

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. № 321-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 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела поступившее 19.07.2017 возражение, поданное ФГУП «Московский Эндокринный Завод» (далее – лицо, подавшее возражение), против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2301059, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2301059 на группу изобретений "Трансдермальный пластырь для введения фентанила" выдан по заявке № 2003127841/15 с приоритетом от 16.03.2001 на имя компании «АЛЗА КОРПОРЕЙШН», США (далее – патентообладатель) со следующей формулой:

«1. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, расположенный на подложке, причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара является

липкой, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный резервуар сформирован из полиакрилатного адгезива.

2. Пластырь по п.1, биологически эквивалентный трансдермальной фентаниловой системе DURAGESIC®.

3. Пластырь по п.1 где указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$, от примерно 3,3 до примерно 82,5(нг/мл)/(мг/ч).

4. Пластырь по п.3, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 20 $\text{мкг}\cdot\text{см}^{-2}\cdot\text{ч}^{-1}$.

5. Пластырь по п.1, где указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,001 до примерно 0,2 нг/(мл·см²).

6. Пластырь по п.5, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 20 $\text{мкг}\cdot\text{см}^{-2}\cdot\text{ч}^{-1}$.

7. Пластырь по п.1, где указанный резервуар содержит количество растворенного фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение 3-7 суток.

8. Пластырь по п.7, где указанный резервуар содержит полимер, имеющий насыщенность в отношении фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила от примерно 1 до примерно 25 мас. %.

9. Пластырь по п.7, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила.

10. Пластырь по п.7, где резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

11. Пластырь по п.7, где резервуар дополнительно содержит усилитель.

12. Пластырь по п.1, где подложка содержит полимер, выбранный из группы, состоящей из полиуретана, поливинилацетата, поливинилиденхлорида, полиэтилена, полиэтилентерефталата (PET), ламинатов PET-полиолефина и полибутилентерефталата.

13. Пластырь по п.12, где подложка имеет толщину от примерно 0,012 до примерно 0,125 мм.

14. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, расположенный на подложке,

причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара является липкой, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный резервуар сформирован из полиакрилатного адгезива и имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

15. Пластырь по п.14, биологически эквивалентный трансдермальной фентаниловой системе DURAGESIC®.

16. Пластырь по п.14, где указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 3,3 до примерно 82,5 (нг/мл)/(мг/ч).

17. Пластырь по п.14, где указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,01 до примерно 0,2 нг/(мл·см²).

18. Пластырь по п.14, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 1 до примерно $10 \text{ мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$.

19. Пластырь по п.14, где указанный резервуар содержит количество растворенного фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток.

20. Пластырь по п.14, где фентанил имеет растворимость в указанном резервуаре от 7 до 12 мас. %.

21. Пластырь по п.19, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно $1,75 \text{ мг/см}^2$ фентанила основания.

22. Пластырь по п.21, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно $1,25 \text{ мг/см}^2$ фентанила основания.

23. Пластырь по п.22, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно $0,75 \text{ мг/см}^2$ фентанила основания.

24. Пластырь по п.23, где резервуар содержит от примерно 0,12 до примерно $0,5 \text{ мг/см}^2$ фентанила основания.

25. Пластырь по п.14, где указанный полиакрилатный адгезив имеет T_g ниже -10°C .

26. Пластырь по п.14 или 19, где резервуар дополнительно содержит усилитель.

27. Пластырь по любому из п.14 или 19, где подложка содержит полимер, выбранный из группы, состоящей из полиуретана, поливинилацетата, поливинилиденхлорида, полиэтилена, полиэтилентерефталата (PET), ламинатов PET-полиолефина и полибутилентерефталата.

28. Пластырь по п.27, где подложка содержит материалы на основе полиэтилена низкой плотности (LDPE), материалы на основе полиэтилена средней плотности (MDPE) или материалы на основе полиэтилена высокой плотности (HDPE).

29. Пластырь по п.28, где подложка содержит материалы на основе полиэтилена низкой плотности (LDPE).

30. Пластырь по п.27, где подложка имеет толщину от примерно 0,012 до примерно 0,125 мм.

31. Трансдермальный пластырь для введения фентанила, содержащий липкий резервуар с фентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный фентанилом для того, чтобы растворенный фентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 3,3 до примерно 82,5 (нг/мл)/(мг/ч), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

32. Трансдермальный пластырь для введения фентанила, содержащий липкий резервуар с фентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный фентанилом для того, чтобы растворенный фентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,01 до примерно 0,2 нг/(мл·см²), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

33. Пластырь по п.31 или 32, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 1 до примерно 10 мкг/см²/ч.

34. Пластырь по п.31 или 32, где указанный резервуар содержит количество растворенного фентанила достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток.

35. Пластырь по п.34, где указанный полиакрилатный адгезив представляет собой полиакрилатный адгезив с T_g ниже -10°C ; и фентанил имеет растворимость в указанном резервуаре, по меньшей мере, 4 мас. %.

36. Пластырь по п.35, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно $1,75\text{ мг/см}^2$ фентанила основания.

37. Пластырь по п.36, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно $1,25\text{ мг/см}^2$ фентанила основания.

38. Пластырь по п.37, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно $0,5\text{ мг/см}^2$ фентанила основания.

39. Монолитный трансдермальный пластырь для введения фентанила, содержащий липкий резервуар с фентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный фентанилом для того, чтобы растворенный фентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь полностью свободен от мембраны, регулирующей скорость, причем указанный пластырь обнаруживает нормализованную C_{max} от примерно 3,3 до примерно 82,5 (нг/мл)/(мг/ч), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

40. Монолитный трансдермальный пластырь для введения фентанила, содержащий липкий резервуар с фентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный фентанилом для того, чтобы растворенный фентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и

поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь полностью свободен от мембраны, регулирующей скорость, причем указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,01 до примерно 0,2 нг/(мл·см²), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

41. Пластырь по п.39 или 40, где указанный резервуар содержит количество растворенного фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток, где фентанил имеет растворимость в указанном резервуаре, по меньшей мере, 4 мас.%; и указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии примерно 1-10 мкг·см⁻²·ч⁻¹.

