

ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии палаты по патентным спорам
по результатам рассмотрения возражения заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01.01.2008 Федеральным законом от 18.12.2006 № 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, утвержденными приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020 № 644/261, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020 № 59454, с изменениями, внесенными приказом Минобрнауки России и Минэкономразвития России от 23.11.2022 № 1140/646 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение компании Р.П. ШЕРЕР ТЕКНОЛОДЖИС, ЛЛК., US (далее – заявитель), поступившее 20.06.2024, на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее - Роспатент) от 01.12.2023 об отказе в выдаче патента Российской Федерации на изобретение по заявке № 2021133729, при этом установлено следующее.

Заявлено изобретение «КОМПОЗИЦИЯ МИНИ-КАПСУЛЫ ИЗ МЯГКОГО ЖЕЛАТИНА, СОДЕРЖАЩАЯ НАПРОКСЕН», охарактеризованное в формуле, представленной в корреспонденции от 18.10.2023, в следующей редакции:

1. Фармацевтическая композиция для лечения боли, включающая капсулу из мягкого желатина и наполняющую композицию, наполняющая композиция

содержит продукт реакции напроксена в форме свободной кислоты и гидроксида калия, где молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет менее примерно 1, и где капсула из мягкого желатина имеет размер от 8 до 14, и где калиевая соль напроксена присутствует в наполняющей композиции при концентрации от примерно 55 мас.% до примерно 75 мас.% в пересчете на полную суммарную массу напроксена в форме свободной кислоты и калиевой соли напроксена.

2. Фармацевтическая композиция по п. 1, в которой молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет от 0,55 до примерно 0,75.

3. Фармацевтическая композиция по п. 2, в которой молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет от примерно 0,6 до примерно 0,7.

4. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, где наполняющая композиция имеет массу от примерно 200 мг до примерно 800 мг.

5. Фармацевтическая композиция по п. 4, где наполняющая композиция имеет массу от примерно 600 мг до примерно 700 мг.

6. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, где капсула из мягкого желатина имеет размер от 10 до 12.

7. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, где капсула из мягкого желатина имеет продолговатую форму или овальную форму.

8. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, где калиевая соль напроксена присутствует в наполняющей композиции при концентрации от примерно 60 мас.% до примерно 70 мас.% в пересчете на полную суммарную массу напроксена в форме свободной кислоты и калиевой соли напроксена.

9. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, которая обеспечивает среднее значение Т_{макс} от примерно 0,5 ч до примерно 4 ч

после перорального введения группе субъектов в состоянии натощак.

10. Фармацевтическая композиция по п. 9, которая обеспечивает среднее значение T_{\max} в диапазоне от примерно 1 ч до примерно 2,5 ч после перорального введения группе субъектов в состоянии натощак.

11. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, которая обеспечивает среднее значение T_{\max} в диапазоне от примерно 1 ч до примерно 6 ч после перорального введения группе субъектов в состоянии после еды.

12. Фармацевтическая композиция по п. 10, которая обеспечивает среднее значение T_{\max} в диапазоне от примерно 2 ч до примерно 5 ч после перорального введения группе субъектов в состоянии после еды.

13. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, которая обеспечивает среднее значение C_{\max} от примерно 25 мкг/мл до примерно 70 мкг/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии натощак при дозе 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

14. Фармацевтическая композиция по п. 13, которая обеспечивает значение C_{\max} от примерно 30 мкг/мл до примерно 60 мкг/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии натощак при дозе 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

15. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, которая обеспечивает среднее значение C_{\max} в диапазоне от примерно 20 мкг/мл до примерно 55 мкг/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии после еды при дозе примерно 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

16. Фармацевтическая композиция по п. 15, которая обеспечивает среднее значение C_{\max} в диапазоне от примерно 25 мкг/мл до примерно 50 мкг/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии после еды при дозе примерно 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

17. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, которая обеспечивает значение AUC от примерно 450 мкг×ч/мл до примерно 1000 мкг×ч/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии натощак при дозе 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

18. Фармацевтическая композиция по п. 17, которая обеспечивает значение AUC от примерно 500 мкг×ч/мл до примерно 975 мкг×ч/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии натощак при дозе 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

19. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, которая обеспечивает среднее значение AUC в диапазоне от примерно 400 мкг×ч/мл до примерно 1000 мкг×ч/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии после еды при дозе примерно 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

20. Фармацевтическая композиция по п. 19, которая обеспечивает среднее значение AUC в диапазоне от примерно 500 мкг×ч/мл до примерно 950 мкг×ч/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии после еды при дозе примерно 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

21. Фармацевтическая композиция для лечения боли, включающая капсулу из мягкого желатина и наполняющую композицию, наполняющая композиция содержит продукт реакции напроксена в форме свободной кислоты и гидроксида калия, где молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет менее примерно 1, где наполняющая композиция имеет массу от примерно 200 мг до примерно 800 мг, где капсула из мягкого желатина имеет размер от 8 до 14, и где калиевая соль напроксена присутствует в наполняющей композиции при концентрации от примерно 55 мас.% до примерно 75 мас.% в пересчете на полную суммарную массу напроксена в форме свободной кислоты и калиевой соли напроксена.

