

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 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 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» (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, регистрационный № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение Сьюджен ЛЛС, США (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее 03.10.2018, против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2567535, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2567535 на группу изобретений «Кристаллическая ϵ -модификация N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(Z)-(5-фтор-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамидмалата, способ ее получения и фармацевтическая композиция на ее основе» выдан по заявке № 2014139611 с приоритетом от 01.10.2014, на имя Михайлова Олега Ростиславовича (далее – оспариваемый патент).

В настоящее время, согласно договору № РД0247088 от 23.03.2018 (см. Бюл. № 09) об отчуждении исключительного права, патентообладателем является ООО «Натива» (далее – патентообладатель).

Оспариваемый патент действует со следующей формулой:

«1. Кристаллическая ϵ -модификация N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(Z)-(5-фтор-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамид малата, характеризующаяся следующим набором межплоскостных расстояний (d, Å) и соответствующих им интенсивностей (Iотн., %): 15,055 - 40,9%; 14,655 - 45,8%; 11,343 - 68,7%; 10,608 - 41,7%; 9,616 - 58,1%; 9,412 - 45,2%; 7,886 - 32,0%; 7,386 - 40,2%; 7,206 - 76,3%; 7,069 - 47,1%; 6,387 - 50,4%; 6,123 - 86,5%; 5,299 - 46,5%; 5,158 - 45,8%; 5,064 - 42,1%; 4,876 - 45,4%; 4,702 - 50,4%; 4,600 - 49,8%; 4,375 - 46,7%; 4,337 - 47,7%; 4,263 - 43,2%; 4,122 - 43,1%; 4,051 - 47,3%; 3,910 - 59,7%; 3,782 - 71,2%; 3,677 - 57,5%; 3,592 - 57,3%; 3,522 - 51,7%; 3,434 - 48,8%; 3,335 - 73,7%; 3,268 - 100,0%; 3,224 - 92,9%; 3,170 - 63,3%; 3,043 - 35,3%; 2,964 - 30,9%; 2,825 - 32,0%; 2,545 - 26,6%; 2,459 - 24,9%; 2,245 - 19,7%; 2,041 - 19,5%; 1,924 - 19,5%; 1,646 - 18,5%.

2. Способ получения кристаллической ϵ -модификации N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(Z)-(5-фтор-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамид малата по п. 1, характеризующийся тем, что приготовленный при 25-100°C водный раствор сунитиниба малата замораживают при скорости охлаждения не ниже 60 град/мин и после сублимационной сушки полученный порошок отжигают при температурах от 70 до 150°C в течение 20-40 часов.

3. Способ по п. 2, характеризующийся тем, что сублимационную сушку замороженного водного раствора сунитиниба малата проводят при температурах: на конденсаторе -48...-56°C; на продукте -196...+30°C и остаточном давлении в камере (9-5)Ч10-2 Торр в течение 22-26 ч.

4. Применение кристаллической ϵ -модификации N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(Z)-(5-фтор-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамид малата по п. 1 для приготовления фармацевтической композиции в качестве противоопухолевого средства, ингибитора тирозинкиназ для лечения онкологических заболеваний,

содержащей терапевтически эффективное количество кристаллической ϵ -модификации N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(Z)-(5-фтор-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамид малата по п. 1 и, по меньшей мере, один фармацевтически приемлемый носитель, разбавитель, вспомогательное вещество или наполнитель».

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 указанного выше Гражданского кодекса было подано возражение, мотивированное несоответствием документов заявки на изобретение по пунктам 1, 2 и 4 формулы по оспариваемому патенту, представленных на дату ее подачи, требованию раскрытия сущности изобретения с полнотой, достаточной для осуществления изобретения специалистом в данной области техники, несоответствием группы изобретений по пунктам 1, 2 и 4 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», а также несоответствием группы изобретений по пунктам 1 и 4 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна».

К возражению приложены копии следующих источников информации:

- евразийский патент № ЕА 6445, дата публикации 29.12.2005 (далее – [1]);
- учебник Штольц А. К. и др., «Рентгеновский фазовый анализ», Екатеринбург, Издательство ГОУ-ВПО УГТУ-УПИ, 2005, с. 1-25 (далее – [2]);
- методические указания Г.А. Кузнецова, «Качественный рентгенофазовый анализ», ГОУ ВПО Иркутский Государственный Университет, Иркутск, 2005, на 28 л. (далее – [3]);
- учебное пособие Чижов П. и др., «Приборы и методы рентгеновской и электронной дифракции», Московский физико-технический институт, Москва, 2001, (далее – [4]).

Суть представленных в возражении доводов сводится к следующему.

В описании к оспариваемому патенту отсутствуют сведения о средствах и методах, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в каждом из пунктов 1-4 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту.

