

Палата по патентным спорам в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 Гражданского кодекса Российской Федерации (далее – Кодекс), и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003, регистрационный № 4520, с изменениями от 11.12.2003 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение от 26.08.2009, поданное НОВАРТИС АГ, Швейцария (далее – заявитель), на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности, патентам и товарным знакам (далее – Роспатент) об отказе в выдаче патента на изобретение по заявке №2004126862/04, при этом установлено следующее.

Заявлена группа изобретений "Соли валсартана", совокупность признаков которого изложена в формуле изобретения, уточненной заявителем в корреспонденциях, поступивших 17.09.2007 и 02.10.2007 в следующей редакции:

« 1. Тригидрат кальциевой соли валсартана в кристаллической форме, характеризующийся порошковой рентгенограммой, полученной в камере Гинье и включающей следующие диапазоны межплоскостных расстояний, d в [А]: $16,0 \pm 0,3$, $11,4 \pm 0,2$, $10,0 \pm 0,2$, $9,4 \pm 0,2$, $8,06 \pm 0,1$, $7,75 \pm 0,1$, $7,03 \pm 0,1$, $6,48 \pm 0,05$, $6,10 \pm 0,05$, $5,16 \pm 0,05$, $4,75 \pm 0,05$.

2. Тригидрат кальциевой соли валсартана в кристаллической форме, характеризующийся порошковой рентгенограммой, полученной в камере Гинье и включающей следующие диапазоны межплоскостных расстояний, d в [А]: $16,2 \pm 0,3$, $11,5 \pm 0,2$, $9,9 \pm 0,2$, $9,4 \pm 0,2$, $7,04 \pm 0,1$, $6,50 \pm 0,05$, $5,79 \pm 0,05$, $4,74 \pm 0,05$, $4,16 \pm 0,05$, $3,96 \pm 0,05$.

3. Тригидрат кальциевой соли валсартана в кристаллической форме, характеризующийся порошковой рентгенограммой, полученной в камере Гинье и включающей следующие диапазоны межплоскостных расстояний,

(i) d в [А]: $16,1 \pm 0,3$, $11,4 \pm 0,2$, $9,9 \pm 0,2$, $9,4 \pm 0,2$, $9,0 \pm 0,2$, $7,03 \pm 0,1$, $6,47 \pm 0,05$, $5,79 \pm 0,05$, $4,15 \pm 0,05$, $3,94 \pm 0,05$; или

(ii) ПОЗ-ИК спектром, в котором имеются следующие полосы поглощения, выраженные в волновых числах (см^{-1}): 1621 (с.); 1577 (ср.); 1458 (ср.); 1405 (ср.); 1354 (сл.); 1273 (сл.); 1012 (сл.); 756 (ср.); 737 (ср.); 667 (ср.).

4. Моногидрат кальциевой соли валсартана в кристаллической форме, характеризующийся порошковой рентгенограммой, полученной в камере Гинье и включающей следующие диапазоны межплоскостных расстояний, d в [А]: $16,0 \pm 0,3$, $15,0 \pm 0,3$, $11,6 \pm 0,2$, $9,4 \pm 0,2$, $7,53 \pm 0,1$, $6,11 \pm 0,05$.

5. Пентагидрат дикальциевой соли валсартана в кристаллической форме, характеризующийся порошковой рентгенограммой, полученной в камере Гинье и включающей следующие диапазоны межплоскостных расстояний, d в [А]: $15,5 \pm 0,3$, $11,5 \pm 0,2$, $9,4 \pm 0,2$, $9,04 \pm 0,1$, $6,46 \pm 0,05$, $6,09 \pm 0,05$, $5,82 \pm 0,05$, $5,16 \pm 0,05$, $4,48 \pm 0,05$, $3,60 \pm 0,05$.