42. Пластырь по п.39 или 40, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² фентанила основания.

43. Трансдермальный пластырь для введения через кожу суфентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, расположенный на подложке,

причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара является липкой, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество суфентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный резервуар сформирован из полиакрилатного адгезива.

44. Пластырь по п.43, где указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 0,04 до примерно 10 (нг/мл)/(мг/ч).

45. Пластырь по п.43, где указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,001 до примерно 0,05 нг/(мл·см²).

46. Пластырь по п.п.44 или 45, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно $10 \text{ мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$.

47. Пластырь по п.43, где указанный резервуар содержит количество растворенного суфентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток.

48. Пластырь по п.43, где суфентанил имеет растворимость в указанном резервуаре от 1 до 25 мас. %.

49. Пластырь по п.48, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно $1,75 \text{ мг/см}^2$ суфентанила основания.

50. Пластырь по п.49, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно $1,25 \text{ мг/см}^2$ суфентанила основания.

51. Пластырь по п.50, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно $0,75 \text{ мг/см}^2$ суфентанила основания.

52. Пластырь по п.51, где резервуар содержит от примерно 0,12 до примерно $0,5 \text{ мг/см}^2$ суфентанила основания.

53. Пластырь по п.47, где резервуар имеет толщину от 0,0125 мм (0,5 мил) до 0,1 мм.

54. Пластырь по п.43, где указанный полиакрилатный адгезив имеет T_g ниже -10°C .

55. Пластырь по п.53, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно $1,75 \text{ мг/см}^2$ суфентанила основания.

56. Пластырь по п.55, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно $1,25 \text{ мг/см}^2$ суфентанила основания.

57. Пластырь по п.56, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно $0,75 \text{ мг/см}^2$ суфентанила основания.

58. Пластырь по п.56, где резервуар содержит от примерно 0,12 до примерно $0,5 \text{ мг/см}^2$ суфентанила основания.

59. Пластырь по п.47, где резервуар дополнительно содержит усилитель.

60. Пластырь по любому из пп.43, 47 или 51, где подложка содержит полимер, выбранный из группы, состоящей из полиуретана, поливинилацетата, поливинилиденхлорида, полиэтилена, полиэтилентерефталата (PET), ламинатов PET-полиолефина и полибутилентерефталата.

61. Пластырь по п.60, где подложка содержит материалы на основе полиэтилена низкой плотности (LDPE), материалы на основе полиэтилена средней плотности (MDPE) или материалы на основе полиэтилена высокой плотности (HDPE).

62. Пластырь по п.61, где подложка содержит материалы на основе полиэтилена низкой плотности (LDPE).

63. Пластырь по п.60, где подложка имеет толщину от примерно 0,012 до примерно 0,125 мм.

64. Трансдермальный пластырь для введения суфентанила, содержащий липкий резервуар с суфентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный суфентанилом для того, чтобы растворенный суфентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 0,04 до примерно 10 (нг/мл)/(мг/ч), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

65. Трансдермальный пластырь для введения суфентанила, содержащий липкий резервуар с суфентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный суфентанилом для того, чтобы растворенный суфентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать

и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,001 до примерно 0,05 нг/(мл·см²), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

66. Пластырь по п.64 или 65, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 10 мкг·см⁻²·ч⁻¹.

67. Пластырь по п.64 или 65, где указанный резервуар содержит количество растворенного суфентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток.

68. Пластырь по п.67, где указанный полиакрилатный адгезив имеет T_g ниже -10°C; и суфентанил имеет растворимость в указанном резервуаре, по меньшей мере, 1 мас. %.

69. Пластырь по п.68, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² суфентанила основания.

70. Пластырь по п.69, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно 1,25 мг/см² суфентанила основания.

71. Пластырь по п.70, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно 0,5 мг/см² суфентанила основания.

72. Монолитный трансдермальный пластырь для введения суфентанила, содержащий липкий резервуар с суфентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный суфентанилом для того, чтобы растворенный суфентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь полностью свободен от мембраны, регулирующей скорость, причем указанный пластырь

обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 0,04 до примерно 10 (нг/мл)/(мг/ч).

73. Монолитный трансдермальный пластырь для введения суфентанила, содержащий липкий резервуар с суфентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный суфентанилом для того, чтобы растворенный суфентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь полностью свободен от мембраны, регулирующей скорость, причем указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,001 до примерно 0,05 нг/(мл·см²).

74. Пластырь по п.72 или 73, где указанный резервуар содержит количество растворенного суфентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток, где суфентанил имеет растворимость в указанном резервуаре, по меньшей мере, 1 мас.%, резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм; и указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 10 мкг/см²/ч.

75. Пластырь по п.74, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² суфентанила основания.

76. Пластырь по п.1, фармакологически эквивалентный трансдермальной фентаниловой системе DURAGESIC®.

77. Пластырь по п.43, фармакологически эквивалентный трансдермальной фентаниловой системе DURAGESIC®.

78. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, имеющий толщину от 0,0125 мм до 0,1 мм, расположенный на подложке, причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара состоит из полиакрилатного адгезива, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 20 $\text{мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$ и стандартизированную C_{max} от примерно 0,001 до примерно 0,2 $\text{нг}/(\text{мл} \cdot \text{см}^2)$.

79. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, имеющий толщину от 0,0125 до 0,1 мм, расположенный на подложке, причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара состоит полиакрилатного адгезива National Starch 87-2287 или полиакрилатного адгезива National Starch 87-4287, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 20 $\text{мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$ и стандартизированную C_{max} от примерно 0,001 до примерно 0,2 $\text{нг}/(\text{мл} \cdot \text{см}^2)$.

80. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, имеющий толщину от 0,0125 до 0,1 мм, расположенный на подложке, причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара состоит из терполимерного адгезива, полученного полимеризацией мономеров, выбранных из группы, состоящей из акриловой кислоты, метакриловой кислоты, метоксиэтилакрилата, этилакрилата, бутилакрилата, бутилметакрилата, гексилакрилата, гексилметакрилата, 2-этилбутилакрилата, 2-этилбутилметакрилата, изооктилакрилата, изооктилметакрилата, 2-этилгексилакрилата, 2-этилгексилметакрилата, децилакрилата, децилметакрилата, додецилакрилата, додецилметакрилата, тридецилакрилата, тридецилметакрилата, гидроксиэтилакрилата, гидроксипропилакрилата, акриламида, диметилакриламида, акрилонитрила, диметиламиноэтилакрилата, диметиламиноэтилметакрилата, трет-бутиламиноэтилакрилата, трет-бутиламиноэтилметакрилата, метоксиэтилакрилата, метоксиэтилметакрилата, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 20 $\text{мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$ и стандартизированную C_{max} от примерно 0,001 до примерно 0,2 $\text{нг}/(\text{мл} \cdot \text{см}^2)$.

81. Пластырь по п.80, где указанный адгезив является поперечно-сшитым.

82. Пластырь по п.80, где указанный полимер не является поперечно-сшитым.

83. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, имеющий толщину от 0,0125 мм до 0,1 мм, расположенный на подложке, причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей

поверхность указанного резервуара состоит полимерного адгезива, полученного полимеризацией мономеров, причем по меньшей мере два мономера выбраны из группы, состоящей из акриловой кислоты, метакриловой кислоты, метоксиэтилакрилата, этилакрилата, бутилакрилата, бутилметакрилата, гексилакрилата, гексилметакрилата, 2-этилбутилакрилата, 2-этилбутилметакрилата, изооктилакрилата, изооктилметакрилата, 2-этилгексилакрилата, 2-этилгексилметакрилата, децилакрилата, децилметакрилата, додецилакрилата, додецилметакрилата, тридецилакрилата, тридецилметакрилата, гидроксиэтилакрилата, гидроксипропилакрилата, акриламида, диметилакриламида, акрилонитрила, диметиламиноэтилакрилата, диметиламиноэтилметакрилата, трет-бутиламиноэтилакрилата, трет-бутиламиноэтилметакрилата, метоксиэтилакрилата, метоксиэтилметакрилата, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 20 $\text{мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$ и стандартизированную C_{max} от примерно 0,001 до примерно 0,2 $\text{нг}/(\text{мл} \cdot \text{см}^2)$.

84. Пластырь по п.83, где указанный адгезив является поперечно-сшитым.

85. Пластырь по п.83, где указанный полимер не является поперечно-сшитым».

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса, поступило возражение, мотивированное несоответствием группы изобретений, охарактеризованных в формуле по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «новизна» (независимые пункты 1, 14, 31, 32, 39, 40, 78, 79, 80, 83 формулы) и «изобретательский уровень» (независимый пункт 79 формулы).

К возражению приложены следующие материалы:

- публикация международной заявки WO 01/26705, опубл. 19.04.2001, с переводом на русский язык релевантных частей (далее- [1]);

- статья Determination of solubility of Fentanyl in polyacrylate copolymer DuroTak 87-4098//Study report. Labtec GmbH, 21.06.2007 с переводом на русский язык релевантных частей (далее- [2]);

- статья Samir D. Roy et al. Controlled Transdermal Delivery of Fentanyl: Characterizations of Pressure-Sensitive Adhesives for Matrix Patch Design//Journal of Pharmaceutical Sciences. Vol. 85, No. 5, May 1996, pp. 491-495 с переводом на русский язык релевантных частей (далее- [3]);

- статья Determination of solubility of Fentanyl in polyacrylate// Study report. Labtec GmbH, 19.01.2007 с переводом на русский язык релевантных частей (далее- [4]);

- публикация международной заявки WO 95/18603, опубл. 13.07.1995, с переводом на русский язык релевантных частей (далее- [5]);

- письмо от 28.04.2004 от производителя (далее- [6]);

- патентный документ США № 2013/0211351, опубл. 15.08.2013 (далее- [7]);

- патентный документ ЕР № 0887075, опубл. 30.12.1998, табл. 2, с переводом на русский язык релевантных частей (далее- [8]);

- статья Suneel K. Gupta et al. Pharmacokinetic and Pharmacodynamic Modeling of Transdermal Products//Topical Drug Bioavailability, Bioequivalence, and Penetration. New York, 1993, s. 311-332 с переводом на русский язык релевантных частей (далее- [9]);

- патентный документ RU 2110261, опубл. 10.05.1998 (далее - [10]);

- статья Simone Reismann "Saturation Solubility of a Drug in Thin Polymer Films and its Influence on Permeation. 2011, стр. 65-66, с переводом на русский язык релевантных частей (далее - [11]);

- патентный документ США № 4588580, опубл. 13.05.1986, с переводом

на русский язык релевантных частей (далее - [12]);

- публикация международной заявки WO 89/10108, опубл. 02.11.1989, с переводом на русский язык релевантных частей (далее - [13]);

- S. Mojtaba Taghizaden et al. Synthesis and Optimization of a Four-component Acrylic-based Copolymer as Pressure Sensitive Adhesive//Iranian Polymer Journal, 19 (5), 2010, 343-352, титульный лист, стр. 349, с переводом на русский язык релевантных частей (далее - [14]).

Суть содержащихся в возражении доводов сводится к следующему:

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту известно из примера 2 публикации [1], с учетом сведений, раскрытых в статье [2], в которой говорится том, что концентрация насыщения фентанила в полимере DuroTak 87-4098 составляет 13-16 мас.%; или из статьи [3] с учетом сведений, раскрытых в статье [4], в которой говорится о том, что концентрация насыщения фентанила в полимере Geiva 737 составляет 14-1,5 мас.%; или из публикации [5];

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 14 формулы по оспариваемому патенту известно из публикации [1] или из статьи [3], или из публикации [5];

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 31 формулы по оспариваемому патенту известно из публикаций [1] или [5], или из статьи [3];

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 32 формулы по оспариваемому патенту известно из публикаций [1] или [5], или из статьи [3];

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 39 формулы по оспариваемому патенту известно из публикаций [1] или [5], или из статьи [3];

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 40 формулы по оспариваемому патенту известно из публикаций [1] или [5], или из статьи [3];

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 78 формулы по оспариваемому патенту известно из публикаций [1] или [5], или из статьи [3];

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 79 формулы по

оспариваемому патенту известно из публикации [5];

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 80 формулы по оспариваемому патенту известно из публикации [1] с учетом сведений из заявки США [7] или из статьи [3], или из публикации [5];

- изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 83 формулы по оспариваемому патенту известно из статьи [3] или из публикации [5].