В частности, у лица, подавшего возражение, сомнение вызывает достаточность раскрытия характеристики полученной кристаллической ϵ -модификации N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(Z)-(5-фтор-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамида малата, имеющего международное непатентованное наименование сунитиниб малат (далее – сунитиниб малат). В описании оспариваемого патента не раскрыты характерные пики полученной кристаллической формы, а по мнению лица, подавшего возражение, таких наиболее интенсивных характерных пиков должно быть не менее трех, для того чтобы отличить одну форму от другой. В подтверждение данного мнения в возражении, приведен учебник [2] и методические указания [3]. В возражении отмечено, что набора из 43 значений для углов 2θ , соответствующих им относительных интенсивностей и рассчитанных межплоскостных расстояний недостаточно для объективной характеристики, полученной кристаллической формы сунитиниба малата. Кроме того, представленная на рис.6 к оспариваемому патенту, дифрактограмма, характеризуется избыточным уровнем шума прибора, что приводит к невозможности определения ложных пиков и малых пиков. Поэтому, по мнению лица, подавшего возражение, характеристика новой кристаллической модификации через приведенные значения для относительных интенсивностей и рассчитанные значения межплоскостных расстояний не может считаться достоверной и достаточной для характеристики кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата. Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что «сущность кристаллической модификации сунитиниба малата, запатентованной согласно пункту 1 и упомянутой в пунктах 2 и 4 формулы оспариваемого патента, не раскрыта в описании патента так, чтобы обеспечить ее понимание и осуществление в том виде, как она приведена в формуле изобретения».

Относительно способа по пункту 2 формулы оспариваемого патента лицо, подавшее возражение, добавляет, что в описании оспариваемого патента приведена только одна дифрактограмма, соответствующая данным для углов 2θ

и относительных интенсивностей, при этом четыре различных образца (четыре примера получения) не могут характеризоваться в точности такой одной и той же дифрактограммой.

Относительно объекта «применения» по пункту 4 формулы оспариваемого патента лицо, подавшее возражение добавляет, что в описании оспариваемого патента «не содержится сведений, подтверждающих возможность использования полученной запатентованной в пункте 1 формулы кристаллической модификации сунитиниба малата в составе фармацевтической композиции и для приготовления фармацевтической композиции, где стабильность компонентов является необходимым условием». Таким образом, в возражении отмечено, что «описание оспариваемого патента не содержит сведений, достаточных для того, чтобы показать, что назначение изобретения по пункту 4 формулы (приготовление противоопухолевой фармацевтической композиции) действительно достигается».

В отношении несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость» лицо, подавшее возражение, обращает внимание на то, что в описании к оспариваемому патенту не приведены средства и методы для проведения дифракционного анализа и обработки полученных дифракционных данных для получения значений межплоскостных расстояний и относительных интенсивностей, которыми охарактеризована кристаллическая ϵ -модификация сунитиниба малата.

В частности, по мнению лица, подавшего возражение, отсутствуют сведения о способе приготовления образца порошка исследуемого вещества для рентгено-фазного анализа (РФА) и сведения о режиме работы дифрактометра. В подтверждение мнения о том, что наличие упомянутых сведений необходимо, лицо, подавшее возражение, приводит источники информации [1], [2], [3] и [4].

В оспариваемом патенте, по мнению лица, подавшего возражение, отсутствуют данные, подтверждающие осуществление способа получения ϵ -модификации сунитиниба малата. Так, в возражении отмечено, что в описании

к оспариваемому патенту не содержится никаких данных, которые позволили бы приготовить такую же кристаллическую модификацию, которая имела бы точно такие характеристики, которые приведены в пункте 1 формулы оспариваемого патента. В описании к оспариваемому патенту содержится четыре примера, иллюстрирующих получение четырех образцов продукта, но только одна дифрактограмма.

Кроме того, в возражении отмечено, что в оспариваемом патенте отсутствуют какие-либо данные, доказывающие, что назначение кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата (для приготовления противоопухолевой фармацевтической композиции для лечения онкологических заболеваний) действительно достигается в случае осуществления изобретения.

В отношении несоответствия условию патентоспособности «новизна» изобретений по пунктам 1 и 4 формулы оспариваемого патента в возражении отмечено следующее.

Из евразийского патента [1] известны кристаллические модификации того же самого вещества - сунитиниба малата. По мнению лица, подавшего возражение, кристаллическая форма II сунитиниба малата, известная из евразийского патента [1] идентична кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата, раскрытой в пункте 1, формулы оспариваемого патента. В возражении отмечено, что кристаллическая ϵ -модификация сунитиниба малата не может быть расценена как отличная от кристаллической формы II сунитиниба малата из евразийского патента [1], т.к. основные пики визуализируемые на дифрактограммах данных форм совпадают. Кроме того, обе формы имеют ту же самую температуру плавления (181°C).

Пункт 4 формулы оспариваемого патента не является новым, поскольку, по мнению лица, подавшего возражение, из евразийского патента [1] известно применение кристаллических модификаций сунитиниба малата, в частности «формы II» в качестве противоопухолевого средства, ингибитора тирозинкиназ для лечения онкологических заболеваний, содержащего терапевтически эффективное количество сунитиниба малата и, по меньшей мере, один

фармацевтически приемлемый носитель, разбавитель, вспомогательное вещество или наполнитель. Поскольку, по мнению лица, подавшего возражение, ϵ -модификация сунитиниба малата, раскрытая в пункте 1 формулы оспариваемого патента не является новой и не раскрыты какие-либо иные характеристики, «которые могли бы придать новизну с точки зрения использования в лекарственном продукте», то пункт 4 формулы также не соответствует условию патентоспособности «новизна».