6. Аморфная кальциевая соль валсартана, характеризующая, ПОЗ-ИК спектром, в котором имеются следующие полосы поглощения, выраженные в волновых числах (см^{-1}): 3587; 3307; 3182; 3053; 2961; 2870; 2358; 1621; 1578; 1506; 1459; 1441; 1417; 1364; 1319; 1301; 1274; 1211; 1180; 1137; 1105; 1099; 1013; 1003; 974; 941; 864; 856; 844; 823; 758; 738; 666.

7. Аморфная кальциевая соль валсартана по п. 6, отличающаяся тем, что при нагреве от температуры существенно ниже 0°C в открытой или

закрытой чашке для образца до 220°C или более высокой температуры наблюдается переход в стеклообразное состояние с изменением удельной теплоемкости, а температура плавления и энтальпия плавления не регистрируются.

8. Аморфная кальциевая соль валсартана по п.6, характеризующаяся

- (i) содержанием воды $11\pm 2\%$
- (ii) температурой стеклования $94\pm 20^\circ\text{C}$
- (iii) отсутствием температуры плавления
- (iv) отсутствием энтальпии плавления.

9. Аморфная кальциевая соль валсартана, характеризующаяся, брутто-формулой $(\text{C}_{24}\text{H}_{27}\text{N}_5\text{O}_3)^{2-} \text{Ca}^{2+}$, с содержанием воды 8,8%.

10. Аморфная кальциевая соль валсартана по п. 9, отличающаяся тем, что при нагреве от температуры существенно ниже 0°C в открытой или закрытой чашке для образца до 220°C или более высокой температуры наблюдается переход в стеклообразное состояние с изменением удельной теплоемкости, а температура плавления и энтальпия плавления не регистрируются.

11. Аморфная кальциевая соль валсартана по п. 9, характеризующаяся

- (i) содержанием воды $9\pm 2\%$
- (ii) температурой стеклования $143\pm 20^\circ\text{C}$
- (iii) отсутствием температуры плавления
- (iv) отсутствием энтальпии плавления.

12. Фармацевтическая композиция, обладающая антагонистической активностью в отношении рецептора АТ₁, содержащая соль по п.п. 1-11 и фармацевтически приемлемый наполнитель или добавку.

13. Фармацевтическая композиция по п.12, дополнительно содержащая, по меньшей мере, одно соединение, выбранное из группы, состоящей из:

(i) ингибитора HMG-Co-A редуктазы или его фармацевтически приемлемой соли,

(ii) ингибитора фермента, превращающего ангиотензин (ACE), или его фармацевтически приемлемой соли,

(iii) агента, блокирующего кальциевый канал, или его фармацевтически приемлемой соли,

(iv) ингибитора альдостерон-синтазы или его фармацевтически приемлемой соли,

(v) антагониста альдостерона или его фармацевтически приемлемой соли,

(vi) двойственного ингибитора фермента, превращающего ангиотензин, и нейтральной эндопептидазы (ACE/NEP), или его фармацевтически приемлемой соли, (vii) антагониста эндотелина или его фармацевтически приемлемой соли,

(viii) ингибитора ренина или его фармацевтически приемлемой соли, и

(ix) диуретика или его фармацевтически приемлемой соли».

По результатам рассмотрения заявки по существу Роспатентом было принято решение от 20.08.2008 об отказе в выдаче патента из-за

несоответствия заявленной группы изобретений условию патентоспособности "изобретательский уровень".

В решении Роспатента отмечено, что заявленная группа изобретений раскрыта в формуле и описании к заявке WO 02/06253, опубл. 24.01.2002 (далее – [1]), из которой известны кальциевые соли валсартана, в том числе кристаллические, частично кристаллические или аморфные формы указанных солей, а также известна фармацевтическая композиция, содержащая кальциевую соль валсартана и обладающая антагонистической активностью. В описании заявки [1] экспериментально подтвержден факт получения тетрагидрата кальциевой соли, которая подробно описана в данном источнике информации. При этом в решении Роспатента обращается внимание на то, что на листе 77 описания к заявленному предложению приведен пример фармкомпозиции, содержащей в качестве активного компонента тетрагидрат кальциевой соли вальсартана, известный из описания к заявке [1], а не заявленных кальциевых солей валсартана в кристаллической и аморфной форме (тригидрат, или моногидрат, или пентагидрат кристаллической кальциевой соли валсартана, аморфная кальциевая соль валсартана).

