

ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии палаты по патентным спорам
по результатам рассмотрения возражения заявления

Коллегия палаты 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 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела поданное «ЭМИСФИРЕ ТЕКНОЛОДЖИС, ИНК», США (далее – заявитель) возражение, поступившее в палату по патентным спорам 26.06.2012, на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее - Роспатент) от 22.12.2011 об отказе в выдаче патента Российской Федерации на изобретение по заявке № 2008103699/04, при этом установлено следующее.

Заявлена группа изобретений «Кристаллические формы динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты», совокупность признаков которых изложена в формуле, содержащей 10 независимых пунктов и представленной заявителем в корреспонденции от 28.10.2011, в следующей редакции:

«1. Фармацевтический состав для доставки биологически активного агента, содержащий

(а) кристаллический моногидрат динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, порошковая рентгенограмма которого содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 10,4, 14,2, 15,0, 15,5, 16,1, 18,4, 20,8, 23,6, 24,1, 24,5, 24,8, 25,4, 26,6, 27,2, 27,5, 29,6 и 31,5 градусах;

(б) кристаллический моногидрат динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, порошковая рентгенограмма которого содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2 и 24,7; и

(в) биологически активный агент.

2. Фармацевтический состав по п.1, отличающийся тем, что указанный активный агент представляет собой кальцитонин.

3. Фармацевтический состав по п.3, отличающийся тем, что указанный активный агент представляет собой гормон роста.

4. Фармацевтический состав по п.1, содержащий дополнительно гормон паращитовидной железы.

5. Форма II динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, представляющая собой, кристаллический этанолсольват динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, порошковая рентгенограмма которого содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 14,1, 16,5, 18,5, 25 и 26 градусах.

6. Форма II динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты по п.6, отличающийся тем, что порошковая рентгенограмма указанного кристаллического этанольного сольвата содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$ выбранный из группы, включающей пики при 16,5, 25 и 26 градусах.

7. Форма III динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, представляющая собой октагидрат динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, причем порошковая рентгенограмма указанного

октагидрата содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 4,8, 10,4, 11,7 и 14,6 градусах.

8. Форма IV динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, представляющая собой кристаллический моногидрат указанной динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, порошковая рентгенограмма которого содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2 и 24,7 градусах.

9. Фармацевтический состав, для доставки биологически активного агента, содержащий кристаллический полиморф по одному из пп.5-8 и биологически активный агент.

10. Фармацевтический состав по п.9, отличающийся тем, что указанный биологически активный агент представляет собой кальцитонин.

11. Фармацевтический состав по п.10, содержащий дополнительно гормон паращитовидной железы.

12. Фармацевтический состав по п.9, отличающийся тем, что указанный биологически активный агент представляет собой инсулин.

13. Фармацевтический состав по п.9, отличающийся тем, что указанный биологически активный агент представляет собой гормон роста.

14. Способ получения моноэтанолсольвата динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты (форма II) по п.п. 5 или 6, включающий следующие операции:

а) добавление гидроксида натрия к раствору N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты и этанола;

(б) осаждение из раствора формы II динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты;

(в) выдерживание смеси при температуре менее 10 С в течение по меньшей мере 4 часов;

(г) отделение формы II динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты с помощью центрифугирования; и

(д) сушка формы II динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в вакууме в течение от 16 до 24 часов.

15. Способ получения октагидрата N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты по п.7, включающий выдержку моноэтанолсольвата динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты при относительной влажности по меньшей мере 75% в течение времени по меньшей мере суток.

16. Способ получения формы IV динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты (форма II) по п.8, включающий следующие операции:

а) растворение моногидрата динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты(форма I) в метилкетоне до 50 С; и

(б) охлаждение раствора метилкетона, полученного на операции (а), до комнатной температуры с образованием формы IV динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, при этом

порошковая рентгенограмма формы I содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\ominus} \pm 0,2^{\circ}$ 2^{\ominus} , выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 10,4, 14,2, 15,0, 15,5, 16,1, 18,4, 20,8, 23,6, 24,1, 24,5, 24,8, 25,4, 26,6, 27,2, 27,5, 29,6 и 31,5 градусах.

