарматека, 1998, № 6, С. 34-36 на 7 л. (далее-[9]);

- интернет распечатка об информации о эзетимибе из PubChem (найдено на <https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compound/150311>) с переводом релевантной части - на 5 л. (далее-[10]);

- интернет распечатка «Определение статистической значимости», (найдено на <https://wiki.loginom.ru/articles/statistical-significance.html>, на 1 л. (далее-[11]);

- интернет распечатка об информации о целекоксибе из PubChem (найдено на <https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compound/2662>) с переводом релевантной части на 6 л. (далее-[12]);

- «Химическая энциклопедия», научное издательство «Большая Российская энциклопедия», Москва, 1995, т. 4, с.356 (далее-[13]);

- статья Pandya V.M. et al., Formulation, Characterization, and Optimization of Fast-Dissolve Tablets Containing Celecoxib Solid Dispersion, Dissolution Technologies, ноябрь 2009, pp. 22-27, с переводом релевантной части на 6 л. (далее-[14]).

При этом в отзыве отмечено следующее.

По мнению патентообладателя, в описании к оспариваемому патенту приведены все необходимые сведения для осуществления изобретения с реализацией указанного назначения.

Так, в отзыве отмечено, что в описании к оспариваемому патенту указано назначение изобретения, а также отмечено, что в описании приведены примеры получения композиции и пример испытаний в условиях *in vivo* на изменение концентрации липидов. Кроме того, по мнению патентообладателя, описание содержит достаточно информации о качественном и количественном составе компонентов, в частности, ингибитор всасывания стерина формулы (II) представляет собой соединение эзетимиб, которое было известно до даты приоритета изобретения по оспариваемому патенту, как эффективный ингибитор всасывания стерина.

При этом в отзыве отмечено, что композиция по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента содержит ингибитор всасывания стерина формулы (II) (эзетимиб) и обеспечивает снижение стерина в плазме, что, по мнению патентообладателя, приводит к реализации композицией назначения.

При этом в отзыве акцентировано внимание на том, что независимый пункт 1 формулы оспариваемого патента содержит «функциональный признак», отражающий, что фармацевтическая композиция обладает свойствами агента для лечения или предупреждения сосудистого патологического состояния, диабета, ожирения или снижения концентрации стерина в плазме млекопитающего.

Таким образом, по мнению патентообладателя, композиция по оспариваемому патенту не может содержать такие количества активного вещества и наполнителей, которые не позволили бы ей лечить или предупреждать сосудистое патологическое состояние, диабет, ожирение или снижение концентрации стерина в плазме млекопитающего.

В отношении довода возражения о том, что статистически значимый результат лечения обеспечивает только одновременный прием двух активных ингредиентов, когда перорально вводят 200 мг тонкоизмельченного

фенофибрата и 10 мг соединения II (лечение D), патентообладатель отмечает, что это утверждение неверно. В отзыве отмечено, что статистическая значимость – это, по сути, оцененная мера уверенности в том, что полученный результат не является случайным. Результаты рассматриваются как статистически значимые, если вероятность случайного их появления не превышает некоторого общепринятого уровня. Во многих случаях за такой уровень принимают 5% (или ниже) вероятности случайного получения результата. Это означает, что если бы данное исследование повторили 100 раз, то случайного появления результатов можно было бы ожидать менее чем в 5 случаях (см. интернет распечатку [11]).

Вместе с тем в отзыве отмечено, что согласно данным, приведенным на с. 118 описания к оспариваемому патенту, композиции с одним компонентом (Лечение В и Лечение С) также приводили к снижению липопротеинов низкой и высокой плотности и холестерина в сыворотке.

Дополнительно в отзыве отмечено, что вопреки доводам лица, подавшего возражение, патент, выданный по результатам экспертизы, раскрытой в протоколе [6], включает один независимый пункт, направленный на композицию, содержащую один активный ингредиент.

В отношении несоответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в отзыве отмечено, что в возражении неверно выделены отличительные признаки изобретения по оспариваемому патенту, поскольку в изобретении используется моногидрат лактозы, а не лактоза.

В заявке [2], по мнению патентообладателя, не раскрывается использование натриевой соли кроскармелозы и, соответственно, ее свойства, а микрокристаллическая целлюлоза, согласно сведениям, раскрытым в статье [2], не является разрыхлителем или разбавителем, а является связующим. В техническом решении согласно заявке [2] используется сшитый поливинилпирролидон, который также является связующим. Кроме того, по

мнению патентообладателя, согласно сведениям, раскрытым в статье [2], лаурилсульфат натрия используется только в комбинации с крахмалом, который не используется в изобретении по оспариваемому патенту.

