

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

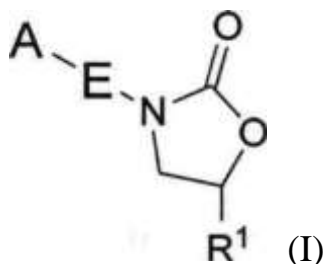
Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 231-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации и отдельные законодательные акты Российской Федерации» (далее - Кодекс) и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденные приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020, регистрационный № 59454, опубликованными на официальном интернет – портале правовой информации [www.pravo.gov.ru](http://www.pravo.gov.ru), 26.08.2020, № 0001202008260011, дата вступления в силу 06.09.2020 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение компании «МЕРК ШАРП И ДОУМ КОРП», США (далее – заявитель), поступившее 14.07.2022, на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее – Роспатент) от 15.12.2021 об отказе в выдаче патента на изобретение по заявке № 2018118090/04, при этом установлено следующее.

Заявка № 2018118090/04 на группу изобретений «ОКСАЗОЛИДИНОВЫЕ СОЕДИНЕНИЯ И СПОСОБЫ ИХ ПРИМЕНЕНИЯ В КАЧЕСТВЕ ПРОТИВОБАКТЕРИАЛЬНЫХ СРЕДСТВ» была подана 17.10.2016 по процедуре РСТ по заявке № US 2016/057257.

Приоритет установлен по дате 22.10.2015 подачи первой заявки PCT/CN 2015/092563 в государстве-участнике Парижской конвенции- CN.

Совокупность признаков группы заявленных решений изложена в формуле изобретения, представленной в корреспонденции, поступившей 20.10.2021, в следующей редакции:

«1. Соединение формулы I



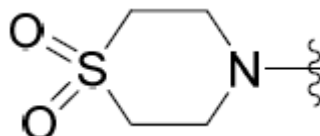
или его фармацевтически приемлемая соль, где:

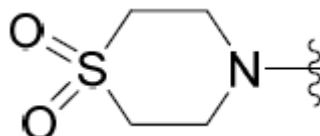
$R^1$  представляет собой  $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^2)_2$ , или  $-\text{CH}_2\text{NR}^2\text{COOR}^3$ ;

в каждом случае  $R^2$  независимо выбран из H или  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$  алкила;

$R^3$  представляет собой H или  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$  алкил;

E представляет собой фенил или пиридин, где указанный фенил или пиридин замещён одним или двумя атомами фтора;



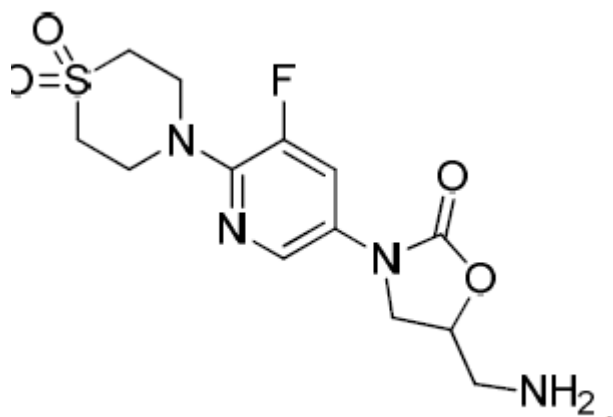
A представляет собой , где, когда  $R^1$  представляет собой  $-\text{CH}_2\text{N}(\text{R}^2)_2$ ,

$R^2$  представляет собой водород, то E представляет собой пиридин.

2. Соединение по п. 1 или его фармацевтически приемлемая соль, где:  $R^1$  представляет собой  $-\text{CH}_2\text{NR}^2\text{COOR}^3$  и в каждом случае  $R^2$  и  $R^3$  независимо выбираются из водорода и  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$  алкила.

3. Соединение по п. 1 или его фармацевтически приемлемая соль, где  $R^1$  представляет собой  $-\text{CH}_2\text{NHCOOCH}_3$ .

4. Соединение по п. 1, или его фармацевтически приемлемая соль, имеющее структуру:



5. Фармацевтическая композиция для лечения микобактериальной инфекции, которая содержит терапевтически эффективное количество соединения по любому из п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли, и фармацевтически приемлемый носитель.

6. Применение терапевтически эффективного количества соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли для лечения микобактериальной инфекции.

7. Применение по п. 6, при котором микобактериальная инфекция вызвана *Mycobacterium tuberculosis*.

8. Применение по п. 7, при котором *M. tuberculosis* представляет собой устойчивый к лекарственным средствам микобактериальный штамм.

9. Применение по пп. 6-8, при котором соединение или его фармацевтически приемлемую соль вводят перорально, парентерально или местно».