В решении Роспатента отмечено, что, с учетом известности кальциевых солей валсартана и их кристаллических модификаций, заявленное изобретение могло быть рассмотрено как «селективное изобретение», при этом заявителю следовало подтвердить, что все заявленные новые полиморфные формы кальциевой соли валсартана обладают неожиданными и/или улучшенными свойствами по сравнению с соответствующей солью, известной из описания к заявке [1], однако, заявителем, несмотря на многочисленные запросы, указанные сведения представлены не были.

В отказе Роспатента также обращается внимание на то, что заявитель

сопоставляет свойства заявленных гидратов кальциевой соли валсартана (тригидрата, или моногидрата, или пентагидрата) не с конкретной кальциевой солью валсартана, известной из уровня техники (заявка [1]), а со «свободной кислотой». Кроме того, в запросах заявителю неоднократно указывалось на то, что обоснование патентоспособности необходимо осуществлять по отношению ко всем заявленным кальциевым солям валсартана (три полиморфные кристаллические формы тригидрата кальциевой соли валсартана по п. 1-3 формулы, полиморфная кристаллическая формы моногидрата кальциевой соли валсартана по п. 4 формулы, полиморфная кристаллическая форма пентагидрата дикальциевой соли валсартана по п. 5, аморфная кальциевая соль валсартана по п. 6 формулы), причем обоснование патентоспособности должно быть показано для всех кристаллических и аморфных форм, указанных в независимых пунктах 1-6 формулы заявленного изобретения.

В связи с тем, что заявитель не представил экспериментальные данные, обосновывающие патентоспособность заявленной группы изобретений, было принято решение об отказе в выдаче патента на изобретение.

Заявитель выразил несогласие с решением экспертизы в своем возражении, поданном в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса и отметил следующее.

Заявитель считает, что:

- в заявке [1] указаны соли валсартана, среди которых описана единственная кальциевая соль валсартана в виде ее тетрагидрата, при этом в данном источнике информации отсутствуют какие-либо сведения, подтверждающие преимущества этой соли в сравнении с самим валсартаном (диованом);

- в описании заявленного изобретения подробно описано получение кальциевых солей в виде их три-, моно-, пентагидратов, а также аморфных кальциевых солей, причем ранее данные соединения нигде не были описаны и являются новыми антигипертензивными средствами;

- требование представления данных о том, что каждая заявленная новая полиморфная форма кальциевой соли валсартана обладает неожиданными и/или улучшенными свойствами по сравнению со свойствами тетрагидрата кальциевой соли валсартана, известными из заявки [1], не может быть выполнено, поскольку в заявке [1] отсутствуют данные по активности тетрагидрата кальциевой соли валсартана, и единственное с чем можно было бы привести сравнение – это с известным и широко применяемым в терапевтической практике препаратом диован (соединение валсартана в виде свободной кислоты). Для подтверждения преимуществ заявленных солей над свободной кислотой заявителем были представлены указанные выше данные;

- в ответе заявителя от 17.09.2007 приведены преимущества кальциевых солей валсартана над коммерчески доступным продуктом – диован;

- хорошо известно, что индивидуальные особенности людей требуют использования широкого разнообразия близких по природе активных соединений, и различные гидратные формы кальциевых солей валсартана используют для расширения ассортимента, соответственно, Правилами ИЗ предусматривается возможность защиты соединений для расширения арсенала средств.

На основании данных доводов заявитель считает, что заявленная группа изобретений соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Изучив материалы дела и заслушав присутствующих участников

рассмотрения, коллегия палаты по патентным спорам установила следующее.