22. Фармацевтическая композиция по п. 21, которая обеспечивает значение

T_{\max} от примерно 0,5 ч до примерно 4 ч, значение C_{\max} от примерно 25 мкг/мл до примерно 70 мкг/мл и значение AUC от примерно 450 мкг·ч/мл до примерно 1000 мкг·ч/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии натощак при дозе 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

23. Фармацевтическая композиция по п. 21, которая обеспечивает значение T_{\max} от примерно 1 ч до примерно 6 ч, значение C_{\max} от примерно 20 мкг/мл до примерно 55 мкг/мл и значение AUC от примерно 400 мкг·ч/мл до примерно 1000 мкг·ч/мл после перорального введения группе субъектов в состоянии после еды при дозе 200 мг напроксена в форме свободной кислоты или его фармацевтически приемлемой соли.

24. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, где содержание влаги в наполняющей композиции составляет вплоть до примерно 15%, вплоть до примерно 12%, вплоть до примерно 10%, вплоть до примерно 9%, вплоть до примерно 8%, вплоть до примерно 7%, вплоть до примерно 6%, вплоть до примерно 5%, вплоть до примерно 4%, вплоть до примерно 3%, вплоть до примерно 2%, вплоть до примерно 1% или примерно 0 %.

25. Фармацевтическая композиция по любому из предшествующих пунктов, которая имеет твердость от примерно 2 Н до примерно 20 Н, от примерно 4 Н до примерно 15 Н, от примерно 6 Н и до примерно 13 Н или от примерно 8 Н до примерно 12 Н.

26. Способ получения фармацевтической композиции по любому из предшествующих пунктов, включающий помещение напроксена в форме свободной кислоты и гидроксида калия в мини-капсулу из мягкого желатина.

27. Способ лечения боли, включающий введение нуждающемуся в этом пациенту фармацевтической композиции по любому из п.п. 1-25.

По результатам проведения экспертизы по существу Роспатентом было принято решение об отказе в выдаче патента ввиду несоответствия предложенной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень» в свете сведений, раскрытых в источниках информации [1]-[4].

В подтверждение данного мнения в решении указаны следующие источники информации:

- патентный документ EP 2289493 A1, дата публикации 02.03.2011 (далее [1]);
- патентный документ US 2004156892 A1, дата публикации 12.08.2004 (далее - [2]);
- патентный документ US 5360615 A, дата публикации 01.11.1994 (далее - [3]);
- документ TABIBI S. E. et al. Soft gelatin capsules development // Water-Insoluble Drug Formulation. – CRC Press, 2018. – Р. 645-663. [<https://www.taylorfrancis.com/chapters/edit/10.1201/9781315120492-21/soft-gelatin-capsules-development-esmail-tabibi-shanker-gupta-liangran-guo>] (далее - [4]);
- документ ЧУЕШОВ В.И. Промышленная технология лекарств. Том 2. – Х.: МТК-Книга; Издательство НФАУ, 2002. – 716 с. (далее - [5]);
- документ ПЕРЦЕВ И.М. Фармацевтические и медико-биологические аспекты лекарств: в 2 т. Т. 1. - Харьков: УкрФА. 1999. - 464 с. (далее - [6]).

В качестве наиболее близкого аналога изобретений по независимым пунктам 1 (пп.2-20, 24, 25 зависимые), 21 (пп.22-25 зависимые), 26 и 27 рассмотрен патентный документ [1]. При этом в решении Роспатента указано, что изобретения по независимым пунктам 1, 21, 26 и 27 формулы отличаются от технического решения раскрытое в документе [1] тем, что капсула из мягкого желатина имеет размер от 8 до 14.

Вместе с тем в решении раскрыто, что в документе [4] раскрыты размеры капсул из мягкого желатина, в частности, 8, 9, 10, 11, 12, 14, при этом в таблице отображено, что капсулам меньшего размера соответствуют меньшие оптимальные объемы наполняющей композиции (с.646, фиг. 21.1).

В качестве технического результата в решении Роспатента рассмотрено обеспечение более высокой дозы активного ингредиента без изменения размера капсул из мягкого желатина и легкости ее использования, стабильности при небольших размерах капсул и обеспечении целевых значений

фармакокинетических параметров.

При этом в решении отмечено, что в примерах осуществления изобретения рассмотрено растворение, при этом из уровня техники, например, из документа [5] известно, что для мягких капсул кинетика растворения связана с началом высвобождения содержимого. Дополнительно в решении отмечено, что из уровня техники, например, из документа [6] известно влияние вспомогательных веществ.

Кроме того, в решении отмечено, что из патентного документа [3] известно, что при эквимолярных концентрациях гидроксид-иона растворимость напроксена выше в присутствии гидроксида калия, чем в присутствии гидроксида натрия, более того, гораздо более высокие концентрации гидроксида калия, чем гидроксида натрия, могут быть использованы для приготовления высококонцентрированных растворов кислых фармацевтических агентов в полиэтиленгликоле без образования осадка. Также в патентном документе [3] раскрыта возможность инкапсулирования высококонцентрированного раствора в достаточно маленьких желатиновых капсулах, чтобы обеспечить легкое проглатывание.