17. Способ получения смеси форм I и IV динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, включающий операцию охлаждения 50 до 60 С раствора динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, ацетона и гидроксида натрия в течение периода времени в интервале от 16 до 24 часов для образования указанной смеси форм I и IV, при этом

порошковая рентгенограмма формы I содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ}$ 2^{Θ} , выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 10,4, 14,2, 15,0, 15,5, 16,1, 18,4, 20,8, 23,6, 24,1, 24,5, 24,8, 25,4, 26,6, 27,2, 27,5, 29,6 и 31,5 градусах;

порошковая рентгенограмма формы IV содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ}$ 2^{Θ} , выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2 и 24,7.»

По результатам проведения экспертизы по существу было принято решение Роспатента об отказе в выдаче патента на группу изобретений из-за несоответствия изобретений заявленной группы условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В подтверждение данного мнения в решении указан следующий источник информации:

- заявка США US 2004/0106825, с датой публикации от 03.06.2004 (далее [1]).

В соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса заявитель подал в палату по патентным спорам возражение на решение Роспатента, в котором отметил, что известность решений по патентному документу [1] не является основанием для признания заявленной группы изобретений несоответствующей условию патентоспособности «изобретательский уровень».

По мнению заявителя каждый из объектов заявленной группы изобретений характеризуется отличительными от известных из патентного документа [1] решений признаками. В частности в возражении указано, что отличие заявленных

форм динатриевых солей N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты от моноэтанолсольвата динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, описанного в патентном документе [1], заключается в иной в кристаллической форме известного вещества, охарактеризованной данными рентгеноструктурного анализа. При этом заявленные способы получения новых форм отличаются от способа, раскрытого в патентном документе [1], последовательностью стадий и условиями осуществления процесса. Соответственно и заявленные фармацевтические составы, используемые для доставки активных веществ, на основе новых (заявленных) кристаллических полиморфов, отличаются от составов, описанных в патентном документе [1]. Заявитель отмечает, что «задачей заявленной группы решений является расширение арсенала технических средств, но при этом задача получения форм имеющих преимущества по отношению к известному уровню техники, в частности по отношению к формам раскрытым в патентном документе [1] не ставилась».

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения возражения, коллегия палаты по патентным спорам установила следующее.

С учетом даты подачи международной заявки (18.09.2006) правовая база для оценки патентоспособности заявленной группы изобретений включает Патентный закон Российской Федерации от 23.09.1992 №3517-1 с учетом изменений и дополнений, внесенных Федеральным законом "О внесении изменений и дополнений в патентный закон Российской Федерации" № 22-ФЗ от 07.02.2003 (далее - Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 06.06.2003 №82, и зарегистрированные в Министерстве юстиции Российской Федерации 30.06.2003 № 4852 с изменениями и дополнениями, внесенными приказом Роспатента от 11.12.2003, № 161, зарегистрированным Минюстом России 17.12.2003, рег. № 5334 (далее – Правила ИЗ), и Правила ППС.

В соответствии с пунктом 1 статьи 4 Закона изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

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

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

В соответствии с подпунктом 1 пункта 3.3.1 Правил ИЗ, формула изобретения предназначается для определения объема правовой охраны, предоставляемой патентом.

В соответствии с подпунктом 1 пункта 19.5.3. Правил ИЗ изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

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

Проверка соблюдения указанных условий включает определение наиболее близкого аналог, 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.

Согласно подпункту 4 пункта 19.5.3 Правил ИЗ условию изобретательского уровня соответствуют, в частности:

- способы получения новых химических соединений (класса, группы) с установленной структурой;
- способы получения известных химических соединений (класса, группы) с установленной структурой, если они основаны на новой для данного класса или

группы соединений реакции или на известной для данного класса или группы соединений реакции, условия проведения которой не известны;

- композиция, состоящая, по крайней мере, из двух известных ингредиентов, обеспечивающая синергетический эффект, возможность достижения которого не вытекает из уровня техники (т.е. проявляющая свойства обоих ингредиентов, но количественные показатели хотя бы одного из этих свойств выше показателей свойств отдельного ингредиента);

- химическое соединение, подпадающее 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 или количественном отношении (селективное изобретение).

Согласно подпункту 2 пункта 3.2.4.5 Правил ИЗ для изобретения, относящегося к химическому соединению с установленной структурой, приводятся структурная формула, доказанная известными методами, физико-химические константы, описывается способ, которым соединение получено, и показывается возможность использования изобретения по указанному назначению.

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 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 соединения являются биологически активными, приводятся показатели активности и токсичности для этих соединений, а в случае необходимости - избирательности действия и другие показатели.