При вынесении решения Роспатентом от 15.12.2021 об отказе в выдаче патента на изобретение (далее – решение Роспатента об отказе) к рассмотрению была принята вышеприведенная формула.

В решении Роспатента об отказе сделан вывод о том, что заявленная группа изобретений не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» для альтернативы «где E обозначает фенил», на основании сведений, известных из следующих источников информации:

- международная публикация WO 95/07271 A1, опубликована 16.03.1995 (далее –[1], согласно решению Д11);

- международная публикация WO 2005/113529 A1, опубликована 01.12.2005 (далее –[2], согласно решению Д17).

Что касается соединения, относящегося к альтернативе заместителя «пиридин» (описано в примере 48 описания заявки), то в отношении него сделан вывод о его соответствии условиям патентоспособности.

На решение Роспатента об отказе в выдаче патента на изобретение, в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса, поступило возражение, в котором заявитель выразил согласие с доводами, приведенными в решении Роспатента об отказе, и представил скорректированную формулу изобретения.

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

С учетом даты подачи заявки (17.10.2016), правовая база для оценки патентоспособности заявленного решения включает Кодекс, Правила составления, подачи и рассмотрения документов, являющихся основанием для совершения юридически значимых действий по государственной регистрации изобретений, и их формы (далее – Правила ИЗ), Требования к документам заявки на выдачу патента на изобретение (далее - Требования ИЗ), утвержденные приказом Минэкономразвития Российской Федерации от 25 мая 2016 года № 316, зарегистрированным в Минюсте Российской Федерации 11 июля 2016 г., рег. № 42800.

В соответствии с пунктом 1 статьи 1350 Кодекса изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно пункту 2 статьи 1350 Кодекса изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники. Изобретение имеет изобретательский уровень, если для специалиста оно явным образом не

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

В соответствии с пунктом 75 Правил ИЗ при проверке изобретательского уровня изобретение признается имеющим изобретательский уровень, если установлено, что оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники. Изобретение явным образом следует из уровня техники, если оно может быть признано созданным путем объединения, изменения или совместного использования сведений, содержащихся в уровне техники, и (или) общих знаний специалиста.

Согласно пункту 77 Правил ИЗ не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные на создании средства, состоящего из известных частей, выбор которых и связь между которыми осуществлены на основании известных правил, рекомендаций, а достигаемый при этом технический результат обусловлен только известными свойствами частей этого средства и связей между ними.

Согласно пункту 78 Правил ИЗ условию изобретательского уровня соответствует 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 пункту 52 Требований ИЗ формула изобретения предназначена для определения объема правовой охраны изобретения, предоставляемой на основании патента.

Согласно пункту 39 Правил ППС при рассмотрении спора лицо, подавшее возражение (заявитель) вправе с представлением соответствующих материалов ходатайствовать, в частности, об изменении испрашиваемого объема правовой охраны изобретения, полезной модели

или промышленного образца с соблюдением требований статьи 1378 Кодекса.

Указанное ходатайство может быть подано при условии, если испрашиваемые изменения могут устранять причины, препятствующие предоставлению правовой охраны заявленному объекту, либо в случае, если без внесения соответствующих изменений в предоставлении правовой охраны должно быть отказано в полном объеме, а при их внесении – частично.

Существо заявленной группы изобретений изложено в приведенной выше формуле.

Анализ доводов возражения и доводов, содержащихся в решении Роспатента, показал следующее.

Из международной публикации [1] (см. формулу изобретения) известны производные оксазолидинила, представленные общей формулой I. Известные соединения предназначены для лечения микобактериальной инфекции, включая туберкулез. Также в международной публикации [1] раскрыты фармацевтическая композиции на их основе и применение для лечения заболеваний, вызванных микобактериальными инфекциями (см. формулу изобретения).

Заявленные в вышеприведенной формуле соединения частично подпадают под известные из международной публикации [1] (см. формулу изобретения) соединения. Так, в случае известных из международной публикации [1] соединений, когда R представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> алкокси, R<sup>2</sup> обозначает галоген, n=1, R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>-водород, а X обозначает группу SO<sub>2</sub>, известные из международной публикации [1] соединения соответствуют структурной формуле заявленных в вышеприведенной формуле соединений, при условии когда R<sup>1</sup> – обозначает –CH<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>COOR<sup>3</sup> (R<sup>2</sup>-H, R<sup>3</sup>-C<sub>1</sub>-Сбалкил), E обозначает фенил, замещенный галогеном (атомами фтора), А обозначает тиаморфолин-диоксид (заявленные соединения).