Второй экземпляр возражения в установленном порядке был направлен в адрес патентообладателя.

Отзыв от патентообладателя по мотивам возражения был представлен на заседании коллегии, состоявшемся 26.11.2018.

В своем отзыве патентообладатель отмечает, что в описании к оспариваемому патенту приведена цель изобретения, заключающаяся «в создании новой, не известной ранее, кристаллической ϵ -модификации N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(Z)-(5-фтор-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамид малата, разработка способа ее получения и применение ее в фармацевтической композиции в качестве противоопухолевого средства, ингибитора тирозинкиназ для лечения онкологических заболеваний». Кроме того, описана совокупность существенных признаков, которая обеспечивает технический результат. Представлено достаточное количество примеров, касающихся, как получения новой формы сунитиниба малата, так и композиции на ее основе. Приведен рентгенофазный анализ (РФА), проведенный в стандартных условиях, фиксирующих углы 2θ и их интенсивность. Последующая обработка РФА, как указывает патентообладатель, проведена с помощью широко известных компьютерных программ «Origin» или «Microsoft Office Excel». Получена дифракционная картина, которая, по мнению патентообладателя, является «паспортом» химического соединения, по которому можно установить, какому из уже известных соединений она может соответствовать. При этом

патентообладатель отмечает, что абсолютно каждый дифракционный максимум является характерным пиком. Полученные дифракционные характеристики сунитиниба малата представлены в виде межплоскостных расстояний и соответствующих им интенсивностей. Именно такими характеристиками, как указывает патентообладатель, характеризуют любые кристаллические вещества при включении их в международные базы.

По мнению патентообладателя, кристаллическая ϵ -модификация сунитиниба малата по оспариваемому патенту отличается от всех известных в уровне техники кристаллических форм сунитиниба малата, именно совокупностью углов 2θ и рассчитанных межплоскостных расстояний и соответствующих им относительных интенсивностей.

Кроме того, патентообладатель отмечает, что четыре примера получения одной и той же кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата по оспариваемому патенту необходимы для определения граничных условий режимов, указанных в способе получения ϵ -модификация сунитиниба малата.

В своем отзыве, патентообладатель отмечает, что «нет причин считать ϵ -модификации сунитиниба малата нестабильной», т.к. эксперименты, проведенные методом ВЭЖХ свидетельствуют о том, что распада оспариваемой кристаллической формы не происходит.

Также, по мнению патентообладателя, реализация назначения подтверждена экспериментами на кроликах, которые показали улучшение биологической доступности. Кроме того, по мнению патентообладателя, «нет оснований полагать, что новая форма по оспариваемому патенту не окажет свое известное противоопухолевое действие».

Для убедительности своих доводов, изложенных в отзыве, патентообладатель ссылается на источники информации, при этом цитируемые источники к отзыву не приложены.

Лицом, подавшим возражение, представлены дополнения к возражению, которые поступили 25.12.2018.

Дополнения к возражению, по существу являются пояснениями к доводам, изложенным ранее в возражении. К дополнению к возражению приложены копии следующих источников информации:

- статья Sarsfield B.A. et al., «Powder X-Ray diffraction detection of crystalline phases in amorphous farmaceuticals», International Centre for Diffraction., 2006, p.p. 322-327 (далее – [5]);
- статья Chris J. «Gilmore X-Ray Diffraction» Solid State Characterization of Pharmaceuticals, First Edition., Blackwell Publishing Ltd., 2011, p.p. 56-60, 65-68. (далее – [6]);
- общая фармакопейная статья ОФС.1.1.0017.15 «Полиморфизм», Государственная фармакопея Российской Федерации, XII Издание, том 1, Москва, 2015 (далее – [7]);
- общая фармакопейная статья ОФС.1.1.0018.15 «Кристалличность», Государственная фармакопея Российской Федерации, XIII издание, том 1, Москва, 2015 (далее – [8]);
- общая фармакопейная статья ОФС.1.2.1.1.0011.15 «Рентгеновская порошковая дифрактометрия», Государственная фармакопея Российской Федерации, XIII издание, том 1, Москва, 2015 (далее – [9]);
- общая фармакопейная статья ОФС.1.2.1.2.0001.15 «Хроматография», Государственная фармакопея Российской Федерации, XIII издание, том 1, Москва, 2015 (далее – [10]);
- European Pharmacopoeia, 8.0 Edition, 15.07.2013, p.p.339-343, 685, 723 (далее – [11]).

Так, для лучшего понимания довода о различиях в интенсивности характерных пиков и «шумов» на дифрактограмме, лицо, подавшее возражение, приводит статью [5] и статью [6].

В подтверждение своего довода о том, что для четырех примеров получения должны быть приведены четыре дифрактограммы, лицо, подавшее возражение приводит общие фармакопейные статьи [7], [8] и европейскую фармакопейную статью [11].

Лицо, подавшее возражение в дополнениях выражает несогласие с мнением патентообладателя о том, что РФА проводятся в стандартных условиях. Так, по мнению лица, подавшего возражение из уровня техники [5], известно, что метод анализа подбирается в зависимости от природы исследуемого образца.

