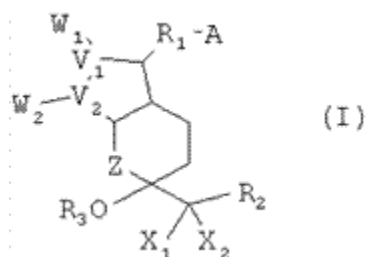


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам
рассмотрения ☒ возражения ☐ заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01.01.2008 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» (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 возражение против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2440144, поступившее 24.07.2018 от Акционерного общества «Нижегородский химико-фармацевтический завод» (далее – лицо, подавшее возражение), при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2440144 на группу изобретений «Фармацевтическая композиция, содержащая бициклическое соединение, и способ стабилизации бициклического соединения» выдан по заявке №2008134492/15 с приоритетом от 24.01.2006 на имя Р-ТЕК УЕНО, ЛТД. (Япония), СУКАМПО АГ (Швейцария) (далее - патентообладатель) и действует со следующей формулой:

«1. Фармацевтическая композиция для лечения или профилактики запора, содержащая бициклическое соединение формулы (I):

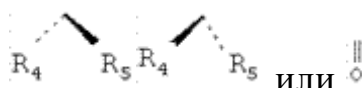


где А представляет собой -CH₂ОН, -СОСН₂ОН, -СООН или их функциональные производные;

X₁ и X₂ представляют собой водород, низший алкил или галоген;

V₁ и V₂ представляют собой углерод или кислород;

W₁ и W₂ представляют собой



где R₄ и R₅ представляют собой водород, гидроксил, галоген, низший алкил, низший алкокси, или низший гидроксилалкил, при условии, что R₄ и R₅ не являются одновременно гидроксильной группой или низшей алкокси-группой;

Z представляет собой углерод, кислород, серу или азот;

R₁ представляет собой насыщенный или ненасыщенный двухвалентный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток, не замещенный или замещенный галогеном, низшим алкилом, гидроксильной группой, оксо-, арильной или гетероциклической группой;

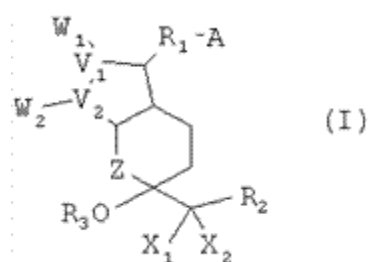
R₂ представляет собой насыщенный или ненасыщенный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток, не замещенный или замещенный галогеном, оксо-группой, гидроксильной группой, низшим алкилом, низшей алкокси-группой, низшей алканоилокси-группой, низшим циклоалкилом, низшей циклоалкокси-группой, арильной группой, арилокси-группой, гетероциклической группой или гетероциклоокси-группой;

R₃ представляет собой водород, низший алкил, низший циклоалкил, арильную или гетероциклическую группу, и полиол и/или сложный эфир жирной кислоты, представляющий собой эфир жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C₁-C₆ моновалентного спирта.

2. Композиция по п.1, где бициклическое соединение представляет собой бициклическое соединение формулы (I), где

А представляет собой -COOH группу или ее функциональное производное;
 X_1 и X_2 представляют собой галоген;
 W_1 представляет собой =O, или один из R_4 и R_5 представляет собой водород,
а второй представляет собой гидроксильную группу;
для W_2 оба R_4 и R_5 представляют собой водород; Z представляет собой
кислород;
 R_1 представляет собой насыщенный или ненасыщенный двухвалентный не
замещенный низший или среднецепочечный алифатический
углеводородный остаток;
 R_2 представляет собой насыщенный или ненасыщенный незамещенный
низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;
 R_3 представляет собой водород.