При этом данные химические соединения, указанные в вышеприведенной формуле и относящиеся к альтернативе, касающейся заместителя «фенил», не являются селективными, которым могла бы быть предоставлена правовая охрана, поскольку не описаны в материалах заявки на дату ее подачи как специально полученные, исследованные и при этом проявляющие новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении (см. пункт 78 Правил ИЗ).

Что касается соединения, относящегося к альтернативному признаку, относящемуся к заместителю «E представляет собой пиридин» (см. описание, пример 48), то можно согласиться с выводом, сделанным в решении Роспатента о патентоспособности соединения с упомянутым альтернативным заместителем.

В отношении альтернатив, характеризующихся заместителем «E представляет собой фенил», следует отметить, что в материалах заявки на дату ее подачи отсутствуют сведения, раскрывающие получение таких соединений и свойства которых неизвестны в качественном или количественном отношении для этой группы. При этом в описании международной публикации [1] приведены схемы получения соединений, включающих в себя соединение, в котором заместитель E представляет собой «фенил» с возможностью замещения одним или несколькими атомами фтора. В международной публикации [1] также приведены показатели активности таких соединений и сведения, подтверждающие возможность применения соединений для лечения микобактериальных инфекций (см. описание, пример 2, таблицы).

Таким образом, следует согласиться с правоммерностью доводов, указанных в решении Роспатента об отказе, о том, что соединение, где E обозначает фенил, подпадает под общую структурную формулу группы известных из международной публикации [1] соединений. При этом оно не описано как специально полученное и исследованное в материалах заявки

на дату ее подачи и не проявляет новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении (селективное изобретение) (см. пункт 78 Правил ИЗ).

На основании изложенного можно констатировать, что группа изобретений, охарактеризованных в независимом пункте 1 вышеприведенной формулы, включая фармацевтически приемлемые соли, и относящихся к альтернативному соединению, где E является фенилом, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

Объекты по независимым пунктам 5 и 6 вышеприведенной формулы относятся к фармацевтической композиции и применению соединений по независимому пункту 1 вышеприведенной формулы, для лечения микобактериальной инфекции, соответственно.

При этом международная публикация [1] уже раскрывает фармацевтическую композицию и применение для лечения микобактериальных инфекций, основанные на применении соединений оксазолидинона (стр.4 строка 5-10, стр.8 строка 31-стр.10, табл.2-3, пример 2, пп.15-17 формулы).

Охарактеризованные в независимых пунктах 5, 6 вышеприведенной формулы технические решения, также как и известные из международной публикации [1] решения, содержат соединения оксазолидинона, представленные структурной формулой I в независимом пункте 1 формулы вышеприведенной формулы.

Отличием заявленных технических решений, охарактеризованных в независимых пунктах 5, 6 вышеприведенной формулы от композиций, известных их международной публикации, является эффективное количество соединений оксазолидинона, обладающих антибактериальной активностью (см. стр. 1-5 описания заявки).



При этом в международной публикации [2] раскрыта фармацевтическая композиция, содержащая эффективное количество соединений оксазолидинона для лечения микобактериальных инфекций.

Таким образом, для специалиста явным образом будет следовать возможность применения заявленных соединений по указанному назначению, в случае, когда «Е представляет собой фенил» (см. вышеприведенную формулу) в составе фармацевтической композиции и для лечения микобактериальных инфекций, поскольку заявленные соединения в случае, когда «Е представляет собой фенил» имеют соответствующую структурную формулу и назначение, что и известные из международных публикаций [1], [2] соединения (см. доводы выше).

На основании изложенного можно констатировать, что группа изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 5, 6 вышеприведенной формулы, включая фармацевтически приемлемые соли, и относящихся к альтернативному соединению, где Е является фенилом, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

Что касается соединений, охарактеризованных значениями радикалов общей структурной формулы (см. зависимые пункты 2, 3 вышеприведенную формулу), где  $R^1$  представляет собой  $-CH_2NR^2COOR^3$  или  $CH_2NHCOOCH_2$ , а  $R^2$  и  $R^3$  выбираются из водорода и  $C_1$ - $C_6$  алкила, то они известны из международных публикаций [1],[2] соответственно.

Признаки зависимых пунктов 7-9 вышеприведенной формулы также известны из международной публикации [2].

В результате рассмотрения всех имеющихся обстоятельств дела заявитель выразил просьбу о предоставлении ему возможности уточнить формулу изобретения, исключив из нее непатентоспособную альтернативу.

Заявитель представил 14.07.2022 скорректированную формулу, оставив в ней патентоспособные соединения, относящиеся к альтернативе, где E обозначает пиридин (п. 39 Правил ППС).

