

Приложение

к решению Федеральной службы по интеллектуальной  
собственности.

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

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 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 компании «КЬЕЗИ ФАРМАЧЕУТИЧИ С.П.А», Италия (далее – заявитель), поступившее 19.05.2015, на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее – Роспатент) от 25.11.2014 об отказе в выдаче патента на изобретение по заявке № 2012112454/15, при этом установлено следующее.

Заявлена группа изобретений «Фармацевтические аэрозольные препараты формотерола и беклометазона дипропионата», совокупность признаков которых изложена в формуле, представленной в корреспонденции, поступившей 23.05.2014, в следующей редакции:

«1. Фармацевтический аэрозольный препарат, предназначенный для применения в дозирующих ингаляторах под давлением (ДИД), включающий  
(а) от 0,001 до 0,05% масс/масс, формотерола фумарата дигидрата;  
(б) от 0,05 до 0,16% масс/масс, беклометазона дипропионата;  
(с) от 2,0 до 4,8% масс/масс, этианола;  
(д) 1,1,1,2-тетрафторэтан (ГФА 134a); и  
необязательно поверхностно-активное вещество,

отличающийся тем, что в препарате ГФА 134а является единственным пропеллентом и формотерола фумарата дигидрат является супспендированным в микронизированном виде, в то время как беклометазона дипропионат является полностью растворенным.

2. Препарат по п.1, включающий в качестве активных ингредиентов только комбинацию формотерола фумарата дигидрата и беклометазона дипропионата.

3. Препарат по п.1 или 2, в котором поверхностно-активное вещество выбрано из группы, состоящей из полисорбата 20, полисорбата 80, изопропилмиристата, олеиновой кислоты, сорбитана триолеата и лецитина.

4. Препарат по п.1 или 2, в котором концентрация формотерола фумарата дигидрата составляет от 0,002 до 0,03% масс/масс.

5. Препарат по п.4, в котором концентрация формотерола фумарата дигидрата составляет от 0,0025 до 0,01% масс/масс.

6. Препарат по п.1 или 2, в котором концентрация беклометазона дипропионата составляет от 0,06 до 0,12% масс/масс.

7. Препарат по п.6, в котором концентрация беклометазона дипропионата составляет от 0,07 до 0,10% масс/масс.

8. Препарат по п.1 или 2, в котором количество этанола составляет от 2,5 до 4,5% масс/масс.

9. Препарат по п.8, в котором указанное количество составляет от 2,5 до 4,0% масс/масс.

10. Препарат по п.9, в котором указанное количество составляет от 2,6 до 3,5% масс/масс.

11. Препарат по п.10, в котором указанное количество составляет от 3 до 3,5% масс/масс.

12. Препарат по п.1 или 2, в котором поверхностно-активное вещество представляет собой олеиновую кислоту.

13. Препарат по п.12, где содержание олеиновой кислоты составляет от 0,002 до 0,05% масс./масс.

14. Препарат по п.1 или 2, который способен обеспечить доставку 6 или 12 мкг формотерола фумарата дигидрата и 50 или 100 мкг беклометазона дипропионата за одно приведение в действие.

15. Препарат по п.14, который способен обеспечить доставку 6 формотерола фумарата дигидрата и 100 мкг беклометазона дипропионата за одно приведение в действие.

16. Фармацевтический аэрозольный препарат, предназначенный для применения в дозирующих ингаляторах под давлением, который способен обеспечить доставку 6 мкг формотерола фумарата дигидрата и 100 мкг беклометазона дипропионата за одно приведение в действие, включающий:

- (a) от 0,001 до 0,05% масс/масс, формотерола фумарата дигидрата;
- (b) от 0,05 до 0,16% масс./масс, беклометазона дипропионата;
- (c) от 2,0 до 4,8% масс/масс, этанола;
- (d) 1,1,1,2-тетрафторэтан (ГФА 134a); и
- (e) от 0,002 до 0,05% масс/масс, олеиновой кислоты,

отличающийся тем, что в препарате ГФА 134а является единственным пропеллером и формотерола фумарата дигидрат является суспендированным в микронизированном виде, в то время как беклометазона дипропионат является полностью растворенным.