В отношении условия патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении указано, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 79 формулы по оспариваемому патенту с очевидностью для специалиста следует из статьи [3], с учетом содержащихся в патентном документе [12] сведений.

В отношении зависимых пунктов формулы изобретения по оспариваемому патенту, в возражении указано на их известность из следующих источников информации:

- признаки зависимого пункта 2 формулы по оспариваемому патенту известны из публикаций [1], [5] или из статьи [3];

- признаки зависимого пункта 3 формулы по оспариваемому патенту известны из публикаций [1], [5] или из статьи [3] с учетом сведений из статьи [9];

- признаки зависимых пунктов 4 - 10 формулы по оспариваемому патенту известны из публикаций [1], [5] или из статьи [3];

- признаки зависимого пункта 11 формулы по оспариваемому патенту известны из статьи [3] с учетом сведений из публикации [5];

- признаки зависимого пункта 12 формулы по оспариваемому патенту известны из публикации [1] с учетом сведений из патентного документа [10] или из статьи [3], или из публикации [5];

- признаки зависимого пункта 13 формулы по оспариваемому патенту известны из публикации [1] или из статьи [3] с учетом сведений из публикации [5], или из публикации [5];

- признаки зависимого пункта 15 - 24 формулы по оспариваемому патенту известны из публикаций [1] или [5], или из статьи [3];

- признаки зависимого пункта 25 формулы по оспариваемому патенту известны из публикации [1] с учетом сведений из статьи [11], или из статьи [3] с учетом сведений из патентного документа [8], письма [5], статьи [14], или из публикации [5];

- признаки зависимого пункта 27 формулы по оспариваемому патенту известны из публикации [1] с учетом сведений из патентного документа [4], или из статьи [3] с учетом сведений из публикации [5], или из публикации [5];

- признаки зависимого пункта 30 – 38, 41, 42, 82 формулы по оспариваемому патенту известны из публикаций [1], [5] или из статьи [3].

Материалы возражения в установленном порядке были направлены в адрес патентообладателя.

Патентообладатель представил 16.11.017 отзыв по мотивам возражения, суть доводов которого сводится к следующему:

Публикация [1], заявка [7], статьи [2], [4], [11], [14] и письмо [6] не могут быть включены в уровень техники в рамках данного возражения.

По мнению патентообладателя, группа изобретений по оспариваемому патенту отвечает условию патентоспособности «новизна», поскольку ни в одном из источников информации, которые могут быть включены в уровень техники, а именно, ни в статье [3], ни в публикации [5], не раскрыт трансдермальный пластырь, которому присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в независимых пунктах 1, 14, 31, 32, 39, 40, 78, 79, 80, 83 формулы по оспариваемому патенту.

Изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 79 формулы соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку оно не следует явным образом для специалистов, исходя из сведений, содержащихся в источниках информации [3], [12].

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения

возражения, коллегия установила следующее.

С учетом даты международной подачи заявки (15.03.2002), по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки группы соответствия изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 №3517-1 (далее - Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные Роспатентом 17.04.1998 №82 и зарегистрированные в Министерстве юстиции Российской Федерации 22.09.1998 № 1612 с изменениями и дополнениями, внесенными приказами Роспатента от 08.07.1999 №133, от 13.11.2000 №223 (далее – Правила ИЗ).

В соответствии с пунктом 1 статьи 4 Закона изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо. Изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники. Изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники. Уровень техники включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения. При установлении новизны изобретения в уровень техники включаются при условии их более раннего приоритета все поданные в Российской Федерации другими лицами заявки на изобретения и полезные модели (кроме отозванных), а также запатентованные в Российской Федерации изобретения и полезные модели.

Согласно пункту 4 статьи 3 Закона объем правовой охраны, предоставляемый патентом на изобретение или полезную модель, определяется их формулой.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.2 Правил ИЗ изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники. Проверка новизны изобретения проводится в отношении всей совокупности признаков, содержащихся в независимом пункте формулы изобретения.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.2 Правил ИЗ заявка на изобретение или полезную модель с более ранней датой приоритета включается с этой даты в уровень техники (только для проверки новизны) при соблюдении совокупности следующих условий: заявка подана в Российской Федерации (к заявкам, поданным в Российской Федерации, приравниваются заявки на выдачу авторских свидетельств или патентов СССР на изобретения, по которым в установленном порядке поданы ходатайства о выдаче патентов Российской Федерации, и международные заявки, по которым установлена дата международной подачи и в которых содержится указание СССР или Российской Федерации, а также евразийские заявки, преобразованные в российские национальные заявки); заявка подана другим лицом; заявка не отозвана, не считается отозванной и не признана отозванной (то есть, действие международной заявки в Российской Федерации не прекращено).

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.2 Правил ИЗ изобретение признается известным из уровня техники и несоответствующим условию патентоспособности «новизна», если в уровне техники выявлено средство, которому присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в предложенной заявителем формуле изобретения, включая характеристику назначения.

Согласно подпункту 5 пункта 19.5.2 Правил ИЗ 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.

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

включает: определение наиболее близкого аналога; выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков); выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения.

Согласно подпункту 6 пункта 19.5.3 Правил ИЗ известность влияния отличительных признаков заявленного изобретения на технический результат может быть подтверждена как одним, так и несколькими источниками информации. Допускается привлечение аргументов, основанных на общеизвестных в конкретной области техники знаниях, без указания каких-либо источников информации.

Согласно подпункту 7 пункта 19.5.3 Правил ИЗ подтверждения известности влияния отличительных признаков на технический результат не требуется, если в отношении этих признаков такой результат не определен заявителем или в случае, когда установлено, что указанный им технический результат не достигается.