Свое мнение о том, что форма II, известная из евразийского патента [1], идентична ϵ -модификации сунитиниба малата по оспариваемому патенту, лицо, подавшее возражение, как изложено выше, основывает на совпадении характеристических пиков. В подтверждение своего мнения, в дополнении к возражению, приведена общая фармакопейная статья [9] и европейская фармакопейная статья [11].

Федеральной службой по интеллектуальной собственности (далее – Роспатент) было принято решение от 12.02.2019: отказать в удовлетворении возражения, поступившего 03.10.2018, патент Российской Федерации на изобретение №2567535 оставить в силе.

Не согласившись с решением Роспатента от 12.02.2019 лицо, подавшее возражение, обратилось в Суд по интеллектуальным правам (далее СИП) с заявлением о признании упомянутого решения Роспатента недействительным. Решением СИПа от 26.03.2020 по делу № СИП-279/2019 требования лица, подавшего возражение, были удовлетворены и решение Роспатента от 12.02.2019 признано недействительным.

На данное решение Роспатентом была подана кассационная жалоба в Президиум Суда по интеллектуальным правам, по результатам рассмотрения которой Президиум Суда по интеллектуальным правам своим постановлением от 10.07.2020 по делу № СИП 279/2019 отказал в удовлетворении кассационной жалобы, решение СИП от 26.03.2020 по делу № СИП-279/2019 оставил без изменений, кассационную жалобу Роспатента – без удовлетворения.

Из решения СИПа от 26.03.2020 следует, что при принятии решения от 12.02.2019 Роспатентом при оценке соответствия группы изобретений по

оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» не было учтено, что дифрактограмма кристаллической формы сунитиниб малата по оспариваемому патенту содержит посторонние сигналы, а именно фоновый сигнал, шум детектора, сигнал от наличия рентгено-аморфной фазы вещества, возможных примесей и т.д. Кроме того, Роспатентом не учтено, что пик на 3 градусах угла 2θ присущ кристаллической ϵ -модификации сунитиниб малата по оспариваемому патенту. В этой связи Роспатентом не выявлено, что кристаллическая ϵ -модификация сунитиниб малата по оспариваемому патенту имеет 8 характеристических пиков, которые раскрыты для кристаллической формы II сунитиниб малата в евразийском патенте [1]. Данные выводы в решении СИПа от 26.03.2020 сделаны в соответствии с консультацией советника СИП специалиста Яковлева Р.Ю. и ответами на судебные запросы Лаборатории рентгеноструктурных исследований (ЛРСИ) Федерального государственного бюджетного учреждения науки Институт элементоорганических соединений им. А.Н. Несмеянова РАН (далее - ЛРСИ ИНЭОС РАН) и Московского государственного университета имени М.В. Ломоносова (далее — МГУ).

Соответствующие выводы содержатся также в постановлении президиума Суда по интеллектуальным правам от 10.07.2020.

От лица, подавшего возражение, в корреспонденции от 06.10.2020 поступило дополнение к возражению, к которому приложены расшифровка (стенограмма) консультации специалиста Яковлева Р.Ю. (Приложения 3, 4), а также ответы на запросы СИПа, полученные из МГУ (Приложение 5) и из ЛРСИ ИНЭОС РАН (Приложение 6). При этом доводы технического характера в дополнении к возражению по существу повторяют доводы возражения и доводы, изложенные в решении СИПа от 26.03.2020 по делу № СИП-279/2019.

Патентообладателем, на заседании коллегии, состоявшемся 08.10.2020, для сведения были представлены «Письменные объяснения в порядке статьи 81 АПК РФ», которые ранее были представлены в СИП.

Кроме того, патентообладателем в корреспонденции от 30.10.2020 представлено мнение, доводы технического характера которого по существу повторяют доводы, изложенные им ранее в пояснениях к решению СИП от 26.03.2020.

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

С учетом даты подачи заявки (01.10.2014), по которой выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности изобретения по упомянутому патенту 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 является новым, если оно не известно из уровня техники.

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

Согласно пункту 4 статьи 1350 Кодекса изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности или в социальной сфере.

Согласно пункту 2 статьи 1375 Кодекса заявка на изобретение должна содержать: описание изобретения, раскрывающее его сущность с полнотой,

достаточной для осуществления изобретения специалистом в данной области техники; формулу изобретения, ясно выражающую его сущность и полностью основанную на его описании; чертежи и иные материалы, если они необходимы для понимания сущности изобретения.

Согласно пункту 2 статьи 1386 Кодекса экспертиза заявки на изобретение по существу включает, в частности, проверку достаточности раскрытия сущности заявленного изобретения в документах заявки, предусмотренных подпунктами 1-4 пункта 2 статьи 1375 Кодекса (см. выше) и представленных на дату ее подачи, для осуществления изобретения специалистом в данной области техники.

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

В соответствии с пункта 24.5 Регламента изобретение проверяется на соответствие его условиям промышленной применимости, новизны и изобретательского уровня (пункты 24.5.1 - 24.5.3 Регламента).

В соответствии с подпунктом 2 пункта 24.5.1 Регламента 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).

Кроме того, проверяется, приведены ли в указанных документах, содержащихся в заявке на дату подачи, 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.