В отношении технического решения, раскрытого в заявке [3], патентообладатель отмечает, что данное техническое решение относится к усовершенствованному способу получения прессованных таблеток, содержащих метилцеллюлозу, которая не входит в состав композиции по оспариваемому патенту.

Также в отзыве отмечено, что специалист в данной области техники не мог бы сделать вывод на основании сведений, раскрытых в заявке [3], что крахмал нужно исключать из композиции, поскольку, часть примеров (примеры 7-10) и пункты 1, 13, 14, 18, 20, 21, 23, 26, 29, 30, 35, 36, 37 формулы изобретения из заявки[3] указывают на присутствие крахмала.

В отношении фармацевтической композиции, раскрытой в заявке [4], патентообладатель акцентирует внимание на том, что упомянутая композиция основана целекоксибе в качестве активного действующего вещества. При этом в заявке [4] решается задача удовлетворить потребность в лекарственных формах целекоксиба для перорального употребления, обладающих улучшенной растворимостью по сравнению с целекоксибом без добавок или с другими композициями целекоксиба. При этом отмечено, что эзетимиб и целекоксиб представляют собой химические вещества разной химической природы (см. источники информации [12] и [14]). Также отмечено, что растворимость зависит, в частности, от структуры соединения, поскольку растворимость определяется физическим и химическим сродством молекул растворителя и растворяемого вещества (см. источники информации [13] и [14]).

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

С учетом даты подачи заявки (25.01.2002), по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности изобретения по указанному патенту включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 №3517-1, в редакции Федерального закона «О внесении изменений и дополнений в Патентный закон Российской Федерации» № 22 – ФЗ от 07.02.2003 (далее – Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 06.06.2003 №82, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 30.06.2003 № 4852, с изменениями от 11.12.2003 (далее - Правила).

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

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

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

Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности.

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.1 Правил при установлении возможности использования изобретения в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности проверяется, указано ли назначение изобретения в описании, содержащемся в заявке на дату подачи (если на эту дату заявка содержала формулу изобретения - то в описании или формуле изобретения), а в случае испрашивания приоритета, более раннего, чем дата подачи - также в документах, послуживших основанием для испрашивания такого приоритета.

Кроме того, проверяется приведены ли в описании, содержащемся в заявке, и в указанных документах средства и методы, с помощью которых

возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в каждом из пунктов формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в указанных документах допустимо, чтобы упомянутые средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения.

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

В соответствии с подпунктом (3) пункта 19.5.1 Правил, если установлено, что соблюдены все указанные требования, изобретение признается соответствующим условию промышленной применимости. При несоблюдении хотя бы одного из указанных требований делается вывод о несоответствии изобретения условию промышленной применимости.

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. характеризуемое ею изобретение должно быть раскрыто в описании, а определяемый формулой изобретения объем правовой охраны должен быть подтвержден описанием.

В соответствии с подпунктом (3) пункта 3.3.1. Правил формула изобретения признается выражающей его сущность, если она содержит совокупность его существенных признаков, достаточную для достижения указанного заявителем технического результата.

В соответствии с пунктом 3.3.5. Правил в формуле изобретения, относящегося к композиции, приводятся ее наименование с указанием назначения, входящие в композицию ингредиенты и, при необходимости, количественное содержание ингредиентов.

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 включает:

- определение наиболее близкого аналога в соответствии с пунктом 3.2.4.2 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.

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

Анализ доводов возражения и отзыва патентообладателя, касающихся соответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», показал следующее.

Согласно формуле и описанию оспариваемого патента изобретение относится к области фармакологии и медицины и касается фармацевтической композиции для лечения или предупреждения сосудистого патологического состояния, диабета, ожирения или снижения концентрации стерина в плазме млекопитающего, включающей ингибитор всасывания стерина формулы (II) в качестве активного компонента и вспомогательные вещества.

Таким образом, назначение изобретения указано как в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента, так и в описании (с.3).

В отношении реализации назначения композиции, состоящей из одного активного ингредиента и вспомогательных веществ, следует отметить, что на

с.117-118 (лечение В) описания к оспариваемому патенту приведены испытания, полученные в условиях *in vivo* (в условиях живого организма), согласно которым упомянутая композиция продемонстрировала хорошие показатели по снижению липопротеинов низкой плотности (далее - ЛНП), липопротеинов высокой плотности (далее – ЛВП), холестерина (далее – Х) и триглицеридов (далее - ТГ). Таким образом, композиция может быть применена по назначению, указанному в формуле оспариваемого патента (см. с.4 описания к оспариваемому патенту).

Кроме того, необходимо отметить, что реализация назначения обусловлена наличием в композиции соответствующего активного ингредиента. При этом вспомогательные вещества влияют на степень растворимости композиции, а не на проявление активности композиции, отвечающей за реализацию назначения.