3. Композиция по п.1, где полиол представляет собой глицерин,
пропиленгликоль или полиэтиленгликоль.
4. Композиция по п.1, где указанный сложный эфир жирной кислоты
представляет собой сложный эфир пропиленгликоля и жирной кислоты.
5. Композиция по п.1, где указанный сложный эфир жирной кислоты
представляет собой сложный эфир жирной кислоты и одновалентного C_1 -
 C_6 -спирта.
6. Композиция по п.5, где упомянутый сложный эфир жирной кислоты
представляет собой изопропилпальмитат.
7. Композиция по п.1 в дозированной форме для перорального применения.
8. Композиция по п.7 в форме капсулы.
9. Способ стабилизации бициклического соединения, представленного
формулой (I):



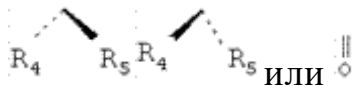
где А представляет собой группы -CH₂OH, -COCH₂OH, -COOH или их

функциональные производные;

X_1 и X_2 представляют собой водород, низший алкил или галоген;

V_1 и V_2 представляют собой углерод или кислород;

W_1 и W_2 представляют собой



где R_4 и R_5 представляют собой водород, гидроксил, галоген, низший алкил, низший алкокси или низший гидроксиполкил, при условии, что R_4 и R_5 не являются одновременно гидроксильной или низшей алкокси-группой;

Z представляет собой углерод, кислород, серу или азот;

R_1 представляет собой насыщенный или ненасыщенный двухвалентный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток, не замещенный или замещенный галогеном, низшим алкилом, гидроксильной группой, оксо-, арильной или гетероциклической группой;

R_2 представляет собой насыщенный или ненасыщенный низший или средний алифатический углеводородный остаток, не замещенный или замещенный галогеном, оксо-группой, гидроксильной группой, низшим алкилом, низшей алкокси-группой, низшей алканойлокси-группой, низшим циклоалкилом, низшей циклоалкокси-группой, арильной группой, арилокси-группой, гетероциклической группой или гетероциклоокси-группой; и

R_3 представляет собой водород, низший алкил, низший циклоалкил, арильную или гетероциклическую группу;

включающий смешивание данного соединения с полиолом и/или сложным эфиром жирной кислоты, представляющим собой эфир жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C_{1-6} моновалентного спирта.

10. Способ по п.9, где

A представляет собой $-COOH$ группу или ее функциональное производное;

X_1 и X_2 представляют собой галоген;

W_1 представляет собой $=O$, или один из R_4 и R_5 представляет собой водород, а второй представляет собой гидроксильную группу;

для W_2 оба R_4 и R_5 представляют собой водород;

Z представляет собой кислород;

R_1 представляет собой насыщенный или ненасыщенный двухвалентный незамещенный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;

R_2 представляет собой насыщенный или ненасыщенный незамещенный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;

R_3 представляет собой водород.

11. Способ по п.9, где полиол представляет собой глицерин, пропиленгликоль или полиэтиленгликоль.

12. Способ по п.9, где указанный сложный эфир жирной кислоты представляет собой сложный эфир пропиленгликоля и жирной кислоты.

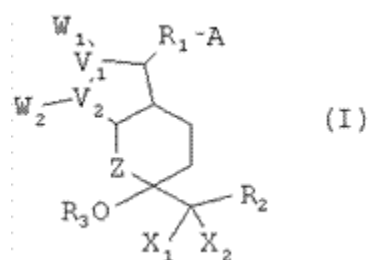
13. Способ по п.9, где указанный сложный эфир жирной кислоты представляет собой сложный эфир жирной кислоты и одновалентного C_1 - C_6 -спирта.

14. Способ по п.13, где упомянутый сложный эфир жирной кислоты представляет собой изопропилпальмитат.

15. Способ по п.9, где получаемая смесь представляет собой дозированную форму, пригодную для перорального применения.

16. Способ по п.15, где дозированная форма представляет собой капсулу.