Если о возможности осуществления изобретения и реализации им указанного назначения могут свидетельствовать лишь экспериментальные данные, проверяется наличие в описании изобретения примеров его осуществления с приведением соответствующих данных, а также устанавливается, являются ли приведенные примеры достаточными, чтобы вывод о соблюдении указанного требования распространялся на разные частные формы реализации признака, охватываемые понятием, приведенным заявителем в формуле изобретения.

Согласно подпункту 3 пункта 24.5.1 Регламента, 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.

Согласно подпункту 1 пункта 24.5.2. Регламента проверка новизны изобретения проводится в отношении всей совокупности признаков изобретения, содержащихся в независимом пункте формулы.

Согласно подпункту 4 пункта 24.5.2. Регламента изобретение признается известным из уровня техники и не соответствующим условию новизны, если в уровне техники раскрыто средство, которому присущи все признаки изобретения, выраженного формулой, предложенной заявителем.

Химическое соединение, подпадающее под общую структурную формулу группы известных соединений, признается новым, если оно не раскрыто как таковое и отсутствуют какие-либо сведения относительно исходных соединений, способа его получения или его свойств.

Согласно подпункту 6 пункта 24.5.2. Регламента если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, содержащей

зависимые пункты, соответствует условию новизны, то анализ уровня техники в отношении зависимых пунктов не проводится.

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

Анализ доводов сторон с учетом доводов, изложенных в решении СИПа от 26.03.2020 по делу № СИП-279/2019 о несоответствии группы изобретений по независимым пунктам 1, 2 и 4 условию патентоспособности «промышленная применимость», несоответствии группы изобретений по независимым пунктам 1 и 4 формулы условию патентоспособности «новизна» и о недостаточности раскрытия сущности группы изобретений по оспариваемому патенту с полнотой, достаточной для осуществления этих изобретений специалистом в данной области техники, показал следующее.

Свое решение СИП основывало на разъяснениях привлеченного к делу советника СИП специалиста Яковлева Р.Ю. и ответах на судебные запросы ЛРСИ ИНЭОС РАН и МГУ. При этом в решении СИП от 26.03.2020 указано, что изобретение по Патенту Российской Федерации № 2567535 на группу изобретений «Кристаллическая ε-модификация N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(Z)-(5-фтор-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамид малата, способ ее получения и фармацевтическая композиция на ее основе» не соответствует пунктам 2 и 4 статьи 1350 и пункту 2 статьи 1375 Гражданского кодекса Российской Федерации.

Поскольку в своем решении СИП обязал Роспатент устранить допущенные нарушения прав и законных интересов заявителя и рассмотреть возражение повторно с учетом его решения, то в настоящем заключении необходимо отразить мотивы, связанные с несоответствием группы изобретений по патенту РФ № 2567535 условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и требованию раскрытия сущности изобретения в описании с полнотой, достаточной для осуществления изобретения специалистом в данной области техники. Указанные мотивы необходимо рассмотреть с учетом разъяснений привлеченных к делу советника СИП специалиста Яковлева Р.Ю. и ответов на

судебные запросы ЛРСИ ИНЭОС РАН и МГУ, которые содержатся в решении СИП от 26.03.2020.

Пункт 24.5 Регламента ИЗ устанавливает последовательность проверки на соответствие условиям патентоспособности заявляемого предложения, и такая последовательность включает оценку соответствия изобретения условиям «промышленной применимости», «новизны», «изобретательского уровня».

Таким образом, в настоящем заключении анализируется предложенная группа изобретений по Патенту Российской Федерации № 2567535 в следующем порядке: проверка соответствия условию патентоспособности «промышленная применимость», «новизна».

Анализ доводов, касающихся оценки соответствия группы изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1, 2 и 4 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», показал следующее.

Как упомянуто выше, изобретение по п. 1 формулы по оспариваемому патенту относится к кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата, характеризующейся определенным набором межплоскостных расстояний (d , $^{\circ}\text{A}$) и соответствующих им интенсивностей (Iотн., %), изобретение по п.4 формулы относится к применению формы, охарактеризованной в п.1 в качестве противоопухолевого средства, ингибитора тирозинкиназ для лечения онкологических заболеваний (см. формулу изобретения).

При этом кристаллическая форма по независимому пункту 1, характеризуется 42 значениями межплоскостных расстояний (d) и относительных интенсивностей (Iотн.).

В качестве подтверждения соответствия заявленной кристаллической формы условию патентоспособности «промышленная применимость» в описании оспариваемого патента в качестве доказательства получения указанной кристаллической формы приведены способы ее получения (примеры 1-4), спектры ЯМР, термограмма и дифрактограмма (фигура 2,4,6),

Однако, экспертные заключения специалиста Яковлева Р.Ю. и ученых ЛРСИ ИНОЭС РАН и МГУ, приведенные в решении СИП от 26.03.2020, указывают, что из 42 включенных в формулу группы изобретений по оспариваемому патенту значений межплоскостных расстояний (d) и относительных интенсивностей (Iотн.), большая часть представляет собой сигналы шума и не характеризуют полученную кристаллическую ϵ -модификацию сунитиниба малата. При этом и специалист и ученые отметили низкое качество дифрактограммы, приведенной в описании к оспариваемому патенту, не позволяющих рассчитать межплоскостные расстояния, соответствующие кристаллической структуре фазы.