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.

В соответствии с подпунктом 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.

Согласно п. 4.9 Правил ППС при рассмотрении возражения коллегия Палаты по патентным спорам вправе предложить лицу, подавшему заявку на выдачу патента на изобретение внести изменения в формулу изобретения.

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

Существо заявленной группы изобретений выражено в приведенной выше формуле, содержащей 10 независимых пунктов.

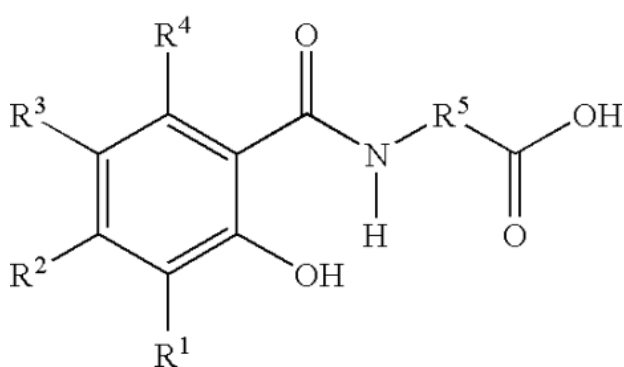
Анализ доводов возражения и доводов, содержащихся в решении Роспатента, касающихся оценки соответствия заявленной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень» показал следующее.

Заявленная группа изобретений относится к кристаллическим формам известного соединения, к способам их получения и использования, в частности, заявлены кристаллические формы динатриевых солей N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, охарактеризованные конкретными спектрами рентгеноструктурного анализа (пункты 5-8 формулы), способы получения

указанных форм (пункты 14-17) и фармацевтические составы на основе заявленных кристаллических полиморфов для доставки биологического агента (пункты 1-4, 9-13 формулы).

Из патентного документа [1] известен моноэтанолсольват динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в кристаллической форме и способ его получения (с.10, пример 2), а также фармацевтические составы на его основе, используемые для доставки активных веществ.

Динатриевые соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты описаны общей структурной формулой, представленной в патентном документе [1]:



где

R¹, R², R³ и R⁴ независимо представляют водород, —OH, —NR⁶R⁷, галоген, C₁-C₄ алкил или C₁-C₄ алкокси;

R⁵ представляет собой замещенный или незамещенный C₂-C₆ алкилен, замещенный или незамещенный C₂-C₁₆ алкенилен, замещенный или незамещенный C-C₁₋₂ алкил(арил) или замещенный или незамещенный арил(C —C₁₋₂ алкилен); и

R⁶ и R⁷ независимо представляют собой водород, кислород или C₁-C₄ алкил.

Однако, в патентном документе [1] не раскрыты как таковые конкретные динатриевые соли (индивидуальные химические соединения), формы которых заявлены в пунктах 5-8 приведенной выше формулы изобретения, не приведены наименования, не упоминаются как исследованные. Соответственно не раскрыты и составы на их основе.

Вместе с тем из материалов заявки на выдачу патента не следует, что заявленные формы химических соединений, подпадающие под общую структурную формулу, представленную в патентном документе [1], а также составы на их основе, были исследованы и проявляют какие-либо новые неизвестные для этой

группы свойства в качественном или количественном отношении, т.е. отсутствуют данные о наличии у заявленных форм полезных свойств, которыми не обладают структурные аналоги динатриевых солей известные из патентного документа [1], и/или о наличии новых в количественном отношении свойств.

Следовательно, в соответствии с подпунктом 4 пункта 19.5.3 Правил ИЗ объекты, заявленные в пунктах 1-4 и 5-13 формулы, не могут быть признаны соответствующими условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В отношении способов получения форм динатриевых солей N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты по пунктам 14-17 формулы, необходимо отметить следующее. Действительно, заявленные способы получения конкретных форм динатриевых солей основаны на проведении известной для данного класса (группы) соединений реакции, однако отличаются от способов, описанных в патентном документе [1], условиями проведения реакции и последовательностью действий.

Таким образом, представленный в решении Роспатента уровень техники не подтверждает несоответствие способов получения конкретных форм динатриевых солей, заявленных в пунктах 14-17 формулы, условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Заявителю было предложено в соответствии с пунктом 4.9 Правил ППС внести изменения в приведенную выше формулу.