Соответственно, в решении сделан вывод о том, что высококонцентрированный раствор обеспечивает более высокую дозу активного ингредиента без изменения размера капсулы из мягкого желатина и легкости ее использования, стабильность при небольших размерах капсулы и целевые значения фармакокинетических параметров.

Изобретения по независимым пунктам 1, 21, 26 и 27 формулы дополнительно отличаются от технического решения, раскрытоого в патентном документе [1] тем, что молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет менее примерно 1.

Изобретения по независимым пунктам 21, 26 (в части ссылки на пп.21-25) и 27 (в части ссылки на пп.21-25) дополнительно отличаются от технического решения, раскрытоого в патентном документе [1] тем, что наполняющая композиция имеет массу от примерно 200 мг до примерно 800 мг.

При этом указано, что в патентном документе [3] раскрыта лекарственная

форма напроксена, включающая мягкую желатиновую капсулу, содержащую терапевтически эффективное количество соответствующего высококонцентрированного раствора указанного фармацевтического агента (столбец 5, строки 49-54). Высококонцентрированный раствор содержит 1 эквивалент (35,9% по массе) напроксена и 0,50 мольных эквивалентов гидроксида калия в виде 50%-ного водного раствора (столбец 11, строки 45-54), а также раствор напроксена может содержать 0,2-0,9 моль гидроксид-иона на моль напроксена (столбец 5, строки 28-33), то есть молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет менее примерно 1.

В патентном документе [2] раскрыта фармацевтическая композиция, подходящая для наполнения мягких желатиновых капсул, содержащая терапевтически эффективное количество нестериоидного противовоспалительного средства, такого как производные пропионовой кислоты, в частности, напроксена, и системы растворителей, дополнительно содержащая эффективное количество гидроксида калия, не превышающее молярного эквивалента функциональной группы карбоновой кислоты (пункты 1, 2, 5 формулы). Мягкие желатиновые капсулы имеют подходящий размер для легкого проглатывания и содержат от примерно 100 до примерно 2000 мг фармацевтически активной композиции ([0085]), то есть, в частности, от примерно 200 мг до примерно 800 мг. Мягкие желатиновые капсулы являются стабильными ([0001]).

Признаки, охарактеризованные в зависимых пунктах 2 и 3 формулы в отношении молярного соотношения гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты раскрыты в патентном документе [2] (пункт 2 формулы) и в патентном документе [3] (столбец 5, строки 28-33).

Признаки зависимых пунктов 4 и 5 формулы в отношении массы наполняющей композиции раскрыты в патентном документе [2] ([0085]).

Признаки зависимых пунктов 6 и 7 формулы в отношении размера и формы капсулы раскрыты в документе [4] (с.646, фиг. 21.1).

Признаки, охарактеризованные в зависимом пункте 8 формулы, раскрыты в патентных документах [1] ([0015, 0016]) [2] ([0051, 0052]; пункты 1, 2, 5 формулы) и [3] (столбец 5, строки 28-33; столбец 11, строки 45-54; пункты 1, 4 формулы).

Признаки зависимых пунктов 9-20, 22, 23, 25 формулы относятся к количественным (измеряемым или рассчитываемым) параметрам, характеризующим свойства композиции и согласно действующим нормативным актам не учитываются при проверке изобретательского уровня.

Признаки зависимого пункта 24 в отношении содержания влаги раскрыты в патентном документе [1] ([0041]).

На решение об отказе в выдаче патента на изобретение, в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса, поступило возражение, в котором заявитель ходатайствует об изменении испрашиваемого объёма правовой охраны (уточненная формула изобретения приложена).

Независимый пункт 1 измененной формулы дополнительно ограничен с помощью более узкого интервала концентрации калиевой соли напроксена в наполняющей композиции от 65 мас.% до 75 мас.% (конкретное обоснование можно найти на с. 2 строки 24-28 описания заявки). Аналогичные изменения также внесены в зависимый пункт 8 и независимый пункт 21 формулы.

При этом заявитель поясняет, что предложенная группа изобретений раскрывает, что требуется определенное массовое соотношение калиевой соли напроксена к напроксену в форме свободной кислоты для достижения двух важных технических эффектов. Во-первых, заявленное соотношение калиевой соли напроксена к напроксену в форме свободной кислоты обеспечивает лучшую стабильность в составе капсулы из мягкого желатина. Во-вторых, заявленное соотношение калиевой соли напроксена к напроксену в форме свободной кислоты дополнительно обеспечивает наиболее благоприятный фармакокинетический профиль у пациентов (см. с. 7 описания заявки).