В соответствии с вышеизложенным, следует сделать вывод о том, что невозможно получить кристаллическую ϵ -модификацию сунитиниба малата по оспариваемому патенту, которая характеризовалась бы всеми 43 пиками, как указано в независимых пунктах 1 и 2 формулы, включая характеризующие посторонние сигналы, и тем самым осуществить изобретение и реализовать указанное назначение. Соответственно невозможно и применение по независимому пункту 4 формулы.

Следует констатировать, что с учетом изложенных доводов группа изобретений по оспариваемому патенту не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (п.4 статьи 1350 Кодекса).

Что касается анализа доводов в отношении соответствия группы изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1 и 4 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» ввиду известности технического решения из евразийского патента [1], то он показал следующее.

Изобретение по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту относится к кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата, характеризующейся определенным набором межплоскостных расстояний (d , Е) и соответствующих им интенсивностей (Iотн., %), изобретение по п.4 формулы относится к применению формы, охарактеризованной в независимом пункте 1, в качестве противоопухолевого средства, ингибитора тирозинкиназ для лечения онкологических заболеваний (см. формулу изобретения).

Из евразийского патента [1] известна кристаллическая форма II, представляющая собой кристаллическую соль N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(5-фторо-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамид с яблочной кислотой, которая применяется в качестве противоопухолевого средства, ингибитора тирозинкиназ для лечения онкологических заболеваний, таких как рак в виде солидной опухоли или лейкозов.

Специалисту в данной области техники известно, что соль соединения с яблочной кислотой имеет наименование малат. При этом соединение N-[2-(диэтиламино)этил]-5-[(5-фторо-1,2-дигидро-2-оксо-3H-индол-3-илиден)метил]-2,4-диметил-1H-пиррол-3-карбоксамид малат является сунитиниб малатом. В соответствии с изложенным далее в отношении формы вещества по независимым пунктам формулы группы изобретений будет использоваться определение «кристаллическая ϵ -модификация сунитиниб малата».

Для кристаллической формы II сунитиниб малата в описании к евразийскому патенту [1] указано, что «данный кристалл имеет характеристические дифракционные пики вблизи приблизительно 3.0 и 27.7 градуса два-тета, более предпочтительно вблизи приблизительно 3.0, 12.1, 14.5 и 27.7 градуса два-тета и наиболее предпочтительно, как перечислено в табл. 1 для кристаллической формы II на порошковой рентгеновской дифрактограмме» (с.1 последний абзац – с.2 первый абзац).

На фиг. 2 евразийского патента [1] показана порошковая рентгеновская дифрактограмма для кристаллической формы II сунитиниба малата. При этом, характеристические дифракционные пики перечислены в табл. 1 (с.7 описания евразийского патента [1]) для кристаллической формы II сунитиниб малата.

Здесь следует отметить, что в описании оспариваемого патента также приводятся сведения для одиннадцати известных из уровня техники кристаллических форм, их дифракционные пики перечислены в таблице 1 оспариваемого патента (с.27-28), в том числе, для кристаллической формы II сунитиниб малата, известной из евразийского патента [1].

В соответствии с пояснениями специалиста Яковлева Р.Ю., приведёнными в решении СИПа от 26.03.2020, дифрактограмма известной из противопоставленного евразийского патента [1] кристаллической формы II сунитиниба малата совпадает, в части 8 четких максимумов, с дифрактограммой кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата, представленной в оспариваемом патенте.

Также в решении разъяснено, что остальные значения межплоскостных расстояний (d) и соответствующих им интенсивностей ($I_{\text{отн.}}$), указанных в независимом пункте 1 формулы, не являются дифракционными максимумами, а представляют собой посторонние сигналы, а именно фоновый сигнал, шум детектора, сигнал от наличия рентгено-аморфной фазы вещества, возможных примесей и т.д.

Целесообразно отметить, что дифрактограмма сама по себе не является признаком формулы, характеризующим кристаллическую ϵ -модификацию сунитиниба малата по оспариваемому патенту. В формуле группы изобретений кристаллическая ϵ -модификация сунитиниба малата характеризуется набором межплоскостных расстояний (d , Å) (рассчитывающихся в соответствии с условием Брэгга-Вульфа, которое позволяет определить межплоскостные расстояния d в кристалле, так как длина волны известна, а углы θ измеряются экспериментально) и соответствующих им интенсивностей ($I_{\text{отн.}}$, %).

Поэтому для наглядности ниже представлены дифрактограмма кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата по оспариваемому патенту (рис.6) и формы II сунитиниба малата, известного из евразийского патента [1] (фиг.2).