На заседании коллегии от 07.09.2012 заявителем была представлена уточненная формула изобретения, характеризующая группу изобретений в следующей редакции:

«1. Способ получения динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата, включающий следующие стадии:

(а) добавление гидроксида натрия к раствору N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты и этанола;

(б) осаждение из раствора формы II динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата;

(в) выдерживание смеси при температуре менее 10 С в течение по меньшей мере 4 часов;

(г) отделение динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата с помощью центрифугирования; и

(д) сушка формы II динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата в вакууме в течение от 16 до 24 часов.

2. Способ по п.1, отличающийся тем, что указанная динатриевая соль N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\ominus} \pm 0,2^{\circ} 2^{\ominus}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 14,1, 16,5, 18,5, 25 и 26 градусах.

3. Способ по п.1, отличающийся тем, что указанная динатриевая соль N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата, содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\ominus} \pm 0,2^{\circ} 2^{\ominus}$, выбранный из группы, включающей пики при 16,5, 25 и 26.

4. Способ получения N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде октагидрата, включающий выдержку моноэтанолсольвата динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты при относительной влажности по меньшей мере 75% в течение времени по меньшей мере 6 суток.

5. Способ по п.1, отличающийся тем, что указанная динатриевая соль N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде октагидрата содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\ominus} \pm 0,2^{\circ} 2^{\ominus}$, выбранный из группы, включающей пики при 4,8, 10,4, 11,7 и 14,6.

6. Способ получения динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моногидрата, включающий следующие операции:

(а) растворение моногидрата динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в метилэтилкетоне и нагревание до 50°C; при этом порошковая рентгенограмма указанного моногидрата содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 10,4, 14,2, 15,0, 15,5, 16,1, 18,4, 20,8, 23,6, 24,1, 24,5, 24,8, 25,4, 26,6, 27,2, 27,5, 29,6 и 31,5 градусах; и

(б) охлаждение раствора метилэтилкетона, полученного на операции (а), до комнатной температуры с образованием динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моногидрата.

7. Способ по п.6, отличающийся тем, что указанная динатриевая соль N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моногидрата содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2, и 24,7.

8. Способ получения смеси двух моногидратов динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, включающий операцию охлаждения раствора динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, ацетона и гидроксида натрия, имеющего температуру в интервале от 50 до 60°C, в течение периода времени в интервале от 16 до 24 часов для образования указанной смеси форм.

9. Способ по п.8, отличающийся тем, что

порошковая рентгенограмма первого моногидрата содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 10,4, 14,2, 15,0, 15,5, 16,1, 18,4, 20,8, 23,6, 24,1, 24,5, 24,8, 25,4, 26,6, 27,2, 27,5, 29,6 и 31,5 градусах; и

порошковая рентгенограмма второго моногидрата содержит по меньшей мере один пик, охарактеризованный в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2, и 24,7».

Данная формула была принята коллегией палаты по патентным спорам к рассмотрению и в соответствии с пунктом 5.1 Правил ППС направлена для проведения дополнительного информационного поиска.

В палату по патентным спорам были представлены результаты дополнительного информационного поиска в отношении измененной формулы и заключение, согласно которому не выявлено каких-либо дополнительных технических решений, известность которых препятствует признанию заявленной группы изобретений в рамках уточненной формулы патентоспособной.

Однако, в отношении пунктов 6-9 формулы заявленного изобретения в указанном заключении отмечено, что притязания заявителя распространялись только на конкретную форму моногидрата и частные формы смеси двух моногидратов динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, а сведения о получении моногидрата динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты и смеси двух моногидратов динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты как о таковых, отсутствовали.

На заседании коллегии палаты по патентным спорам от 01.02.2013 заявитель представил формулу изобретения, из которой исключены пункты 8 и 9, а пункты 6-7 уточнены с учетом замечаний, указанных в заключении, в следующей редакции:

6. Способ получения динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моногидрата, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2, и 24,7, включающий следующие операции:

(а) растворение в метилэтилкетоне и нагревание до 50°C моногидрата динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты,

характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 10,4, 14,2, 15,0, 15,5, 16,1, 18,4, 20,8, 23,6, 24,1, 24,5, 24,8, 25,4, 26,6, 27,2, 27,5, 29,6 и 31,5 градусах; и

(б) охлаждение раствора метилэтилкетона, полученного на операции (а), до комнатной температуры с образованием динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моногидрата, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2, и 24,7.