С учетом даты поступления заявки правовая база для оценки патентоспособности заявленного изобретения включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 № 3517-1 с учетом изменений и дополнений, внесенных Федеральным законом № 22 – ФЗ от 07.02.2003 "О внесении изменений и дополнений в Патентный закон Российской Федерации" (далее – Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 6 июня 2003г. № 82, зарегистрированные в Минюсте РФ 30 июня 2003г. рег. № 4852 (далее - Правила ИЗ) и упомянутые выше Правила ППС.

Согласно пункту 1 статьи 4 Закона в качестве изобретения охраняется техническое решение в любой области, относящееся к продукту (в частности, устройству, веществу, штамму микроорганизма, культуре клеток растений или животных) или способу (процессу осуществления действий над материальным объектом с помощью материальных средств). Изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

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

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

В соответствии с подпунктом (2) пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение признается не следующим для специалиста явным образом из уровня техники, в том случае, когда не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения

выявлены, но не подтверждена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Проверка соблюдения указанных условий включает:

- определение наиболее близкого аналога;
- выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);
- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения;
- анализ уровня техники с целью установления известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на указанный заявителем технический результат.

В соответствии с пунктом 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 патентных документов - указанная на них дата опубликования.

В соответствии с подпунктом (4) пункта 19.5.3. Правил ИЗ условию изобретательского уровня соответствуют, в частности химическое соединение, подпадающие под общую структурную формулу группы известных соединений, но не описанное как специально полученное и исследованное, и при этом проявляющее новые неизвестные для этой группы свойства в качественном и количественном отношении (селективное изобретение).

Согласно подпункту (2) пункта 3.2.4.5. Правил ИЗ для биологически активного соединения приводятся количественная характеристика активности и сведения о токсичности, а в случае необходимости – об избирательности действия и другие показатели.

Если изобретение относится к средству для лечения, диагностики или профилактики определенного состояния или заболевания людей или животных, приводятся достоверные данные, подтверждающие его пригодность для реализации назначения, в частности сведения о влиянии этого средства на определенные звенья физиологических или патологических процессов или о связи с ними.

Если изобретение относится к группе (ряду) химических соединений с установленной структурой, описываемых общей структурной формулой, подтверждается возможность получения всех соединений группы (ряда) путем приведения общей схемы способа получения, а также примера получения конкретного соединения группы (ряда), а если группа (ряд) включает соединения с разными по химической природе радикалами – примеров, достаточных для подтверждения возможности получения соединений с этими разными радикалами.

Для полученных соединений приводятся также их структурные формулы, подтвержденные известными методами, физико-химические константы, доказательства возможности реализации указанного назначения с подтверждением такой возможности в отношении некоторых соединений с разными по химической природе радикалами.

Если изобретение относится к композиции, приводятся примеры, в которых указываются ингредиенты, входящие в состав композиции, их характеристика и количественное содержание. Описывается способ получения композиции, а если она содержит в качестве ингредиента новое вещество, описывается способ его получения.

Существо заявленной группы изобретений выражено в приведённой выше формуле, которую коллегия палаты по патентным спорам принимает к рассмотрению.

Анализ доводов, содержащихся в решении Роспатента и доводов заявителя относительно патентоспособности заявленной группы изобретений показал следующее.

В формуле заявленного предложения описаны различные кристаллические формы тригидрата кальциевой соли валсартана (независимые пункты 1, 2, 3 формулы), кристаллическая форма моногидрата кальциевой соли валсартана (независимый пункт 4 формулы), кристаллическая форма пентагидрата дикальциевой соли валсартана (независимый пункт 5 формулы), аморфная форма кальциевой соли валсартана (независимый пункт 6 формулы), фармацевтическая композиция, обладающая антагонистической активностью (независимый пункт 12 формулы).