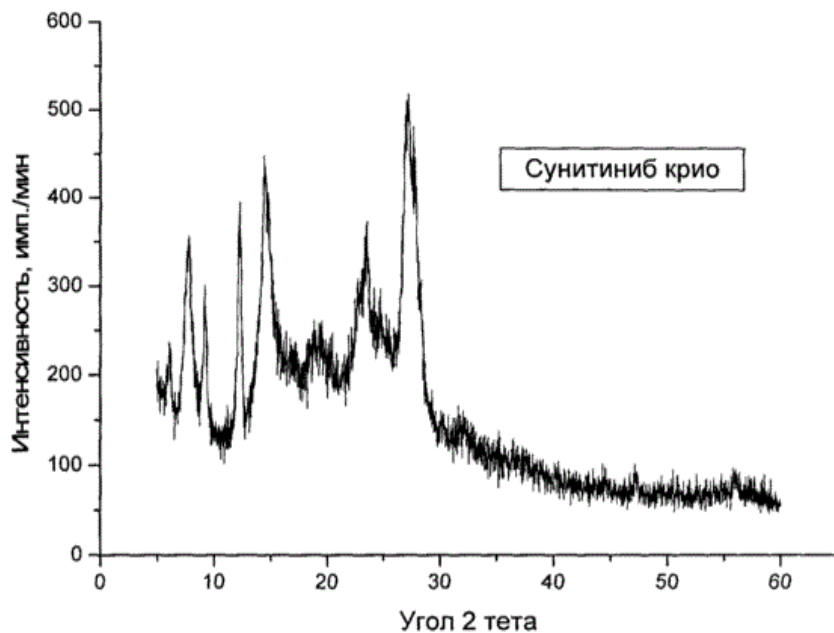
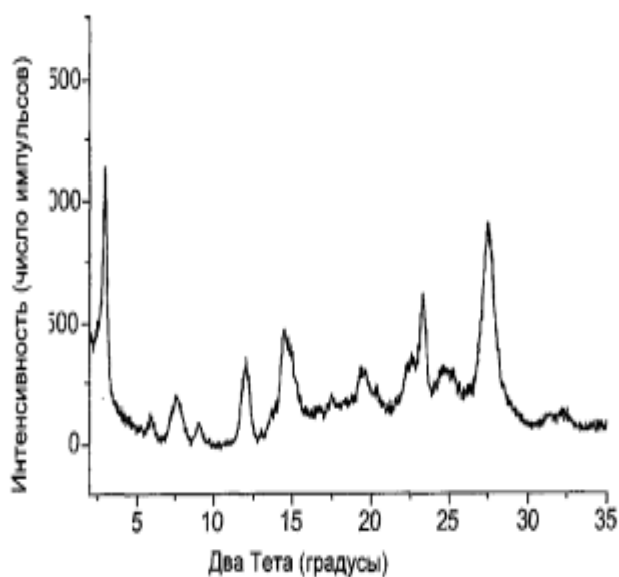


Рис. 6



Фиг. 2

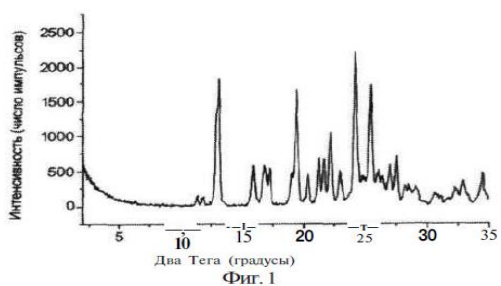
Согласно решению СИП от 26.03.2020 специалист Яковлев Р.Ю. пояснил, что для специалиста очевидна максимальная близость значений, которые если и отличаются, то на величину погрешности, а невозможность корректно идентифицировать пики дифракционных максимумов обусловлена некачественной дифрактограммой, приведенной в спорном патенте, не позволяющей специалисту точно определить величину максимума. При этом специалист пояснил, что

одинаковый общий вид сравниваемых дифрактограмм свидетельствует об одинаковой кристаллической структуре.

Как изложено в решении СИП от 26.03.2020, в ответах ЛРСИ ИНОЭС РАН и МГУ на судебный запрос также указано на возможность идентификации не более чем 8 четких и нескольких нечетких пиков, при этом остальные значения межплоскостных расстояний (d) и соответствующих им интенсивностей ($I_{отн.}$), указанные в оспариваемом патенте как дифракционные пики, обусловлены автоматической выдачей компьютерной программы и наличием сигнала фона и сигнала от наличия аморфной фазы вещества и других примесей.

В отношении отсутствия пика на 3 градусах угла 2θ на дифрактограмме кристаллической ϵ -модификации сунитиниб малата по оспариваемому патенту, который указан в качестве характеристического и присутствует в известной из евразийского патента [1] кристаллической форме II сунитиниба малата, в решении СИП отмечено, что данный факт не может повлиять на вывод об отсутствии новизны у запатентованной модификации.

Вместе с тем другим кристаллическим модификациям сунитиниба малата, раскрытым в евразийском патенте [1] (см.ниже фиг.1, дифрактограмма Формы I сунитиниба малата), не присуще наличие пика при значении угла 2θ меньше 5 градусов



Однако, по мнению специалиста Яковлева Р.Ю., отсутствие отражения в представленной в оспариваемом патенте дифрактограмме ϵ -модификации сунитиниба малата данных до 5 градусов зависит не от прибора или особенностей кристаллического вещества, а от патентообладателя, представившего экспериментальные данные. Специалист предположил, что дифрактограмма до 5 градусов угла 2θ была «обрезана».