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

Согласно подпункту 1 пункта 22.3 Правил ИЗ при определении уровня техники общедоступными считаются сведения, содержащиеся в источнике информации, с которым любое лицо может ознакомиться само, либо о содержании которого ему может быть законным путем сообщено. Датой, определяющей включение источника информации в уровень техники, является: для опубликованных описаний к охраняемым документам - указанная на них дата опубликования; для отчетов о научно-исследовательских работах, пояснительных записок к опытно-конструкторским работам и другой конструкторской, технологической и проектной документации, находящейся в

органах научно-технической информации, - дата их поступления в эти органы.

Согласно пункту 4.9 Правил ППС, при рассмотрении возражения против выдачи патента на изобретение коллегия палаты по патентным спорам вправе предложить патентообладателю внести изменения в формулу изобретения, если без указанных изменений оспариваемый патент должен быть признан недействительным полностью, а при их внесении - может быть признан недействительным частично. Указанные изменения должны соответствовать изменениям формулы изобретения, которые предусмотрены правилами составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, действовавшими на дату подачи заявки.

Группе изобретений по оспариваемому патенту представлена правовая охрана в объеме признаков, содержащихся в независимых пунктах 1, 14, 31, 32, 39, 40, 43, 64, 65, 72, 73, 78, 79, 80, 83 формулы, приведенной выше.

При этом патентоспособность изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 43, 64, 65, 72, 73 лицом, подавшим возражение, не оспаривается.

Информация, содержащаяся в источниках информации [1], [7], [2], [4], [6], [11], [14], не может быть привлечена в рамках настоящего возражения для оценки патентоспособности группы изобретений по оспариваемому патенту, в связи со следующим.

Источник информации [1] является публикацией международной заявки РСТ/KR 00/01115. Данная заявка опубликована 19.04.2001 и имеет дату приоритета 11.10.1999. Соответственно, публикация [1] не может быть включена в уровень техники с даты ее публикации (19.04.2001), поскольку она опубликована позднее даты приоритета (16.03.2001) изобретения по оспариваемому патенту (см. пункт 1 пункта 22.3 Правил ИЗ). Кроме того, опубликованная международная заявка [1], не может быть включена в уровень техники и с даты ее приоритета 11.10.1999, поскольку она не отвечает требованиям, предъявляемым действующим законодательством (см. подпункт 2

пункта 19.5.2 Правил ИЗ). Упомянутая международная заявка (публикация [1]) не была переведена на национальную фазу в Российской Федерации, соответственно, по ней делопроизводство на отечественной фазе не начиналось.

Указанные в источниках информации [1], [2], [4], [6], [7], [11] и [14] даты публикации 19.04.2001, 21.06.2007, 19.01.2007, 28.04.2004, 15.08.2013, 02.08.2011 и 2010 соответственно (см. их библиографические данные) являются более поздними по отношению к дате приоритета (16.03.2001) изобретения по оспариваемому патенту.

Таким образом, сведения, содержащиеся в упомянутых источниках [1], [2], [4], [6], [7], [11] и [14], не могут быть привлечены для анализа при оценке соответствия изобретения по оспариваемому патенту условиям патентоспособности в рамках данного возражения.

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна», показал следующее.

В независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту охарактеризован трансдермальный пластырь, который предназначен для введения через кожу ряда перечисленных лекарственных веществ (см. формулу выше). Пластырь содержит подложку с расположенным на ней резервуаром, поверхность которого является липкой и соприкасается с кожей. Резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов. Резервуар сформирован из полиакрилатного адгезива. В композиции содержится фентанил или другие вещества (см. формулу выше) в количестве, достаточном для поддержания аналгезии у человека, по меньшей мере, трех суток.

Что касается статьи [3], то, раскрытому в ней техническому решению не присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в независимом пункте формулы по оспариваемому патенту.

Так, в данной статье [3] описаны исследования системы, которая согласно фиг. 1, представляет собой пластырь для доставки фентанила из различных матричных составов путем стационарного потока через кожу. Данная система содержит подложку с расположенным на ней резервуаром (см. фигуру 1). Поверхность указанного резервуара состоит из акрилового адгезива.

Отличительными признаками изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту от известного из статьи [3] технического решения (см. перевод) являются: резервуар «состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов», «количество фентанила или его аналогов достаточно для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение от одних до трех суток».

Исходя из изложенного, можно констатировать, что в статье [3] (см. перевод) отсутствуют сведения о техническом решении, содержащем признаки, идентичные всем признакам изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту.

В публикации [5] описано трансдермальное устройство содержащее резервуар, подложку (см. фиг. к реферату). Однако, в публикации [5] (см. перевод), по меньшей мере, отсутствуют сведения о том, что количество фентанила или его аналогов «достаточно для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток».

Исходя из изложенного, можно констатировать, что в публикации [5] (см. перевод) отсутствуют сведения о техническом решении, содержащем признаки, идентичные всем признакам изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту.

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 14 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна», показал следующее.

Изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 14 формулы по оспариваемому патенту, в дополнение к изобретению по независимому пункту 1 формулы, содержит количественные параметры толщины резервуара «0,0125 до 0,1 мм».

При этом, ни в одном из источников информации [3] или [5] (см. переводы) не представлено сведений, по меньшей мере, о том, что количество фентанила или его аналогов «достаточно для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток».

Исходя из изложенного, можно констатировать, что в источниках информации [3] или [5] (переводы) отсутствуют сведения о технических решениях, содержащим признаки, идентичные всем признакам изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 14 формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту.

Изобретения, охарактеризованные в независимых пунктах 31, 32, 39, 40, 78, 79, 80, 83 формулы по оспариваемому патенту, также содержат вышеуказанные признаки, которые, как уже говорилось выше, не известны из источников информации [3] или [5] (см. переводы).

Исходя из изложенного, можно констатировать, что в источниках информации [3] или [5] (см. переводы) отсутствуют сведения о технических решениях, содержащим признаки, идентичные всем признакам изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 31, 32, 39, 40, 78, 79, 80, 83 формулы по оспариваемому патенту.

Таким образом, в возражении не представлено доводов, позволяющих признать группу изобретений по независимым пунктам 1, 14, 31, 32, 39, 40, 78, 79, 80, 83 формулы по оспариваемому патенту не соответствующей условию патентоспособности «новизна».