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

С учетом даты подачи заявки (22.04.2020) правовая база для оценки

патентоспособности включает Кодекс, действовавший на дату подачи заявки, Правила составления, подачи и рассмотрения документов, являющихся основанием для совершения юридически значимых действий по государственной регистрации изобретений, и их формы (далее - Правила ИЗ), утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 №42800, Требования к документам заявки на выдачу патента на изобретение (далее – Требования ИЗ), утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 №42800.

Согласно пункту 1 статьи 1350 Кодекса изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

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

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

Согласно пункту 2 статьи 1354 Кодекса охрана интеллектуальных прав на изобретение или полезную модель предоставляется на основании патента в объеме, определяемом содержащейся в патенте формулой изобретения или соответственно полезной модели. Для толкования формулы изобретения и формулы полезной модели могут использоваться описание и чертежи.

Согласно пункту 1 статьи 1387 Кодекса, если в процессе экспертизы заявки на изобретение по существу установлено, что заявленное изобретение, выраженное формулой, предложенной заявителем, не соответствует условиям патентоспособности, предусмотренным статьей 1350 настоящего Кодекса, Федеральный орган исполнительной власти по интеллектуальной собственности принимает решение об отказе в выдаче патента.

Согласно пункту 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 76 Правил ИЗ проверка изобретательского уровня изобретения может быть выполнена по следующей схеме:

- определение наиболее близкого аналога изобретения;
- 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 заявленного изобретения;
- анализ уровня техники в целях подтверждения известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 77 Правил ИЗ не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные, в частности:

- на создании средства, состоящего из известных частей, выбор которых и связь между которыми осуществлены на основании известных правил, рекомендаций и достигаемый при этом технический результат обусловлен только известными свойствами частей этого средства и связей между ними.

Согласно пункту 81 Правил ИЗ, в случае наличия в формуле изобретения признаков, в отношении которых заявителем не определен технический результат, или в случае, когда установлено, что указанный заявителем технический результат не достигается, подтверждения известности влияния таких отличительных признаков на технический результат не требуется.

Согласно пункту 39 Требований ИЗ при раскрытии сущности изобретения, относящегося к композиции, применяются следующие правила:

1) для характеристики композиций используются, в частности, следующие признаки:

- качественный состав (ингредиенты);
- количественный состав (содержание ингредиентов);
- структура композиции;
- структура ингредиентов;

2) для характеристики композиций неустановленного состава используются их физико-химические, физические и иные характеристики, а также признаки способа получения.

3) не допускается для характеристики композиции в качестве ее признаков использовать сведения, непосредственно к композиции не относящиеся (например, условия и режимы использования этой композиции в каком-либо процессе, способе), количественный (измеряемый или рассчитываемый) параметр, характеризующий одно или более свойств композиции, в случаях, когда этот параметр является отличительным признаком в характеристике композиции в независимом пункте формулы (например, параметры прочности ламинирования, сопротивления растрескиванию при напряжении, фармакокинетического профиля и тому подобное), технический результат, проявляющийся при изготовлении или использовании композиции. При характеристике фармацевтической композиции не допускается использование признаков, относящихся к способу лечения или профилактики заболевания (например, указание доз, условий или режимов применения композиции или лекарственных средств, полученных на ее основе).

Согласно пункту 52 Требований ИЗ, формула изобретения предназначается для определения объема правовой охраны изобретения, предоставляемой на основании патента.

Согласно пункту 39 Правил ППС в рамках рассмотрения возражения лицо, подавшее возражение, вправе ходатайствовать об изменении испрашиваемого объема правовой охраны изобретения, при условии, если испрашиваемые изменения могут устраниТЬ 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 заявленного изобретения выражено в приведенной выше формуле.

Анализ доводов, содержащихся в возражении и решении Роспатента, с учетом материалов заявки, касающихся оценки соответствия заявленного изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Можно согласиться с доводом, изложенным в решении Роспатента о том, что ближайшим аналогом для изобретения по независимому пункту 1 формулы, представленной 18.10.2023, является техническое решение, раскрытое в патентном документе [1].

В патентом документе [1] раскрыты фармацевтическая композиция, содержащая напроксен в форме свободной кислоты и в виде соли калия ([0015, 0021]), способ ее получения, возможность приготовления концентрата напроксена в виде мягких желатиновых капсул ([0024, 0033, 0034]), при этом раскрыто, что различные виды легкой и умеренной боли облегчаются напроксеном ([0001-0003, 0032]), то есть напроксен в составе композиции вводят в способе лечения боли. Концентрат твердого напроксена включает около 15-85% твердой свободной кислоты напроксена и около 15-85% твердой щелочной соли напроксена ([0016]), то есть соль напроксена присутствует в количестве, в частности, от примерно 55 мас.% до примерно 75 мас.% в пересчете на полную суммарную массу напроксена в форме свободной кислоты и калиевой соли напроксена.

Как верно отмечено в решении Роспатента, общим отличием предложенных в независимых пунктах 1, 21, 26 и 27 формулы от решения известного из патентного документа [1] является то, что капсула из мягкого желатина имеет размер от 8 до 14, а молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет менее примерно 1.