17. Состав в мягкой желатиновой капсуле для лечения или профилактики запора, содержащий соединение формулы (I):

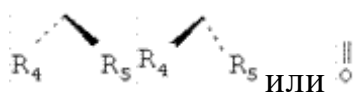


где A представляет собой группы $-CH_2OH$, $-COCH_2OH$, $-COOH$ или их функциональные производные;

X_1 и X_2 представляют собой водород, низший алкил или галоген;

V_1 и V_2 представляют собой углерод или кислород;

W_1 и W_2 представляют собой



где R_4 и R_5 представляют собой водород, гидроксил, галоген, низший алкил, низший алкокси, или низший гидроксиполкил, при условии, что R_4 и R_5 не являются одновременно гидроксильной или низшей алкокси-группой;

Z представляет собой углерод, кислород, серу или азот;

R_1 представляет собой насыщенный или ненасыщенный двухвалентный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток, не замещенный или замещенный галогеном, низшим алкилом, гидроксильной группой, оксо-, арильной или гетероциклической группой;

R_2 представляет собой насыщенный или ненасыщенный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток, не замещенный или замещенный галогеном, оксо-группой, гидроксильной группой, низшим алкилом, низшей алкокси-группой, низшей алканойлокси-группой, низшим циклоалкилом, низшей циклоалкокси-группой, арильной группой, арилокси-группой, гетероциклической группой или гетероциклоокси-группой;

R_3 представляет собой водород, низший алкил, низший циклоалкил, арильную или гетероциклическую группу,

в который входят:

оболочка мягкой желатиновой капсулы, содержащая желатин и полиол в качестве

пластификатора, и

смесь, содержащая указанное бициклическое соединение и

фармацевтически приемлемый носитель, которой заполнена оболочка.

18. Состав по п.17, где

A представляет собой $-COOH$ группу или ее функциональное производное;

X_1 и X_2 представляют собой галоген;

W_1 представляет собой $=O$, или один из R_4 и R_5 представляет собой водород, а второй представляет собой гидроксильную группу;

для W_2 оба R_4 и R_5 представляют собой водород;

Z представляет собой кислород;

R_1 представляет собой насыщенный или ненасыщенный двухвалентный незамещенный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;

R_2 представляет собой насыщенный или ненасыщенный незамещенный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;

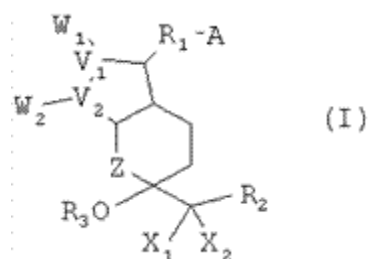
R_3 представляет собой водород.

19. Состав по п.17, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой сложный эфир жирной кислоты или полиол.

20. Состав по п.19, где сложный эфир жирной кислоты представляет собой глицерид.

21. Состав по п.19, где полиол, используемый в качестве фармацевтически приемлемого носителя, представляет собой глицерин.

22. Способ стабилизации бициклического соединения формулы (I):

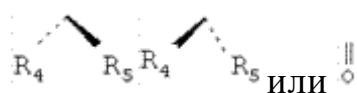


где A представляет собой группы $-CH_2OH$, $-COCH_2OH$, $-COOH$ или их функциональные производные;

X_1 и X_2 представляют собой водород, низший алкил или галоген;

V_1 и V_2 представляют собой углерод или кислород;

W_1 и W_2 представляют собой



где R_4 и R_5 представляют собой водород, гидроксил, галоген, низший алкил,

низший алкокси или низший гидроксильный алкил, при условии, что R_4 и R_5 не являются одновременно гидроксильной или низшей алкокси-группой;

Z представляет собой углерод, кислород, серу или азот;

R_1 представляет собой насыщенный или ненасыщенный двухвалентный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток, не замещенный или замещенный галогеном, низшим алкилом, гидроксильной группой, оксо-, арильной или гетероциклической группой;

R_2 представляет собой насыщенный или ненасыщенный низший или средний алифатический углеводородный остаток, не замещенный или замещенный галогеном, оксо-группой, гидроксильной группой, низшим алкилом, низшей алкокси-группой, низшей алканоилокси-группой, низшим циклоалкилом, низшей циклоалкокси-группой, арильной группой, арилокси-группой, гетероциклической группой или гетероциклоокси-группой;

R_3 представляет собой водород, низший алкил, низший циклоалкил, арильную или гетероциклическую группу, включающий диспергирование или смешивание бициклического соединения с фармацевтически приемлемым носителем с образованием жидкой смеси, и заключение жидкой смеси в мягкую желатиновую капсулу, оболочка которой содержит желатин и полиол в качестве пластификатора.