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 79 формулы по оспариваемому

патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

В статье [3] описано исследование пластыря для введения через кожу фентанила, содержащую подложку с расположенным на ней резервуаром (см. фигуру 1). Толщина резервуарного слоя составляет 0,07 мм (входит в интервал толщины от 0,0125 до 0,1 мм по оспариваемому патенту). Поверхность указанного резервуара состоит из акрилового адгезива. Согласно приведенным в таблице 4 сведениям, плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии для пластыря с 2 мас.% фентанила составляет примерно $0,9 \pm 0,2 \text{ мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$ (в формуле по оспариваемому патенту плотность составляет «от примерно 0,1 до примерно $20 \text{ мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$ »).

Отличительными признаками пластыря по независимому пункту 79 формулы по оспариваемому патенту от известного из статьи [3] пластыря являются: «стандартизированная C_{max} от примерно 0,001 до примерно 0,2 нг/(мл·см²)»; использование адгезивов марок «National Starch 87-2287 или полиакрилатного адгезива National Starch 87-4287», резервуар состоит «из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток».

В описании к оспариваемому патенту технический результат отсутствуют сведения о влиянии отличительных признаков на какой-либо технический результат.

При этом из публикации [5] известны используемые для пластырей акриловые адгезивы, продаваемые под товарным знаком National Starch и включающие в себя полиакрилатные адгезивы 2287 (стр. 14). В данной публикации [5] содержатся сведения о том, что однофазный пластырь размером 1-200 см² (см. стр. 34, строки 1-5) может содержать 0,1-50 мас.% фентанила

(табл. 1). В описании к оспариваемому патенту приводятся аналогичные параметры, а именно: «однофазный пластырь, содержащий 1-25 мас.% фентанила (стр. 10, строки 4-5), а его размер составляет 0,5-150 см² (стр. 12, строки 38-40). Известный из публикации [5] пластырь может достигать таких же значений $C_{\max}$. В данной публикации говорится о том, что активное вещество находится в полностью растворенном виде (см. п.1 формулы).

Признак, касающийся такого количество фентанила, которое будет достаточно для того, чтобы вызвать и поддерживать анальгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, раскрыт в патентном документе [12]. Так, в данном документе [12] содержатся сведения о том, что фентанил или его производные можно вводить в организм человека трансдермальным путем с целью индуцирования анальгезии, если его вводят примерно на неповрежденном участке кожи 10-50 см² со скоростью в пределах от 0,5 до 10 мкг·см⁻²·ч⁻¹. При такой доставке лекарственного средства будет обеспечиваться адекватный диапазон титрования для индивидуальных потребностей пациента при сохранении безопасной и эффективной лекарственной формы. Действие введенного лекарства при этом сохраняется в течение не менее 12 часов и до 7 дней при сохранении у пациента анальгезии. При этом режим 1-3 дней считается предпочтительным (см. колонка 2, стр. 56-колонка 3, стр. 5, перевод).

Таким образом, в возражении представлены доводы, позволяющие признать изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 79 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В соответствии с пунктом 4.9 Правил ППС патентообладателю было предложено уточнить формулу, характеризующую группу изобретений.

На заседании коллегии 01.12.2017 патентообладатель обратился с просьбой принять к рассмотрению уточненную формулу изобретения, скорректированную путем исключения независимого пункта 79 формулы из

приведенной выше формулы.

Такая корректировка не требует проведения дополнительного информационного поиска.

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

удовлетворить возражение, поступившее 19.07.2017, признать патент Российской Федерации на изобретение № 2301059 недействительным частично и выдать патент с уточненной патентообладателем формулой изобретения.

(21) 2003127841/15

(51) А 61 К 9/70

А 61 К 31/4468

А 61 К 25/04

(57)

«1. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, расположенный на подложке, причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара является липкой, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный резервуар сформирован из полиакрилатного адгезива.

2. Пластырь по п.1, биологически эквивалентный трансдермальной фентаниловой системе DURAGESIC®.

3. Пластырь по п.1 где указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$, от примерно 3,3 до примерно 82,5(нг/мл)/(мг/ч).

4. Пластырь по п.3, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно $20 \text{ мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$.

5. Пластырь по п.1, где указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,001 до примерно 0,2 нг/(мл·см²).

6. Пластырь по п.5, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 20 мкг·см⁻²·ч⁻¹.

7. Пластырь по п.1, где указанный резервуар содержит количество растворенного фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение 3-7 суток.

8. Пластырь по п.7, где указанный резервуар содержит полимер, имеющий насыщенность в отношении фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила от примерно 1 до примерно 25 мас. %.

9. Пластырь по п.7, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² фентанила, алфентанила, карфентанила, лофентанила, ремифентанила, суфентанила или трефентанила.

10. Пластырь по п.7, где резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

11. Пластырь по п.7, где резервуар дополнительно содержит усилитель.

12. Пластырь по п.1, где подложка содержит полимер, выбранный из группы, состоящей из полиуретана, поливинилацетата, поливинилиденхлорида, полиэтилена, полиэтилентерефталата (PET), ламинатов PET-полиолефина и полибутилентерефталата.

13. Пластырь по п.12, где подложка имеет толщину от примерно 0,012 до примерно 0,125 мм.

14. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, расположенный на подложке,

причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара является липкой, причем указанный резервуар

состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный резервуар сформирован из полиакрилатного адгезива и имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

15. Пластырь по п.14, биологически эквивалентный трансдермальной фентаниловой системе DURAGESIC®.

16. Пластырь по п.14, где указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 3,3 до примерно 82,5 (нг/мл)/(мг/ч).

17. Пластырь по п.14, где указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,01 до примерно 0,2 нг/(мл·см²).

18. Пластырь по п.14, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 1 до примерно 10 мкг·см⁻²·ч⁻¹.

19. Пластырь по п.14, где указанный резервуар содержит количество растворенного фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток.

20. Пластырь по п.14, где фентанил имеет растворимость в указанном резервуаре от 7 до 12 мас. %.

21. Пластырь по п.19, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² фентанила основания.

22. Пластырь по п.21, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно 1,25 мг/см² фентанила основания.

23. Пластырь по п.22, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно 0,75 мг/см² фентанила основания.