Кроме того, изобретения по независимым пунктам 21, 26 и 27 дополнительно отличаются от ближайшего аналога тем, что наполняющая композиция имеет массу от примерно 200 мг до примерно 800 мг.

Согласно ответам заявителя от 27.02.2023 (с.2) и от 18.10.2023 (с.2) технический результат заключается в обеспечении более высокой дозы активного ингредиента без изменения размера капсулы из мягкого желатина и легкости ее использования, стабильности при небольших размерах капсулы и обеспечении целевых значений фармакокинетических параметров.

Однако следует согласиться с позицией, изложенной в решении Роспатента о том, что заявитель не привел конкретных доводов, согласно которым именно размер капсулы, а не состав наполняющей композиции, обеспечивает указанный заявителем технический результат, и что размер капсулы определяется не на основе именно той композиции, которой наполняют капсулу и которая обеспечивает более высокую дозу активного ингредиента.

При этом, как показано в документе [4] (с.646, фиг. 21.1), капсулам меньшего размера соответствуют меньшие оптимальные объемы наполняющей композиции, то есть меньший размер капсулы обеспечивается тем, что необходимая концентрация активного ингредиента содержится в меньшем объеме наполняющей композиции. Вместе с тем, в документе [4] раскрыты размеры капсул из мягкого желатина, в частности, 8, 9, 10, 11, 12, 14.

Кроме того, также следует поддержать довод Роспатента о том, что в формуле изобретения состав оболочки капсулы не охарактеризован признаками, которые могли бы оказывать влияние на стабильность капсулы и обеспечение целевых значений фармакокинетических параметров.

Вместе с тем, в примерах осуществления изобретения рассмотрено растворение, при этом из уровня техники, например, из документа [5] (с.414-415) известно, что для мягких капсул кинетика растворения связана с началом высвобождения содержимого. По мере растворения оболочки или вскрытия по месту шва происходит постепенное выделение содержимого капсул. Время высвобождения содержимого из мягких желатиновых капсул зависит от состава

желатиновой оболочки и метода получения. Поскольку содержимое мягких капсул находится в жидкому состоянии, активный ингредиент быстро всасывается.

Кроме того, из уровня техники, например, из документа [6] известно, что вспомогательные вещества по отношению к макроорганизму своими взаимодействиями с лекарственными или другими вспомогательными веществами могут изменять химические, физико-химические свойства как действующих веществ, так и самой лекарственной формы. При этом, влияя в значительной степени на ее терапевтический эффект в целом, вспомогательные вещества могут усиливать действие лекарственных веществ или снижать их активность, изменять характер действия под влиянием разных причин (комплексообразования, молекулярных реакций, интерференции и др.), регулировать фармакодинамику и фармакокинетику лекарственных веществ. Выбор вспомогательных веществ должен осуществляться с учетом их влияния на стабильность и на биофармацевтические характеристики готового лекарства.

С учетом вышеприведенных сведений размер капсулы зависит от объема наполняющей композиции, и более высокая доза активного ингредиента без изменения размера капсулы из мягкого желатина и легкости ее использования, стабильность при небольших размерах капсулы и обеспечение целевых значений фармакокинетических параметров обусловлены составом, наполняющим капсулу, который в настоящей группе изобретений охарактеризован признаками напроксена в форме свободной кислоты и калиевой соли напроксена.

Однако из патентного документа [3] (столбец 2, строка 67 – столбец 3, строка 6; столбец 8, строки 16-26) известно, что при эквимолярных концентрациях гидроксид-иона растворимость напроксена выше в присутствии гидроксида калия, чем в присутствии гидроксида натрия, более того, гораздо более высокие концентрации гидроксида калия, чем гидроксида натрия, могут быть использованы для приготовления высококонцентрированных растворов кислых фармацевтических агентов в полиэтиленгликоле без образования осадка.

Также в патентном документе [3] раскрыта возможность инкапсулирования высококонцентрированного раствора в достаточно маленьких желатиновых капсулах, чтобы обеспечить легкое проглатывание. Соответственно, высококонцентрированный раствор обеспечивает более высокую дозу активного ингредиента без изменения размера капсулы из мягкого желатина и легкости ее использования, стабильность при небольших размерах капсулы и целевые значения фармакокинетических параметров.

Таким образом, в отношении признаков наполняющей композиции характеризующих, что молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет менее примерно 1, а наполняющая композиция имеет массу от примерно 200 мг до примерно 800 мг, необходимо отметить следующее.

В патентном документе [3] раскрыта лекарственная форма напроксена, включающая мягкую желатиновую капсулу, содержащую терапевтически эффективное количество соответствующего высококонцентрированного раствора (столбец 5, строки 49-54), где высококонцентрированный раствор содержит 1 эквивалент (35,9% по массе) напроксена и 0,50 мольных эквивалентов гидроксида калия в виде 50%-ного водного раствора (столбец 11, строки 45-54), а также раствор напроксена может содержать 0,2-0,9 моль гидроксид-иона на моль напроксена (столбец 5, строки 28-33), то есть молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет менее примерно 1.