Таким образом, основываясь на заключениях специалиста Яковлева Р.Ю. и ответах на судебные запросы ЛРСИ ИНЭОС РАН и МГУ, приведенных в решении СИПа от 26.03.2020, следует сделать вывод, что известной из противопоставленного евразийского патента [1] кристаллической форме II сунитиниба малата присущи все характеристические дифракционные максимумы кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата по оспариваемому патенту.

Следует отметить, что в решении СИПа от 26.03.2020 и в материалах возражения отсутствуют расчеты значений межплоскостных расстояний, которые являются признаками, характеризующими кристаллическую ϵ -модификацию сунитиниба малата в формуле оспариваемого патента. Несмотря на это, на основании упомянутого выше вывода, сделанного в решении СИП, можно констатировать, что ϵ -модификация сунитиниба малата известна из евразийского патента [1], поскольку ей присущи 8 пиков известной формы II сунитиниба малата.

В отношении разницы в температурах плавления кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата по оспариваемому патенту и известной из евразийского патента [1] кристаллической формы II сунитиниба малата, целесообразно отметить, что в решении СИП указано, что изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента не охарактеризовано при помощи температуры плавления, она не является признаком изобретения, и, как следствие, при установлении соответствия оспариваемого изобретения условию патентоспособности «новизна» сравнение температур плавления кристаллической ϵ -модификации сунитиниба малата и известных кристаллических форм не требуется.

Таким образом, изобретение по независимым пунктам 1 и 4 формулы оспариваемого патента не соответствует условию патентоспособности «новизна» (пункт 1 статьи 1350 Кодекса).

В связи со сделанным выше выводом, источники информации [2]-[11] повторно не анализировались

Что касается выполнения требований раскрытия сущности группы изобретений по оспариваемому патенту с полнотой, достаточной для

осуществления этих изобретений специалистом в данной области техники (пункт 3 статьи 1375 Гражданского Кодекса РФ), то описание оспариваемого патента не содержит сведений, достаточных для подтверждения того, что способ получения кристаллической ϵ -модификации сунитиниб малата, раскрытый в описании к оспариваемому патенту, во всем запатентованном интервале температур для приготовления водного раствора сунитиниба малата (25-100°C), на всем запатентованном интервале скоростей охлаждения (от 60 град/мин и выше), на всем запатентованном интервале температур отжига (от 70 до 150°C) обеспечивает достижение технического результата изобретения, а именно, получение новой кристаллической ϵ -модификации сунитиниб малата, которая характеризуется набором межплоскостных состояний (d) и соответствующих им интенсивностей ($I_{отн.}$), как приведено в независимом пункте 1 формулы и при этом проявляет повышенную биологическую активность.

Поэтому представляется невозможным получение новой кристаллической ϵ -модификации сунитиниб малата с теми характеристиками, которые приведены в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента.

Таким образом требование раскрытия сущности группы изобретений по оспариваемому патенту с полнотой, достаточной для осуществления этих изобретений специалистом в данной области техники (пункт 2 статьи 1375 Гражданского Кодекса РФ) не выполнено.

Независимо от хода рассмотрения коллегией настоящего возражения Роспатентом от РАН было получено экспертное заключение по ранее сформулированным вопросам, касающимся рассмотрения изобретений, в том числе по заявке № 2014139611, по которой был выдан оспариваемый патент.

Ответы были даны Корлюковым А.А., экспертом ОХМН РАН, д.х.н., профессором РАН, ведущим научным сотрудником Лаборатории рентгеноструктурных исследований ИНЭОС РАН.

В частности, был получен утвердительный ответ на вопрос о том, могут ли быть межплоскостные расстояния достоверной характеристикой решетки без наличия порошковой рентгенограммы.

На вопрос о том, какое количество пиков является достаточным для характеристики кристаллической формы вещества и, соответственно, для возможности отличить одну форму от другой, профессор Корлюков А.А. отметил, что в случае органических соединений таких пиков может быть до 20-30.

Кроме того, на вопрос о том, является ли информативной вся область порошковой дифрактограммы, а именно является ли информативной область значений угла менее 5, профессор Корлюков А.А. дал утвердительный ответ, пояснив, что область малых углов является наиболее информативной.

Для сведения, стороны были ознакомлены с ответами, данными РАН (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии от 20.01.2021).

От лица, подавшего возражение, на заседании коллегии, состоявшемся 26.04.2021, были представлены дополнения к возражению, доводы технического характера которых по существу повторяют доводы возражения и доводы, изложенные в решении СИПа от 26.03.2020 по делу № СИП-279/201.

От патентообладателя в корреспонденции от 26.04.2021 (поступление по электронной почте) были представлены дополнения к отзыву, в которых обращается внимание на ответы профессора Корлюкова А.А., в отношении того, что значения межплоскостных расстояний являются более универсальным параметром кристаллической формы, чем значения угла 2θ . При этом патентообладатель отмечает, что лицом, подавшим возражение, не были представлены соответствующие расчеты, позволяющие утверждать, что даже 8 пиков, известных для формы II соответствуют сунитиниб малату по оспариваемому патенту. По существу, данное мнение патентообладателем излагалось ранее в пояснениях и проанализировано выше в настоящем заключении.

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

удовлетворить возражение, поступившее 03.10.2018, патент Российской Федерации на изобретение № 2567535 признать недействительным полностью.