Вывод о соответствии условиям патентоспособности заявленной группы изобретений в объеме альтернативной совокупности признаков соединения, в которой «E представляет собой пиридин», был сделан в решении Роспатента от 15.12.2021.

Формула изобретения от 14.07.2022 (приведена ниже) была проверена на предмет изменения заявки по существу и принята к дальнейшему рассмотрению.

Поскольку заявителем не были включены новые признаки, то уточненная им формула не требует дополнительного информационного поиска. При этом изобретение, охарактеризованное в приведенной ниже формуле, соответствует всем установленным пунктом 1 статьи 1350 Кодекса условиям патентоспособности.

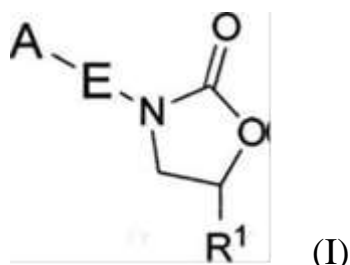
Учитывая вышеизложенное, коллегия пришла к выводу о наличии оснований для принятия Роспатентом следующего решения:

**удовлетворить возражение, поступившее 14.07.2022, отменить решение Роспатента от 15.12.2021 и выдать патент Российской Федерации на изобретение с уточненной заявителем формулой.**

(21) 2018118090/04

(51) МПК А61К 31/42 (2006.01)

(57) 1. Соединение формулы I



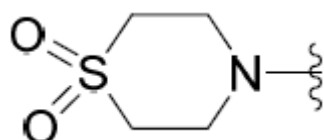
или его фармацевтически приемлемая соль, где:

$R^1$  представляет собой  $-CH_2N(R^2)_2$ , или  $-CH_2NR^2COOR^3$ ;

в каждом случае  $R^2$  независимо выбран из H или  $C_1$ - $C_6$  алкила;

$R^3$  представляет собой H или  $C_1$ - $C_6$  алкил;

E представляет собой пиридин, где указанный пиридин замещён одним или двумя атомами фтора;

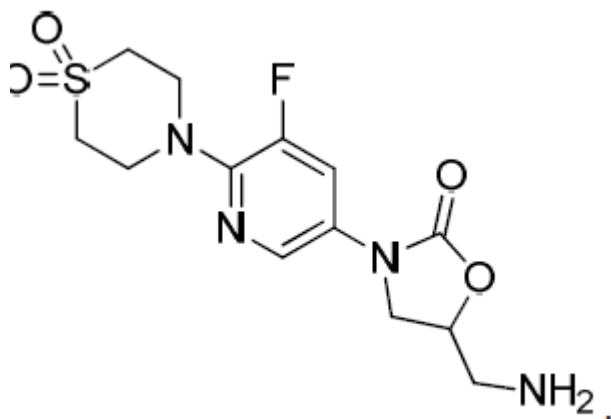


A представляет собой

2. Соединение по п. 1 или его фармацевтически приемлемая соль, где:  $R^1$  представляет собой  $-CH_2NR^2COOR^3$  и в каждом случае  $R^2$  и  $R^3$  независимо выбираются из водорода и  $C_1$ - $C_6$  алкила.

3. Соединение по п. 1 или его фармацевтически приемлемая соль, где  $R^1$  представляет собой  $-CH_2NHCOOCH_3$ .

4. Соединение по п. 1, или его фармацевтически приемлемая соль, имеющее структуру:



5. Фармацевтическая композиция для лечения микобактериальной инфекции, которая содержит терапевтически эффективное количество соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли, и фармацевтически приемлемый носитель.

6. Применение терапевтически эффективного количества соединения по п. 1 или его фармацевтически приемлемой соли для лечения микобактериальной инфекции.

7. Применение по п. 6, при котором микобактериальная инфекция вызвана *Mycobacterium tuberculosis*.

8. Применение по п. 7, при котором *M. tuberculosis* представляет собой устойчивый к лекарственным средствам микобактериальный штамм.

9. Применение по пп. 6-8, при котором соединение или его фармацевтически приемлемую соль вводят перорально, парентерально или местно.

(56) WO 2015/068171 A1, 14.05.2015

RU 2484819 C2, 20.06.2013

WO 2008/069619 A1, 12.06.2008

WO 2007/023507 A2, 01.03.2007

WO 2006/038100 A1, 13.04.2006

WO 2006/022794 A1, 02.03.2006

WO 2005/005420 A1, 20.01.2005

WO 2005/005398 A1, 20.01.2005

WO 2004/014897 A1, 19.02.2004

WO 01/94342 A1, 13.12.2001

WO 95/07271 A1, 16.03.1995

WO 93/09103 A1, 13.05.1993

EP 0352781 A2, 31.01.1990

WO 2005/019214 A1, 03.03.2005