Здесь целесообразно отметить, что патентный документ [1] буквально относится к твердому концентрату напроксена, который может быть использован в составе мягких таблеток, при этом в патентном документе [1] раскрыто получение мягких желатиновых капсул, при котором осуществляют растворение напроксена в форме свободной кислоты и соли в носителе ([0024, 0033, 0034]).

В то же время в примере 1 описания предложенной группы изобретений раскрыты шесть наполняющих композиций, полученных путем нейтрализации

напроксена в форме свободной кислоты с помощью гидроксида калия, причем согласно приведенному способу получали наполняющий раствор, то есть наполняющая композиция содержит, в частности, растворенную калиевую соль напроксена, и, таким образом, раствор в отношении содержания напроксена и калиевой соли напроксена будет содержать те же ингредиенты, что и раскрытые для мягкой желатиновой капсулы, известной из патентного документа [1].

В патентном документе [2] раскрыта фармацевтическая композиция, подходящая для наполнения мягких желатиновых капсул, содержащая терапевтически эффективное количество нестероидного противовоспалительного средства, такого как производные пропионовой кислоты, в частности, напроксена, и системы растворителей, дополнительно содержащая эффективное количество гидроксида калия, не превышающее молярного эквивалента функциональной группы карбоновой кислоты (пункты 1, 2, 5 формулы). Мягкую желатиновую оболочку можно использовать для инкапсулирования желаемого количества композиции наполнителя с использованием стандартной методики инкапсуляции ([0079]). Мягкие желатиновые капсулы имеют подходящий размер для легкого проглатывания и содержат от примерно 100 до примерно 2000 мг фармацевтически активной композиции ([0085]), то есть, в частности, от примерно 200 мг до примерно 800 мг. При этом известные мягкие желатиновые капсулы являются стабильными ([0001]).

Таким образом, все признаки, характеризующие предложенную группу изобретений известны из документов [1]-[4], а с учетом информации, раскрытой в [5]-[6] и доводов изложенных в отношении технического результата выше, специалисту очевидна возможность получения мягких желатиновых капсул как они включены в независимые пункты 1, 19, 26 и 27 формулы.

Что касается измененной формулы изобретения, предложенной заявителем в возражении, то она была признана основанной на первоначальном описании заявки, но не предложенные изменения не смогли преодолеть возражения о несоответствии предложенных изобретений условию

патентоспособности «изобретательский уровень».

В соответствии с изложенным необходимо констатировать, что решение Роспатента от 01.12.2023 принято правомерно.

В ходе рассмотрения возражения, на заседании коллегии, состоявшемся 10.04.2025, в соответствии с пунктом 39 Правил ППС заявитель ходатайствовал о приобщении новой измененной формулы (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии).

Независимый пункт 1 измененной формулы дополнительно ограничен с помощью признаков зависимого пункта 2, в котором раскрывается предпочтительное значение молярного соотношения гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты от примерно 0,6 до примерно 0,7.

Ограничения, внесенные ранее в формулу изобретения, в частности признак, характеризующий, что «калиевая соль напроксена присутствует в наполняющей композиции при концентрации от примерно 65 мас.% до примерно 75 мас.% в пересчете на полную суммарную массу напроксена в форме свободной кислоты и калиевой соли напроксена» сохранен в измененной формуле.

В связи с внесенными изменениями, пункт 2 формулы изобретения исключен, а все последующие пункты соответствующим образом скорректированы и перенумерованы.

При этом заявитель отмечает, что конкретное значение молярного соотношения гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты от примерно 0,6 до примерно 0,7 может рассматриваться как существенный и неочевидный признак в свете процитированного уровня техники (в частности, наиболее релевантных, по мнению заявителя, патентных документов [1] и [3]). Заявитель в своих пояснениях также привел доводы в защиту предложенной группы изобретений.

В частности отмечено, что патентный документ [3], в котором раскрывается концентрированный раствор для наполнения капсул из мягкого желатина, не сможет помочь специалисту прийти к настоящему изобретению.

Так, хотя в патентном документе [3] указан общий интервал содержания 0,2-0,9 моль иона гидроксида на моль напроксена и этот интервал пересекается с предложенным молярным соотношением 0,6-0,7, однако далее в патентном документе [3] как предпочтительный уже указан интервал только 0,4-0,6 моля иона гидроксида на моль напроксена (см. кол. 5 в [3]). В Примерах IV, X и XI в [3] раскрываются намного более низкие соотношения 0,5 молей, 0,35 молей и 0,3 моль соответственно. Поэтому, по мнению заявителя, у специалиста не будет никакого стимула выбрать более высокое соотношение 0,6-0,7 как в настоящем изобретении, т.к. в патентном документе [3] используются намного более низкие молярные соотношения гидроксида к напроксену.

Уточненная заявителем формула группы изобретений не изменяет заявку по существу (пункт 2 статьи 1378 Кодекса). При этом не выявлено препятствий для направления на проведение дополнительного информационного поиска в отношении формулы, представленной заявителем 10.04.2025.