Следует отметить, что в заявке [1] раскрыты кальциевые соли валсартана, в том числе кристаллические, частично кристаллические и аморфные формы указанных солей. В описании к заявке [1] экспериментально подтвержден факт получения тетрагидрата кальциевой соли, которая подробно описана в данном источнике информации. Заявленные различные кристаллические формы тригидрата кальциевой соли валсартана (независимые пункты 1, 2, 3, формулы), кристаллическая форма моногидрата кальциевой соли валсартана (независимый пункт 4 формулы), кристаллическая форма пентагидрата дикальциевой соли валсартана (независимый пункт 5 формулы), аморфные формы кальциевой соли валсартана (независимый пункт 6 формулы), подпадающие под общую формулу кальциевых солей вальсартана, известных из описания к заявке [1]. При этом они не описаны в указанной заявке [1] как специально полученные и исследованные.

Ввиду вышеизложенного можно констатировать, что заявленная группа изобретений могла быть признана соответствующей условию патентоспособности в соответствии с подпунктом (4) пункта 19.5.3. Правил ИЗ в качестве химических соединений, подпадающих под общую структурную формулу группы известных соединений, но не описанных как специально полученные и исследованные, и при этом проявляющие новые неизвестные для этой группы свойства в качественном и количественном отношении (селективное изобретение), только в случае, если заявителем были бы представлены достоверные данные, подтверждающие, что новые полиморфные формы кальциевой соли валсартана обладают неожиданным и/или улучшенными свойствами по сравнению с известным из заявки [1] тетрагидратом кальциевой соли валсартана.

При этом следует отметить, что заявитель не сформулировал преимущества заявляемых полиморфных форм кальциевых солей валсартана по сравнению с известными из уровня техники полиморфными формами кальциевых солей валсартана, а также не представил подтверждение сформулированного технического результата конкретно по каждому объекту заявленной группы изобретений.

В связи с тем, что заявителем не были представлены указанные выше сведения, и, соответственно, не показано какие новые неизвестные для заявленной группы изобретений свойства в качественном и количественном отношении проявляют указанные в независимых пунктах формулы полиморфные формы кальциевой соли валсартана, не представляется возможным признать заявленную группу изобретений соответствующей условию патентоспособности "изобретательский уровень" согласно пункта 19.5.3.(4).

Что касается заявленной в независимом пункте 12 фармкомпозиции, то из описания к заявке [1] известна фармкомпозиция, содержащая

тетрагидрат кальциевой соли валсартана, при этом в описании заявленного предложения также содержится только пример с тетрагидратом кальциевой соли валсартана и отсутствуют примеры фармкомпозиций, содержащие заявленные гидраты кальциевой соли валсартана.

В отношении доводов заявителя, касающихся того, что им были представлены данные, показывающие преимущества, достигаемые благодаря использованию солей валсартана по сравнению с коммерчески доступным продуктом - диованом («свободной кислотой»), можно отметить следующее.

Техническим результатом как от применения изобретения по заявке [1], так и заявленного предложения является создание более стабильных, по сравнению с самим валсартаном («свободной кислотой») форм, обладающих лучшей растворимостью. При этом указанный технический результат достигается за счет использования кальциевых солей валсартана в кристаллической, частично кристаллической и аморфной формах, как указано в описании к заявке [1] и в описании заявленной группы изобретений.

Объектами заявленного группы изобретения являются различные кристаллические формы гидратов кальциевой соли валсартана и аморфная кальциевая соль валсартана, которые также являются более стабильными по сравнению с самим валсартаном («свободной кислотой») формами и обладают лучшей растворимостью.

Вместе с тем, заявителем не были представлены достоверные данные, подтверждающие, что новые полиморфные формы кальциевой соли валсартана обладают неожиданным и/или улучшенными свойствами по сравнению с известным из заявки [1] тетрагидратом кальциевой соли валсартана.

Таким образом, в возражении не содержится доводов, позволяющих

опровергнуть вывод Роспатента о том, что заявленное предложение не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Учитывая изложенное, коллегия палаты по патентным спорам решила:

отказать в удовлетворении возражения от 26.08.2009, решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности, патентам и товарным знакам от 20.08.2008 оставить в силе.