17. Дозирующий ингалятор под давлением, включающий контейнер, заполненный фармацевтическим препаратом по любому из пп.1-16, и дозирующий клапан для доставки терапевтически эффективных доз активных ингредиентов.

18. Дозирующий ингалятор под давлением по п.17, в котором контейнер выполнен из алюминия.

19. Дозирующий ингалятор под давлением по п.17 или 18, в котором дозирующий клапан для доставки обеспечивает доставку объема от 50 до 100 мкл.

20. Дозирующий ингалятор под давлением по п.17 или 18, в котором дозирующий клапан для доставки обеспечивает доставку объема 50 мкл или 63 мкл.

21. Фармацевтический аэрозольный препарат по любому из пп. 1-16 предназначенный для предупреждения и/или лечения легких, умеренных или тяжелых, острых или хронических симптомов, или для профилактического лечения респираторных заболеваний.

22. Препарат по п.21, где заболевание представляет собой астму или хроническую обструктивную болезнь легких.

23. Применение беклометазона дипропионата в аэрозольном препарате для ДИД для ингаляции, включающем формотерола фумарата дигидрат в качестве активного ингредиента и смесь ГФА 134 и этанола в качестве носителя для уменьшения растворимости указанной соли формотерола в указанном носителе, где носитель имеет полярность, выраженную в виде диэлектрической постоянной  $E_m$ , значение которой находится в диапазоне от примерно 9,5 до примерно 11,0».

Данная формула была принята к рассмотрению при экспертизе заявки по существу.

По результатам проведения экспертизы Роспатентом было принято решение от 25.11.2014 об отказе в выдаче патента на изобретение.

Данное решение мотивировано тем, что заявленная группа изобретений не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В решении указаны следующие источники информации:

- патентный документ RU № 2356537 C2, опубликован 27.05.2009 (далее – [1]);
- патентный документ EP № 1982709 A1, опубликован 22.10.2008 (далее – [2]);
- учебник «Фармацевтическая химия», Часть 1. Общая фармацевтическая химия, Москва, «Высшая школа», 1993 (далее – [3]);

-патентный документ US 2006/0083693 A1, опублик. 20.04.2006 (далее – [4]).

В возражении, поданном в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса, заявитель привел уточненную формулу и новый технический результат, заключающийся в неожиданно высокой стабильности препарата при хранении, что обусловлено стабильностью супенсированных частиц соли формотерола на протяжении длительного периода времени

Заявитель обращает внимание на то, что именно сочетание супензии формотерола фумарата дигидрата и раствора беклометазона дипропионата составляет суть предложенной группы изобретений, отличает заявленные средства от известного из документа [1] и обеспечивает достижение нового неожиданного технического результата.

Заявителем обращает внимание на преимущество заявленного препарата по сравнению с известным из патентного документа [1] препаратом, представляющим собой сочетание формотерола фумарата в форме раствора и беклометазона дипропионата в форме раствора.

В возражении отмечено, что предложенные заявителем в независимых пунктах 1, 16, 17 технические решения не являются очевидными для специалиста, изучившего предшествующий уровень техники.

По мнению заявителя, объект изобретения «Применение беклометазона дипропионата в фармацевтическом аэрозольном препарате» (независимый пункт 23), также не является очевидным для специалистов, исходя из документов [1]-[4], поскольку редакция этого пункта формулы включает признаки независимого пункта 1 формулы.

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

С учетом даты подачи заявки (27.09.2010), правовая база для оценки патентоспособности заявленной группы изобретений включает Кодекс, Административный регламент исполнения Федеральной службой по интеллектуальной собственности, патентам и товарным знакам

государственной функции по организации приема заявок на изобретение и их рассмотрения, экспертизы и выдачи в установленном порядке патентов Российской Федерации на изобретение, утвержденного приказом Министерства образования и науки РФ от 29 октября 2008 № 327, зарегистрированного в Минюсте РФ 20 февраля 2009, рег. № 13413 (далее – Регламент ИЗ).