24. Пластырь по п.23, где резервуар содержит от примерно 0,12 до примерно 0,5 мг/см² фентанила основания.

25. Пластырь по п.14, где указанный полиакрилатный адгезив имеет T_g ниже -10°C.

26. Пластырь по п.14 или 19, где резервуар дополнительно содержит усилитель.

27. Пластырь по любому из п.14 или 19, где подложка содержит полимер, выбранный из группы, состоящей из полиуретана, поливинилацетата, поливинилиденхлорида, полиэтилена, полиэтилентерефталата (PET), ламинатов PET-полиолефина и полибутилентерефталата.

28. Пластырь по п.27, где подложка содержит материалы на основе полиэтилена низкой плотности (LDPE), материалы на основе полиэтилена средней плотности (MDPE) или материалы на основе полиэтилена высокой плотности (HDPE).

29. Пластырь по п.28, где подложка содержит материалы на основе полиэтилена низкой плотности (LDPE).

30. Пластырь по п.27, где подложка имеет толщину от примерно 0,012 до примерно 0,125 мм.

31. Трансдермальный пластырь для введения фентанила, содержащий липкий резервуар с фентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный фентанилом для того, чтобы растворенный фентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 3,3 до примерно 82,5 (нг/мл)/(мг/ч), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

32. Трансдермальный пластырь для введения фентанила, содержащий липкий резервуар с фентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный фентанилом для того, чтобы растворенный фентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и

поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,01 до примерно 0,2 нг/(мл·см²), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

33. Пластырь по п.31 или 32, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 1 до примерно 10 мкг/см²/ч.

34. Пластырь по п.31 или 32, где указанный резервуар содержит количество растворенного фентанила достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток.

35. Пластырь по п.34, где указанный полиакрилатный адгезив представляет собой полиакрилатный адгезив с T_g ниже - 10°C; и фентанил имеет растворимость в указанном резервуаре, по меньшей мере, 4 мас. %.

36. Пластырь по п.35, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² фентанила основания.

37. Пластырь по п.36, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно 1,25 мг/см² фентанила основания.

38. Пластырь по п.37, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно 0,5 мг/см² фентанила основания.

39. Монолитный трансдермальный пластырь для введения фентанила, содержащий липкий резервуар с фентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный фентанилом для того, чтобы растворенный фентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь полностью свободен от мембраны, регулирующей скорость, причем указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 3,3 до примерно 82,5 (нг/мл)/(мг/ч), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

40. Монолитный трансдермальный пластырь для введения фентанила, содержащий липкий резервуар с фентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный фентанилом для того, чтобы растворенный фентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь полностью свободен от мембраны, регулирующей скорость, причем указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,01 до примерно 0,2 нг/(мл·см²), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

41. Пластырь по п.39 или 40, где указанный резервуар содержит количество растворенного фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток, где фентанил имеет растворимость в указанном резервуаре, по меньшей мере, 4 мас.%; и указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии примерно 1-10 мкг·см⁻²·ч⁻¹.

42. Пластырь по п.39 или 40, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² фентанила основания.

43. Трансдермальный пластырь для введения через кожу суфентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, расположенный на подложке,

причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара является липкой, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество суфентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в

течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный резервуар сформирован из полиакрилатного адгезива.

44. Пластырь по п.43, где указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 0,04 до примерно 10 (нг/мл)/(мг/ч).

45. Пластырь по п.43, где указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,001 до примерно 0,05 нг/(мл·см²).

46. Пластырь по п.п.44 или 45, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 10 мкг·см⁻²·ч⁻¹.

47. Пластырь по п.43, где указанный резервуар содержит количество растворенного суфентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток.

48. Пластырь по п.43, где суфентанил имеет растворимость в указанном резервуаре от 1 до 25 мас. %.

49. Пластырь по п.48, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² суфентанила основания.

50. Пластырь по п.49, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно 1,25 мг/см² суфентанила основания.

51. Пластырь по п.50, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно 0,75 мг/см² суфентанила основания.

52. Пластырь по п.51, где резервуар содержит от примерно 0,12 до примерно 0,5 мг/см² суфентанила основания.

53. Пластырь по п.47, где резервуар имеет толщину от 0,0125 мм (0,5 мил) до 0,1 мм.

54. Пластырь по п.43, где указанный полиакрилатный адгезив имеет T_g ниже -10°C.

55. Пластырь по п.53, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² суфентанила основания.

56. Пластырь по п.55, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно 1,25 мг/см² суфентанила основания.

57. Пластырь по п.56, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно 0,75 мг/см² суфентанила основания.

58. Пластырь по п.56, где резервуар содержит от примерно 0,12 до примерно 0,5 мг/см² суфентанила основания.

59. Пластырь по п.47, где резервуар дополнительно содержит усилитель.

60. Пластырь по любому из пп.43, 47 или 51, где подложка содержит полимер, выбранный из группы, состоящей из полиуретана, поливинилацетата, поливинилиденхлорида, полиэтилена, полиэтилентерефталата (PET), ламинатов PET-полиолефина и полибутилентерефталата.

61. Пластырь по п.60, где подложка содержит материалы на основе полиэтилена низкой плотности (LDPE), материалы на основе полиэтилена средней плотности (MDPE) или материалы на основе полиэтилена высокой плотности (HDPE).

62. Пластырь по п.61, где подложка содержит материалы на основе полиэтилена низкой плотности (LDPE).

63. Пластырь по п.60, где подложка имеет толщину от примерно 0,012 до примерно 0,125 мм.

64. Трансдермальный пластырь для введения суфентанила, содержащий липкий резервуар с суфентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный суфентанилом для того, чтобы растворенный суфентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 0,04 до примерно 10 (нг/мл)/(мг/ч), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

65. Трансдермальный пластырь для введения суфентанила, содержащий липкий резервуар с суфентанилом на подложке, причем указанный резервуар

состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный суфентанилом для того, чтобы растворенный суфентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь обнаруживает стандартизованную $C_{\max}$ от примерно 0,001 до примерно 0,05 нг/(мл·см²), при этом указанный резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм.