23. Композиция по п.1, которая содержит полиол, но не сложный эфир жирной кислоты.

24. Способ по п.9, где соединение, представленное формулой (I), смешано с полиолом, но не со сложным эфиром жирной кислоты.

25. Состав по п.19, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой полиол.

26. Способ по п.22, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой полиол.

27. Композиция по п.1, которая содержит сложный эфир жирной кислоты, который представляет собой сложный эфир жирной кислоты и спирта,

выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C_{1-6} моновалентного спирта, но не полиол.

28. Способ по п.9, где соединение, представленное формулой (I), смешивают со сложным эфиром жирной кислоты, который представляет собой сложный эфир жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C_{1-6} моновалентного спирта, но не с полиолом.

29. Состав по п.19, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой сложный эфир жирной кислоты, являющийся сложным эфиром жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C_{1-6} моновалентного спирта.

30. Способ по п.22, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой сложный эфир жирной кислоты, который является сложным эфиром жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C_{1-6} моновалентного спирта.

31. Композиция по п.23, в которой полиол представляет собой глицерин.

32. Способ по п.24, в котором полиол представляет собой глицерин.

33. Состав по п.17, в котором полиол, используемый в качестве пластификатора, представляет собой глицерин.

34. Способ по п.22, в котором полиол, используемый в качестве пластификатора, представляет собой глицерин.

35. Способ по п.26, в котором полиол, используемый в качестве фармацевтически приемлемого носителя, представляет собой глицерин».

В соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса против выдачи данного патента было подано возражение, мотивированное несоответствием группы изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость» (пункты формулы 1, 3-8, 17, 19-21, 23, 25, 27, 29, 31, 33) и «изобретательский уровень» (пункты формулы 1-35).

К возражению приложены копии следующих источников информации:

- статья Sorbera L.A. et al. "Lubiprostone. Treatment of Constipation, treatment of Irritable Bowel Syndrome, Treatment of Postoperative Ileus, CIC-2 Channel Activator", Drugs of the future, апрель 2004, vol. 29(4), p.p. 336-341 (далее - [1]);
- заявка WO 02/20007, дата публикации: 14.03.2002 (далее - [2]);
- патент РФ 2134105, дата публикации: 10.08.1999 (далее - [3]);
- патент US 2688775, дата публикации: 14.09.1954 (далее - [4]);
- патент СА 1090255, дата публикации: 25.11.1980 (далее - [5]);
- заявка EP 0084865, дата публикации: 03.08.1983 (далее - [6]);
- заявка WO 01/27099, дата публикации: 19.04.2001 (далее - [7]);
- заявка EP 0430551, дата публикации: 05.06.1991 (далее - [8]);
- статья Randall G. Stehle "Physical Chemistry, Stability, and Handling of Prostaglandins E₂, F_{2α}, D₂, and I₂: A Critical Summary" Methods in Enzymology, 1982, vol. 86, p.p. 436-458 (далее - [10]);
- энциклопедия Сарафанова Л.А., ПИЩЕВЫЕ ДОБАВКИ, 2-е изд., испр. и доп., Санкт-Петербург, ГИОРД, 2004, с.718-720 (далее - [11]);
- статья Toshio Nishiyama et al., "In vivo percutaneous absorption of polyoxyethylene lauryl ether surfactants in hairless mice"; J. Soc.Cosmet.Chem., 1983, vol. 34, pp. 263-271 (далее - [12]);
- статья Laposata M. et al., "Fatty acid ethyl esters: recent observations" Prostaglandins Leukot Essent Fatty Acids., 2002 vol. 67(2-3), pp. 193-196 (далее - [13]);
- Химическая энциклопедия под ред. Зефирова Н.С. -М.: Советская энциклопедия, 1995, том 4, с.46-47, 103-104 (далее - [14]);
- статья Anuj Shukla et al., "Microemulsions for Dermal Drug Delivery Studied by Dynamic Light Scattering: Effect of Interparticle Interactions in Oil-in-Water Microemulsions" Journal of Pharmaceutical Sciences, 2003, vol. 92(4) (далее - [15]).