Согласно пункту 1 статьи 1350 Кодекса изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно пункту 2 статьи 1350 Кодекса, изобретение имеет изобретательский уровень, если для специалиста оно явным образом не следует из уровня техники. Уровень техники включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Согласно пункту 10.7.4.2 Регламента ИЗ в качестве аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений, ставших общедоступными до даты приоритета изобретения. В качестве наиболее близкого к изобретению аналога указывается тот, которому присуща совокупность признаков, наиболее близкая к совокупности существенных признаков изобретения.

В соответствии с подпунктом 1 пункта 10.8 Регламента ИЗ формула изобретения предназначается для определения объема правовой охраны, предоставляемой патентом.

Согласно подпункту 1 пункта 24.5.3 Регламента ИЗ, изобретение явным образом следует из уровня техники, если оно может быть признано созданным путем объединения, изменения или совместного использования сведений, содержащихся в уровне техники, и/или общих знаний специалиста.

Согласно подпункту 7 пункта 24.5.3 Регламента ИЗ в случае наличия в формуле изобретения признаков, в отношении которых заявителем не определен технический результат, или в случае, когда установлено, что

указанный им технический результат не достигается, подтверждения известности влияния таких отличительных признаков на технический результат не требуется.

Согласно пункту 4.9 Правил ППС при рассмотрении возражения коллегия вправе предложить лицу, подавшему заявку на выдачу патента на изобретение, внести изменения в формулу изобретения, если эти изменения устраняют причины, послужившие единственным основанием для вывода о несоответствии рассматриваемого объекта условиям патентоспособности.

Согласно пункту 5.1 Правил ППС в случае, если заявителем по предложению коллегии внесены изменения в формулу изобретения, решение должно быть принято с учетом результатов дополнительного информационного поиска, проведенного в полном объеме.

Сущность заявленной группы изобретений выражена в приведенной выше формуле.

Анализ доводов решения об отказе в выдаче патента и доводов лица, подавшего возражение, показал следующее.

Заявленная группа изобретений охарактеризована представленной выше формулой, содержащей четыре объекта: «Фармацевтический аэрозольный препарат, предназначенный для применения в дозирующих ингаляторах под давлением (ДИД)...» (независимые пункты 1, 16); «Дозирующий ингалятор под давлением...» (независимый пункт 17 формулы); «Применение беклометазона дипропионата в аэрозольном препарате для ДИД для ингаляции» (независимый пункт 23 формулы).

Из патентного документа [1] известно средство (фармацевтический аэрозольный препарат), которое рассматривается в качестве ближайшего аналога для изобретений по независимым пунктам 1, 16 формулы. Это средство применяют в дозирующих ингаляторах под давлением (см. пример 1). Известное из патентного документа [1] средство включает: не более 0,015% масс. формотерола фумарата в виде раствора (дигидрата); не более 0,4% масс. беклометазона дипропионата в виде раствора; от 0 до 25% масс.

этанола; единственный пропеллент R 134A (1,1,1,2-тетрафторэтан) и поверхностно-активное вещество Твин 80 (см. стр. 3 описания, формула, п.2, стр. 4, строки 10-28). Известное из документа [1] средство является стабильным (примеры 4,7, стр. 8, реферат, стр. 3, посл. абзац). Кроме того, из патентного документа [1] известен дозирующий ингалятор под давлением, включающий дозирующий клапан и контейнер, заполненный фармацевтическим средством, содержащим указанные выше ингредиенты (стр. 3, пример 1).

Средство по независимому пункту 1 формулы отличается от известного из документа [1] средства тем, что содержащийся в нем формотерол фумарат дигидрат является суспендированным (в микронизированном виде).