66. Пластырь по п.64 или 65, где пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 10 мкг·см⁻²·ч⁻¹.

67. Пластырь по п.64 или 65, где указанный резервуар содержит количество растворенного суфентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток.

68. Пластырь по п.67, где указанный полиакрилатный адгезив имеет T_g ниже -10°C; и суфентанил имеет растворимость в указанном резервуаре, по меньшей мере, 1 мас. %.

69. Пластырь по п.68, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² суфентанила основания.

70. Пластырь по п.69, где резервуар содержит от примерно 0,08 до примерно 1,25 мг/см² суфентанила основания.

71. Пластырь по п.70, где резервуар содержит от примерно 0,1 до примерно 0,5 мг/см² суфентанила основания.

72. Монолитный трансдермальный пластырь для введения суфентанила, содержащий липкий резервуар с суфентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный суфентанилом для того, чтобы растворенный суфентанил содержался в количестве, достаточном для того,

чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь полностью свободен от мембраны, регулирующей скорость, причем указанный пластырь обнаруживает нормализованную $C_{\max}$ от примерно 0,04 до примерно 10 (нг/мл)/(мг/ч).

73. Монолитный трансдермальный пластырь для введения суфентанила, содержащий липкий резервуар с суфентанилом на подложке, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей полиакрилатный адгезив, достаточно насыщенный суфентанилом для того, чтобы растворенный суфентанил содержался в количестве, достаточном для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, причем указанный пластырь полностью свободен от мембраны, регулирующей скорость, причем указанный пластырь обнаруживает стандартизированную $C_{\max}$ от примерно 0,001 до примерно 0,05 нг/(мл·см²).

74. Пластырь по п.72 или 73, где указанный резервуар содержит количество растворенного суфентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию в течение от примерно 3 до примерно 7 суток, где суфентанил имеет растворимость в указанном резервуаре, по меньшей мере, 1 мас.%, резервуар имеет толщину от 0,0125 до 0,1 мм; и указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 10 мкг/см²/ч.

75. Пластырь по п.74, где резервуар содержит от примерно 0,05 до примерно 1,75 мг/см² суфентанила основания.

76. Пластырь по п.1, фармакологически эквивалентный трансдермальной фентаниловой системе DURAGESIC®.

77. Пластырь по п.43, фармакологически эквивалентный трансдермальной фентаниловой системе DURAGESIC®.

78. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, имеющий толщину от 0,0125 мм до 0,1 мм, расположенный на подложке, причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара состоит из полиакрилатного адгезива, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно $20 \text{ мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$ и стандартизированную C_{max} от примерно 0,001 до примерно 0,2 нг/(мл·см²).

79. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, имеющий толщину от 0,0125 до 0,1 мм, расположенный на подложке, причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара состоит из терполимерного адгезива, полученного полимеризацией мономеров, выбранных из группы, состоящей из акриловой кислоты, метакриловой кислоты, метоксиэтилакрилата, этилакрилата, бутилакрилата, бутилметакрилата, гексилакрилата, гексилметакрилата, 2-этилбутилакрилата, 2-этилбутилметакрилата, изооктилакрилата, изооктилметакрилата, 2-этилгексилакрилата, 2-этилгексилметакрилата, децилакрилата, децилметакрилата, додецилакрилата, додецилметакрилата, тридецилакрилата, тридецилметакрилата, гидроксиэтилакрилата, гидроксипропилакрилата, акриламида, диметилакриламида, акрилонитрила, диметиламиноэтилакрилата, диметиламиноэтилметакрилата, трет-бутиламиноэтилакрилата, трет-бутиламиноэтилметакрилата,

метоксиэтилакрилата, метоксиэтилметакрилата, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 20 $\text{мкг} \cdot \text{см}^{-2} \cdot \text{ч}^{-1}$ и стандартизированную C_{max} от примерно 0,001 до примерно 0,2 $\text{нг}/(\text{мл} \cdot \text{см}^2)$.

80. Пластырь по п.79, где указанный адгезив является поперечно-сшитым.

81. Пластырь по п.79, где указанный полимер не является поперечно-сшитым.

82. Трансдермальный пластырь для введения через кожу фентанила, содержащий

(a) подложку;

(b) резервуар, имеющий толщину от 0,0125 мм до 0,1 мм, расположенный на подложке, причем, по меньшей мере, соприкасающаяся с кожей поверхность указанного резервуара состоит полимерного адгезива, полученного полимеризацией мономеров, причем по меньшей мере два мономера выбраны из группы, состоящей из акриловой кислоты, метакриловой кислоты, метоксиэтилакрилата, этилакрилата, бутилакрилата, бутилметакрилата, гексилакрилата, гексилметакрилата, 2-этилбутилакрилата, 2-этилбутилметакрилата, изооктилакрилата, изооктилметакрилата, 2-этилгексилакрилата, 2-этилгексилметакрилата, децилакрилата, децилметакрилата, додецилакрилата, додецилметакрилата, тридецилакрилата, тридецилметакрилата, гидроксиэтилакрилата, гидроксипропилакрилата, акриламида, диметилакриламида, акрилонитрила, диметиламиноэтилакрилата, диметиламиноэтилметакрилата, трет-бутиламиноэтилакрилата, трет-бутиламиноэтилметакрилата, метоксиэтилакрилата, метоксиэтилметакрилата, причем указанный резервуар состоит из однофазной полимерной композиции, свободной от

нерастворенных компонентов, содержащей количество фентанила, достаточное для того, чтобы вызвать и поддерживать аналгезию у человека в течение, по меньшей мере, трех суток, при этом указанный пластырь обнаруживает плотность потока лекарственного средства в стационарном состоянии от примерно 0,1 до примерно 20 $\text{мкг}\cdot\text{см}^{-2}\cdot\text{ч}^{-1}$ и стандартизированную C_{max} от примерно 0,001 до примерно 0,2 $\text{нг}/(\text{мл}\cdot\text{см}^2)$.

83. Пластырь по п.82, где указанный адгезив является поперечно-сшитым.

84. Пластырь по п.82, где указанный полимер не является поперечно-сшитым».

Примечание: При публикации сведений о выдаче патента будут использованы описание в редакции заявителя.