7. Способ получения смеси динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде

(а) моногидрата, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 10,4, 14,2, 15,0, 15,5, 16,1, 18,4, 20,8, 23,6, 24,1, 24,5, 24,8, 25,4, 26,6, 27,2, 27,5, 29,6 и 31,5 градусах; и

(б) моногидрата, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2, и 24,7,

включающий операцию охлаждения раствора динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, ацетона и гидроксида натрия, имеющего температуру в интервале от 50 до 60°C, в течение периода времени в интервале от 16 до 24 часов для образования указанной смеси форм».

При этом заявителем было отмечено, что «заявленные способы позволяют получить моногидрат динатриевой соли 5- CNAС, а также смесь форм, обладающих дополнительными преимуществами по сравнению с чистым моногидратом формы 1, в частности способности к растворению, что имеет значение при доставке

биологически активных агентов в организм пациента». Кроме того, заявитель отмечает, что новая (последняя) редакция формулы изобретения «изменена с учетом стилистических особенностей русского языка для придания однозначной определенности заявленным объектам, что позволяет более четко определить разницу между двумя динатриевыми солями 5- CНАС».

По результатам рассмотрения данной формулы изобретения установлено, что она не выходит за рамки первоначально поданных материалов заявки, не требует дополнительного информационного поиска, поскольку, как следует из дополнительного заключения, представленного на заседании коллегии от 01.02.2013, «поиск в отношении объектов, охарактеризованный в пунктах 6 и 7 был осуществлен на стадии экспертизы по существу» и соответствует условиям патентоспособности, предусмотренным пунктом 1 статьи 4 Закона.

Учитывая вышеизложенное, коллегия палаты по патентным спорам пришла к выводу о возможности:

удовлетворить возражение, поступившее 26.06.2012, отменить решение Роспатента от 22.12.2011 и выдать патент Российской Федерации на изобретение с уточненной заявителем 01.02.2013 формулой изобретения

«1. Способ получения динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата, включающий следующие стадии:

(а) добавление гидроксида натрия к раствору N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты и этанола;

(б) осаждение из раствора динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата;

(в) выдерживание смеси при температуре менее 10 С в течение по меньшей мере 4 часов;

(г) отделение динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата с помощью центрифугирования; и

(д) сушка динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата в вакууме в течение от 16 до 24 часов.

2. Способ по п.1, отличающийся тем, что указанная динатриевая соль N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 14,1, 16,5, 18,5, 25 и 26 градусах.

3. Способ по п.1, отличающийся тем, что указанная динатриевая соль N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты характеризуется порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 16,5, 25 и 26.

4. Способ получения динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде октагидрата, включающий выдержку динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моноэтанолсольвата при

относительной влажности по меньшей мере 75% в течение времени по меньшей мере 6 суток.

5. Способ по п.1, отличающийся тем, что указанная динатриевая соль N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты характеризуется порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 4,8, 10,4, 11,7 и 14,6.

6. Способ получения динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моногидрата, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2, и 24,7, включающий следующие операции:

(а) растворение в метилэтилкетоне и нагревание до 50°C моногидрата динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,5, 10,4, 14,2, 15,0, 15,5, 16,1, 18,4, 20,8, 23,6, 24,1, 24,5, 24,8, 25,4, 26,6, 27,2, 27,5, 29,6 и 31,5 градусах; и

(б) охлаждение раствора метилэтилкетона, полученного на операции (а), до комнатной температуры с образованием динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде моногидрата, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2, и 24,7.

7. Способ получения смеси динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты в виде

(а) моногидрата, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы,

включающей пики при 7,5, 10,4, 14,2, 15,0, 15,5, 16,1, 18,4, 20,8, 23,6, 24,1, 24,5, 24,8, 25,4, 26,6, 27,2, 27,5, 29,6 и 31,5 градусах; и

(б) моногидрата, характеризующегося порошковой рентгенограммой, содержащей по меньшей мере один пик в градусах $2^{\Theta} \pm 0,2^{\circ} 2^{\Theta}$, выбранный из группы, включающей пики при 7,2, 18,2, и 24,7,

включающий операцию охлаждения раствора динатриевой соли N-(5-хлорсалицилоил)-8-аминокаприловой кислоты, ацетона и гидроксида натрия, имеющего температуру в интервале от 50 до 60°C, в течение периода времени в интервале от 16 до 24 часов для образования указанной смеси форм».