Средство по независимому пункту 16 формулы отличается от известного из документа [1] средства тем, что содержащийся в нем формотерол фумарат дигидрат является суспендированным, беклометазон дипропионат является полностью растворенным, средство обеспечивает доставку 6 мкг формотерола фумарата дигидрата и 100 мкг беклометазона дипропионата за одно приведение ингалятора в действие.

Ингалятор по независимому пункту 17 формулы отличается от известного из документа [1] ингалятора тем, что содержащийся в нем формотерол фумарат дигидрат является суспендированным.

Согласно описанию заявки, представленный на дату ее подачи технический результат заключается в обеспечении стабильности фармацевтического аэрозольного препарата, по меньшей мере, 35 месяцев (стр. 11 описания). Такая стабильность заявителем не продемонстрирована.

При этом из патентного документа [2] известно фармацевтическое средство, включающее формотерол фумарата дигидрат, беклометазон дипропионат, пропеллент и этанол. При этом средство находится в дозирующем ингаляторе под давлением, один из компонентов (формотерол

фумарата дигидрат) суспендирован, а второй (беклометазон) растворен (формула, п.п. 1, 3, 7, 18, 20, 21, примеры 1, 2).

Как уже говорилось выше, результатом от использования заявленной группы изобретений является увеличение срока годности препарата (его стабильности) на протяжении 35 месяцев (данный период в заявке не подтвержден). Однако, в описании заявки отсутствуют данные, подтверждающие возможность достижения данного результата.

При этом, из учебника [3] известно, что для вычисления срока годности препарата, время (срок) хранения препарата в экстремальных условиях (то есть, при повышенной температуре) умножают на коэффициент соответствия К (стр. 370-372). Расчеты, произведенные на основании представленных заявителем данных и на основании известных из учебника [3] сведений, свидетельствуют о том, что срок хранения заявленного препарата составит 240 суток:

$$T \text{ срок хранения} = T \text{ экспериментальный срок хранения} \times K = 60 \text{ суток} \times 4 = 240 \text{ суток.}$$

То есть, с учетом известных из источников информации [1]-[3] сведений (см. выше), для специалиста в данной области очевидна возможность создания стабильного фармацевтического препарата, использовав в нем формотерол в суспендированном виде и беклометазон в растворенном виде.

Вышеизложенное позволяет сделать вывод о правомерности сделанного в Решении об отказе вывода о несоответствии изобретений по независимым пунктам 1, 16 и 17 условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 23 формулы можно отметить следующее.

Из патентного документа [1] известно применение беклометазона дипропионата в аэрозольном препарате для дозирующих ингаляторах под давлением для ингаляции, включающем формотерола фумарата дигидрат в качестве активного ингредиента и носителя (ГФА 134 (1,1,1,2-

тетрафторэтан)) в смеси с этанолом в качестве носителя (стр. 3 описания, формула, п.2, стр. 4, строки 10-28).

Отличие изобретения по независимому пункту 23 формулы от решения по патентному документу [1] заключается в том, что бекламетазон дипропионат применяется для уменьшения растворимости формотерола фумарата дигидрата в указанном носителе, где носитель имеет полярность, выраженную в виде постоянной, значение которой находится в диапазоне от примерно 9,5 до примерно 11,0.

При этом, исходя из известного в патентном документе [1] состава аэрозольного препарата (см. выше), уменьшение растворимости соли формотерола в нем также будет достигаться, поскольку данное свойство обусловлено присутствием в препарате беклометазона дипропионата.

Из патентного документа [4] известно, что значение диэлектрической постоянной ГФА 134а больше или равно 9,5, а также известно использование носителя для улучшения химической стабильности препарата (формула, п.1, 10, 11, пар.0009). Поскольку значение диэлектрической постоянной носителя – величина постоянная, то она будет всегда присуща такому носителю.

Таким образом, вышеизложенное подтверждает сделанный в решении об отказе вывод о несоответствии изобретения по независимому пункту 23 формулы условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Таким образом, в возражении отсутствуют доводы, позволяющие признать заявленную группу изобретений в объеме приведенной выше формулы и с учетом указанного выше технического результата, патентоспособной.