В отношении довода возражения, касающегося растворимости композиции, целесообразно отметить, что повышение растворимости является техническим результатом на достижение которого направлено изобретение по оспариваемому патенту.

Согласно вышеуказанной правовой базе, анализ достижения технического результата при оценке соответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость» не предусмотрен (см. подпункт (2) пункта 19.5.1 Правил).

Вместе с тем в отношении количественного содержания ингредиентов в композиции, следует отметить, что в соответствии с пунктом 3.3.5. Правил в формуле изобретения, относящейся к композиции, указание количественных показателей, входящих в нее ингредиентов не является обязательным и может быть включено при необходимости.

Что касается наличия в описании к оспариваемому патенту средств и методов для осуществления изобретения, то необходимо отметить, что на с.11-112 приведены сведения о рецептурах и составе таблетки (качественные и количественные параметры). Способ изготовления готовых форм раскрыт на

с.112-114, пример синтеза активного ингредиента представлен в примере на с.114-117.

Таким образом, следует констатировать, что изобретение по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (пункт 1 статьи 4 Закона).

В отношении соответствия оспариваемого изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» установлено следующее.

Можно согласиться с мнением лица, подавшего возражение, что наиболее близким аналогом изобретения по оспариваемому патенту является техническое решение, раскрытое в заявке [1].

Так, в заявке [1] (пункты 1-8 формулы изобретения) раскрыта фармацевтическая композиция для лечения или предотвращения атеросклероза или для снижения уровня холестерина в плазме крови, которая, в частности, может содержать эзетимиб (соединение бА, пример б) в качестве активного ингредиента и кукурузный крахмал, а также лактозу и стеарат магния в качестве вспомогательных веществ.

Здесь целесообразно отметить, что эзетимиб является соединением формулы II согласно изобретению по оспариваемому патенту.

Композиция по оспариваемому патенту отличается от композиции, известной из заявки [1], тем, что вместо лактозы используется моногидрат лактозы, а вместо крахмала используются микрокристаллическая целлюлоза, поливинилпирролидон, натриевая соль кроскармелозы и лаурилсульфат натрия.

В отношении известности отличительных признаков из статьи [2] необходимо отметить следующее.

Можно согласиться с доводом патентообладателя о том, что в заявке [2] не раскрывается использование натриевой соли кроскармелозы, ее свойства и, соответственно, ее влияние на достижение технического результата.

Кроме того, вопреки доводам лица, подавшего возражение, в заявке [2] нет указания на то, что микрокристаллическая целлюлоза непосредственно влияет на достижение улучшенной растворимости, поскольку сведения о микрокристаллической целлюлозе содержатся в разделе «разбавители» (с.1635 [2]), а сведения о разрыве межкристаллических связей целлюлозы в дезинтегрирующей среде в разделе «связующие» (с.1636 [2]).

Кроме того, действительно, как отмечает патентообладатель, лаурилсульфат натрия в композиции, известной из заявки [2], используется в комбинации с крахмалом, а не вместо него.

В отношении известности отличительных признаков из заявки [3] необходимо отметить следующее.

Заявка [3] раскрывает быстро дезинтегрирующую таблетку для перорального введения, содержащую метилцеллюлозу в качестве обязательного компонента. При этом метилцеллюлоза не является компонентом композиции по оспариваемому патенту. Также известная композиция включает лактозу, а не моногидрат лактозы, как в композиции по оспариваемому патенту.

Кроме того, можно согласиться с мнением патентообладателя о том, что специалист в данной области техники не мог быть мотивирован к исключению крахмала из композиции, поскольку значительная часть примеров осуществления композиции в заявке [3] содержит именно крахмал.

Таким образом, можно сделать вывод о том, что источники информации [1], [2] и [3] в любой комбинации не могут свидетельствовать о несоответствии изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень».

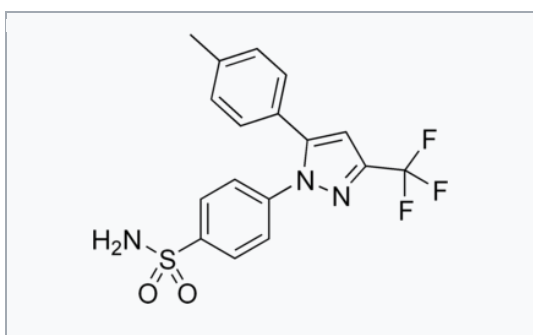
Что касается сведений, раскрытых в заявке [4], то необходимо отметить следующее.