По результатам проведения дополнительного информационного поиска представлены источники информации [1]-[5], при этом вместо документа [6] представлены следующие документы:

- GULLAPALLI R. P. Soft gelatin capsules (softgels) // Journal of pharmaceutical sciences, 2010, Vol. 99, No. 10, pp. 4107-4148 [<https://onlinelibrary.wiley.com/doi/10.1002/jps.22151>] (далее - [7]);

- ALHAZMI H. A., AL BRATTY M. Conductometric determination of naproxen in bulk and pharmaceutical dosage form // European Journal of Chemistry, 2017, Vol. 8, No. 4, pp. 339-343 [https://www.eurjchem.eom/index.php/eurjchem/article/view/1614/pdf_1614] (далее - [8]);

- патентный документ US 2011039930 A1, дата публикации 17.02.2011 (далее - [9]).

Таким образом, при составлении заключения во внимание принятые источники информации [1]-[5], [7]-[9].

Как следует из представленного заключения экспертизы, предложенные в

уточненной формуле изобретения признаны соответствующим условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «новизна» (пункт 1 статьи 1350 Кодекса).

Однако в заключении по результатам дополнительного информационного поиска сделан вывод о том, что изобретения, предложенные в независимых пунктах 1, 19, 24 и 25 уточненной формулы не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку являются очевидными для специалиста в данной области техники.

При анализе соответствия предложенного изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» в заключении экспертизы, в число признаков, отличающих предложенные в уточненной формуле изобретения от ближайшего аналога, известного из патентного документа [1], включены признаки, характеризующие, что «наполняющая композиция, в которой присутствуют напроксен в форме свободной кислоты и калиевая соль напроксена, содержит продукт реакции напроксена в форме свободной кислоты и гидроксида калия, где молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет от примерно 0,6 до примерно 0,7, капсула из мягкого желатина имеет размер от 8 до 14».

Способ по пункту 24 формулы дополнительно отличается тем, что «в мини-капсулу помещают напроксен в форме свободной кислоты и гидроксида калия».

При этом поясняется, что из формулировки «наполняющая композиция содержит продукт реакции напроксена в форме свободной кислоты и гидроксида калия, где молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет от примерно 0,6 до примерно 0,7» в независимых пунктах 1 и 19 не следует, что продукт реакции содержит гидроксид калия и напроксен в форме свободной кислоты, поскольку они являются исходными веществами, а именно продуктом реакции напроксена в форме свободной кислоты и гидроксида калия являются калиевая соль напроксена и вода, как это известно из уровня техники, например, из документа

[8].

Однако, как уже раскрыто выше в отношении сведений раскрытых в патентном документе [3], в соответствии с содержанием компонентов в высококонцентрированном растворе, молярное соотношение гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты составляет, в частности, от примерно 0,6 до примерно 0,7. При содержании напроксена 250 мг минимальный размер капсулы составляет 7 (столбец 6, таблица 1).

Вместе с тем, в документе [4] (с.646, фиг. 21.1) раскрыты размеры капсул из мягкого желатина, в частности, 8, 9, 10, 11, 12, 14, при этом в таблице отображено, что капсулам меньшего размера соответствуют меньшие оптимальные объемы наполняющей композиции.

Технический результат заключается в обеспечении более высокой дозы активного ингредиента без изменения размера капсулы из мягкого желатина и легкости ее использования (1), стабильности (2) и обеспечении целевых значений фармакокинетических параметров (3).

Что касается обеспечения более высокой дозы активного ингредиента без изменения размера капсулы из мягкого желатина и легкости ее использования, то, как уже было рассмотрено выше в настоящем заключении, из патентного документа [3] (столбец 2, строка 67 - столбец 3, строка 6; столбец 8, строки 16-26) известно, что при эквимолярных концентрациях гидроксид-иона растворимость напроксена выше в присутствии гидроксида калия, чем в присутствии гидроксида натрия, более того, гораздо более высокие концентрации гидроксида калия, чем гидроксида натрия, могут быть использованы для приготовления высококонцентрированных растворов кислых фармацевтических агентов в полиэтиленгликоле без образования осадка; также раскрыта возможность инкапсулирования высококонцентрированного раствора в достаточно маленьких желатиновых капсулах, чтобы обеспечить легкое проглатывание.

Соответственно, высококонцентрированный раствор обеспечивает более высокую дозу активного ингредиента без изменения размера капсулы из мягкого

желатина и легкости ее использования.

При этом на основе материалов заявителя от 10.04.2025 (с.2) технический результат для признаков молярного соотношения гидроксида калия к напроксену в форме свободной кислоты, которое составляет от примерно 0,6 до примерно 0,7, заключается в стабильности продукта (2).

Здесь следует согласиться с доводом заключения, что механизм достижения результата (2) указанными признаками (согласно пояснениям заявителя слишком высокое молярное соотношение приведет к более высокому значению pH наполняющей композиции, которое может разрушить желатиновую оболочку капсулы и вызвать протечку капсулы, а слишком низкое может привести к более низкой стабильности и активный фармацевтический ингредиент не сможет полностью раствориться в наполняющей композиции) основан на известном из документа [7] влиянии pH наполняющей композиции на стабильность капсулы.