В возражении заявителем приведена уточненная формула. Уточнение касается независимого пункта 23, а именно: «Применение беклометазона... в фармацевтическом аэрозольном препарате по любому из п.п. 1-16...для уменьшения растворимости указанной соли формотерола ...».

Заявитель также дополнительно указал на то, что предложенная группа изобретений обеспечивает срок годности препарата не менее года, поскольку

имеет место неожиданно высокая стабильность препарата при хранении (стр. 14 возражения).

Таким образом, хотя выше сделан вывод о непатентоспособности заявленной группы изобретений, данный вывод был сделан с учетом иного результата, чем указанный выше уточненный результат. Этот уточненный результат содержался в материалах заявки на дату ее подачи.

На основании этого, в соответствии с пунктом 5.1 Правил ППС материалы заявки были направлены для проведения дополнительного информационного поиска.

По результатам проведенного поиска был представлен 10.06.2016 отчет и заключение экспертизы, согласно которым группа изобретений, охарактеризованных в уточненной заявителем формуле, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В заключении приведены следующие источники информации:

- патентный документ RU № 2356537 C2, опубликован 27.05.2009 (далее – [1]);
- патентный документ US 20070218011 A1, опубликован 20.09.2007 (далее – [5]);
- учебник «Химия растворов», Издательство ТПУ, Томск, 2006 (далее – [6]).

При этом установлено следующее.

Из патентного документа [5] известен фармацевтический аэрозольный препарат, предназначенный для применения в дозирующих ингаляторах под давлением (ДИД). Данный препарат представляет собой композицию, включающую 0,001-0,1% масс формотерола фумарат дигидрата в виде суспензии, 1-8% масс этанола и пропеллент (формула, п.1, 10, 15, 17). Композиция может содержать беклометазон дипропионат в количестве 0,0781% масс в виде раствора (пар. 0015) и олеиновую кислоту (поверхностно-активное вещество) в количестве 0,01% масс или пропеллент (ГФА 134а или ГФА 227) (формула, п. 15). При этом композиция находится

под давлением в алюминиевом контейнере (пример 1, пар. 0056-0061). Композиция, известная из патентного документа [5] является высоко стабильной (пар. 0010, 0015).

В патентном документе [5] отмечено, что композиции дозирующих ингаляторов хранятся в контейнерах под давлением, оснащенных клапаном для высвобождения (пар. 0002). Клапан является дозирующим и предпочтительно отмеряет доставляемую дозу за одно приведение в действие (пар. 0050). Доставляемая доза это доза, достаточная для терапевтического эффекта, доставляемая доза высвобождается за одно приведение в действие дозирующего ингалятора (пар. 0023). Дозирующий ингалятор обеспечивает доставку 3-15 мкг формотерола фумарата дигидрата и 10-1000 мкг стероида (беклометазона дипропионата) за одно приведение в действие (формула, п. 23-24).

Изобретения по независимым пунктам 1, 16, 17 отличаются от описанного в документе [5] фармакологического средства тем, что формотерол имеет микронизированный вид.

Отличительный признак известен из патентного документа [1], где в один из вариантов выполнения аэрозольной композиции (пример 4) включает формотерола в микронизированном виде (см. пример 4).

Как указал заявитель, достижение технического результата обеспечивается сочетанием суспензии формотерола фумарата дигидрата и раствора беклометазона дипропионата (стр.13 возражения). Однако, указанное сочетание раскрыто в патентном документе [5] (см. выше). При этом достигается тот же технический результат, на который претендует заявитель, а именно, высокая стабильность (пар. 0010, 0015) при хранении композиции (в течение 6 месяцев).

Технический результат, заключающийся в обеспечении стабильности и увеличении срока годности (не менее года) препарата достигнут при использовании препарата, известного из патентного документа [1] (пример 4,

7, стр. 8, строки 24-33). Таким образом, достижение уточненного заявителем технического результата явным образом следует из документов [5] и [1].