В заявке [4] раскрывается композиция, включающая в качестве активного компонента целекоксиб, а в качестве вспомогательных веществ

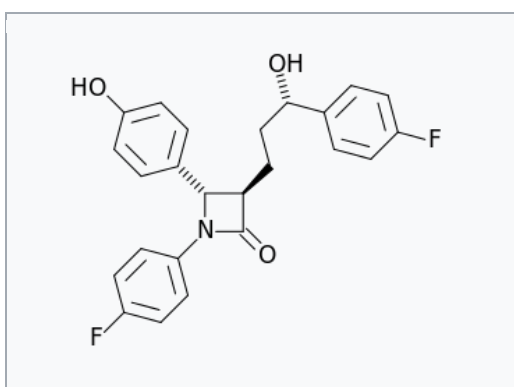
лактозу, натриевую соль кроскармелозы, поливинилпирролидон, лаурилсульфат натрия и стеарат магния (п.7 формулы [4])

При этом следует констатировать, что целекоксиб в известной композиции и эзетимиб в композиции по оспариваемому патенту являются веществами разной химической природы.

Целекоксиб является плохо растворимым нестероидным противовоспалительным препаратом из группы коксибов с диарилзамещенной пиразольной структурой (химическая группа фенилпиразолов) (см. распечатку [12]). Имеет следующую химическую структуру:



При этом эзетимиб является производным азетидинонов и имеет следующую химическую структуру:



Между тем целесообразно подчеркнуть, что именно химическая природа эзетимиба обуславливает причинно-следственную связь с указанным в описании техническим результатом, на достижение которого направлено изобретение по оспариваемому патенту.

Так, технический результат изобретения по оспариваемому патенту обеспечивает улучшенную растворимость композиции (см. реферат).

Из энциклопедии [13] известно, что растворимость соединения зависит, в частности, от структуры соединения, поскольку растворимость определяется физическим и химическим сродством молекул растворителя и растворяемого вещества. Таким образом, растворимость непосредственно связана с химической структурой вещества. Кроме того, обеспечение улучшенной растворимости представляет собой сложную задачу, требующую учета многих факторов, влияющих на растворимость (см. например, статью [14] в отношении целекоксиба).

Сведений, раскрытых в заявке [4], в отношении улучшения растворимости плохо растворимого целекоксиба, который, как упомянуто выше, структурно отличается от эзетимиба, недостаточно, чтобы мотивировать специалиста использовать описанный в заявке [4] состав вспомогательных компонентов для эзетимиба.

Кроме того, сведения в заявке [4] не касаются составов эзетимиба и каких либо иных производных азетидинонов, как таковых, также, как и в отношении улучшения свойств их растворимости.

При этом в описании к оспариваемому патенту на с. 120 представлены результаты испытаний растворимости эзетимиба в фармацевтической композиции по независимому пункту 1 формулы, которые показали растворение 100% вещества в течении 30 минут.

В соответствии с изложенным, нельзя согласиться с мнением, лица, подавшего возражение, в том, что изобретение по оспариваемому патенту явным образом следует из источников информации [1] и [4].

Таким образом, в возражении не содержится доводов, позволяющих сделать вывод о несоответствии изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 1 статьи 4 Закона).

При этом сведения, содержащиеся в источниках информации [9], [10], [14], приведенные патентообладателем для оценки соответствия изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень», не влияют на сделанный выше вывод.

Что касается делопроизводства, раскрытого в протоколе ЕПВ [5], следует отметить, что при рассмотрении возражения против выдачи патента, в частности, на изобретение, оценка правомерности действий экспертизы европейского патентного ведомства не проводится. В связи с этим, материалы, касающиеся протокола [5], не анализировались.

От лица, подавшего возражение, в корреспонденции от 12.11.2020 поступила жалоба, при этом доводы технического характера, содержащиеся в данной жалобе, проанализированы выше в настоящем заключении.

Что касается довода о том, что не была принята к рассмотрению измененная формула изобретения, представленная в отзыве патентообладателем, то необходимо отметить следующее.

В соответствии с пунктом 4.9 Правил ППС при рассмотрении возражения коллегия вправе предложить патентообладателю внести изменения в формулу изобретения в случае, если без внесения указанных изменений оспариваемый патент должны быть признаны недействительным полностью, а при их внесении - может быть признан недействительным частично.

Как изложено выше в настоящем заключении, изобретение по оспариваемому патенту соответствует условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «изобретательский уровень». Соответственно, необходимости в корректировке формулы не выявлено и представленная патентообладателем измененная формула изобретения не анализировалась.

Также от лица, подавшего возражение, в корреспонденции от 18.11.2020 поступила жалоба на имя Руководителя Роспатента, при этом

доводы технического характера, содержащиеся в данной жалобе, полностью повторяют доводы, содержащиеся в жалобе от 12.11.2020.

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 11.03.2020, патент Российской Федерации на изобретение № 2356550 оставить в силе.