В частности из документа [7] (с.4115, правый столбец, абзац 2) известно, что при значениях pH ниже 2,5 желатин гидролизуется, вызывая утечку мягкой капсулы, тогда как при значениях pH выше 7,5 желатин может быть либо гидролизован, либо сшит, что приводит к снижению растворимости желатиновой оболочки.

В отношении обеспечения целевых значений фармакокинетических параметров (3), следует отметить, что из документа [5] (с.414-415) известно, что для мягких капсул кинетика растворения связана с началом высвобождения содержимого, по мере растворения оболочки или вскрытия по месту шва происходит постепенное выделение содержимого капсул. Поскольку содержимое мягких капсул может находиться в жидком состоянии, активный ингредиент быстро всасывается.

Соответственно, целевые значения фармакокинетических параметров обеспечиваются, в частности, за счет растворения желатиновой оболочки, и с учетом известности влияния pH наполняющей композиции на стабильность капсулы специалистом может быть подобрано соотношение гидроксида калия к

напроксену в форме свободной кислоты, которое составляет от примерно 0,6 до примерно 0,7.

При этом в отношении обеспечения технического результата, относящегося к стабильности и обеспечению целевых значений фармакокинетических параметров признаками размера капсулы из мягкого желатина от 8 до 14, следует отметить, что для образцов 1-4, приведенных в примерах, не показано его достижение данными признаками, поскольку в примерах не указаны размеры капсулы.

Кроме того, необходимо согласиться с доводом заключения, что в материалах заявки не указан технический результат, обеспечиваемый способом получения фармацевтической композиции (пункт 24 уточненной формулы) и способом лечения боли (пункт 25 уточненной формулы) и с учетом пункта 51 Правил ИЗ в качестве технического результата рассматривается получение фармацевтической композиции и лечение боли, соответственно.

При этом получение фармацевтической композиции раскрыто в патентных документах [1] ([0024, 0033, 0034]; пункт 14 формулы) и [3] (столбец 6, строки 10-13; столбец 10, строка 60 - столбец 11, строка 3).

В патентном документе [9] (пункт 19 формулы) раскрыто лечение боли введением композиции, содержащей напроксен или его фармацевтически приемлемую соль, и согласно патентному документу [1] ([0001-0003]) различные виды легкой и умеренной боли облегчаются напроксеном.

Кроме того, заявителем не определен технический результат, обеспечиваемый отличительными признаками при осуществлении способа получения фармацевтической композиции и способа лечения боли, поэтому подтверждения известности влияния таких отличительных признаков на технический результат не требуется (пункт 81 Правил ИЗ).

Таким образом, в соответствии с изложенным, следует согласиться и с выводом, сделанным в заключении экспертизы, что предложенная в уточненной формуле группа изобретений по-прежнему не соответствует условию

патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 2 статьи 1350 Кодекса), поскольку основана на создании средства, состоящего из известных частей, выбор которых и связь между которыми осуществлены на основании известных правил, рекомендаций и достигаемый при этом технический результат обусловлен только известными свойствами частей этого средства и связей между ними.

Признаки, охарактеризованные в зависимых пунктах 2 и 3 формулы раскрыты в патентном документе [2] ([0085]).

Признаки зависимых пунктов 4 и 5 формулы раскрыты в документе [4] (с.646, фиг. 21.1).

Признаки зависимого пункта 6 формулы раскрыты в патентном документе [1] ([0015, 0016]).

Признаки зависимых пунктов 7-18, 20, 21, 23 формулы, то они относятся к количественным (измеряемым или рассчитываемым) параметрам, характеризующим свойства композиции (подпункт 3 п.39 Требований ИЗ), и согласно п.76 Правил ИЗ не учитываются при оценке соответствия изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Признаки зависимого пункта 22 раскрыты в патентном документе [1] ([0028, 0041]).

Таким образом, включение признаков зависимых пунктов в независимые пункты не изменит сделанного выше вывода.

В корреспонденции, поступившей 18.08.2025, заявителем представлен отзыв на результаты дополнительного информационного поиска и заключение экспертизы, в котором заявитель выразил несогласие с выводами, сделанными в заключении.

При этом заявитель отвергает известность из уровня техники, в частности, из патентного документа [3] отличительных признаков, характеризующих изобретения по уточненной формуле, по которой проводился дополнительный информационный поиск.

Однако, как раскрыто выше, документ [3] содержит признак, включенный

в уточненную формулу, по сути заявитель и сам не отрицает в своих комментариях к уточненной формуле, что несмотря на то, что в патентном документе [3] указан широкой интервал, в примерах использовали меньшее количество. Между тем, источники информации [2], [4]-[5], [7]-[8] раскрывают, каким образом варьируя условия и количества компонентов можно подобрать соответствующие параметры.

Таким образом, доводы заявителя, изложенные в ответе от 08.08.2025, не могут изменить сделанного выше вывода.

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 20.06.2024, решение Роспатента от 01.12.2023 оставить в силе.