В связи с изложенным, изобретения по независимым пунктам 1, 16, 17 уточненной формулы явным образом следуют для специалиста из уровня техники (документы [5], [1]) и не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» (п. 24.5.3 (1) Регламента ИЗ).

В качестве ближайшего аналога по отношению к изобретению, охарактеризованному в независимом пункте 23 уточненной формулы, в заключении указано средство, известное из документа [5], которое подробно рассмотрено выше. В данном документе [5] раскрыто применение беклометазона дипропионата в составе аэрозольной композиции, содержащей формотерола фумарат дигидрат, ГФА 134а и этанол. Причем беклометазон дипропионат находится в растворенном виде, а формотерола фумарат дигидрат суспендирован (формула, п. 1-2, 7, 15, 17, пример 1).

Как было указано выше, качественный и количественный состав фармацевтического средства, известного из документа [5] соответствует заявленному составу.

Таким образом, признак по независимому пункту 23 уточненной формулы «для уменьшения растворимости указанной соли формотерола в указанном носителе, где носитель имеет полярность, выраженную в виде диэлектрической постоянной  $E_m$ , значение которой находится в диапазоне от примерно 9,5 до примерно 11,0» будет присущ фармакологическому средству, известному из патентного документа [5].

Кроме того, на уменьшенную растворимость формотерола указывает то, что в средстве по патентному документу [5] формотерол содержится в суспендированном виде в противоположность беклометазону, который растворен.

Изобретение по независимому пункту 23 уточненной формулы отличается от технического решения, известного из патентного документа [5] тем, что формотерол находится «в микронизированном виде».

Данный отличительный признак известен из патентного документа [1], где говорится о том, что формотерол используется в микронизированном виде (пример 4).

Как было указано выше, достижение неожиданного технического результата, указанного заявителем в возражении, явным образом следует из патентных документов [5] и [1].

В отношении снижения растворимости формотерола, которая, в соответствии с доводами заявителя, обусловлена наличием растворенного беклометазона, также можно отметить следующее.

Из учебника [6] известно, что «на растворимость вещества влияет присутствие в растворе других растворенных веществ. В присутствии других веществ растворимость данного вещества обычно уменьшается» (стр. 20, абзац 2-ой).

Таким образом, изобретение по независимому пункту 23 уточненной формулы явным образом следует для специалиста из уровня техники, принимая во внимание сведения из документов [1], [5], [6], что не позволяет признать его соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень» (п. 24.5.3 (1) Регламента ИЗ).

Что касается признаков зависимых пунктов 2-15, 21-22 уточненной формулы, то они также известны из патентного документа [5], а именно известно: наличие в средстве формотерола фумарата дигидрата, стероида (например, беклометазон дипропионата), олеиновой кислоты в количестве 0,01% масс (см. формула и пример 1); концентрация формотерола фумарата дигидрата составляет 0,001-0,01 масс, концентрация беклометазона дипропионата составляет 0,0781 (пример 1); концентрация этанола составляет 1-8% масс, (формула); дозирующий ингалятор обеспечивает доставку 3-15 мкг формотерола фумарата дигидрата и 10-1000 мкг стероида

(беклометазона) за одно приведение в действие (формула); композиция предназначена для лечения хронической обструктивной болезни легких или астмы (параграф 0051).

Признаки зависимых пунктов 18-20 уточненной формулы также известны из патентного документа [5], где контейнер выполнен из алюминия (формула); клапан обеспечивает доставку 20-150 микролитров (параграф 0050).

Таким образом, сведения, содержащиеся в источниках информации [1],[5],[6], представленных по результатам дополнительного информационного поиска позволяют признать группу изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1, 16, 17, 23 уточненной заявителем формулы несоответствующей условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Таким образом, изменения, внесенные заявителем в уточненную в возражении формулу и приведение уточненного технического результата, не устраняют причин, послуживших основанием для вывода о несоответствии предложенной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень».

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

**отказать в удовлетворении возражения, поступившего 19.05.2015, решение Роспатента от 25.11.2014 оставить в силе.**