По мнению лица, подавшего возражение, группа изобретений по оспариваемому патенту не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость». Поскольку оспариваемая группа изобретений по пунктам 1, 3-8, 17, 19-21, 23, 25, 27, 29, 31, 33 относится к области фармацевтики, то о возможности осуществления изобретения и реализации им указанного назначения могут свидетельствовать лишь экспериментальные данные. Возможность осуществления изобретения и реализации им указанного назначения подтверждена экспериментально только для соединения любипростон и его ближайших структурных аналогов.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, большая часть альтернатив соединений, лежащих в основе изобретений по пунктам 1, 3-8, 17, 19-21, 23, 25, 27, 29, 31, 33 не является промышленно применимой, поскольку для этих альтернатив не показана возможность осуществления изобретения и реализации назначения.

Относительно несоответствия фармацевтической композиции по независимому пункту 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении отмечено следующее.

По мнению лица, подавшего возражение, наиболее близким аналогом изобретения по независимому пункту 1 формулы является техническое решение, известное из заявки [2].

В заявке [2] раскрыто соединение формулы (I) в качестве активного соединения в композиции, пригодной для облегчения и профилактики запора. При этом композиция, известная из заявки [2], может включать триглицерид жирной кислоты со средней длиной цепи, который обеспечивает стабильность соединения формулы (I). Отличием композиции по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту от композиции, известной из заявки [2] является то, что композиция дополнительно содержит полиол и/или сложный эфир жирной кислоты, представляющий собой эфир жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и

C1-C6 моновалентного спирта. Однако использование полиолов, в частности, глицерина в композициях, содержащих соединение формулы (I), известно из технического решения, раскрытого в заявке [8] (с. 16, стр. 7). Сложные эфиры жирной кислоты и пропиленгликоля известны из энциклопедии [11] (с. 718) в качестве пищевых стабилизаторов E477. Сложный эфир жирной кислоты и полиэтиленгликоля известен из технического решения, раскрытого в статье [12] (с. 3, стр. 16). Сложный эфир жирной кислоты и C1-C6 моновалентного спирта известен из технического решения, раскрытого в статье [13] (реферат).

По мнению лица, подавшего возражение, в описании к оспариваемому патенту отмечается, что задачей изобретения является предложить способ повышения стабильности терапевтически активного бициклического простагландина. Поэтому в возражении сделан вывод, что техническим результатом изобретения является повышение стабильности соединения формулы (I). Однако, как отмечает лицо, подавшее возражение, из описания оспариваемого патента не следует однозначно, относительно чего характеризуется указанное повышение стабильности. Так, на основании данных примера 1, представленного в описании к оспариваемому патенту, лицо подавшее возражение делает вывод о том, что повышение стабильности соединения 1 характеризуется относительно композиций, в которых соединение 1 было смешано с классами соединений, представленных в таблице 2. При этом в возражении отмечено, что для технического решения, известного из статьи [10], раскрыта информация о том, как различные факторы, включая растворитель, в том числе, отличный от глицерида, влияют на стабильность простагландиновых соединений, в частности простагландина E2 (PGE2). Моноциклическая форма любипростона имеет такое же пятичленное кольцо, замещенное кетонной и гидроксильной группой, что и PGE2. Поэтому, по мнению лица, подавшего возражение, специалист ожидал бы, что разложение любипростона идет по такому же механизму, что и PGE2, и факторы, влияющие на стабильность PGE2 аналогичным образом будут влиять на стабильность любипростона. В возражении отмечено, что в статье [10]

анализируется влияние как водных, так и неводных полярных растворителей, имеющих протон, который способен отщепляться, в частности, одноатомных и двухатомных (гликолей) спиртов (с.8, стр. 17-20). Соединения, используемые в оспариваемом патенте для стабилизации соединения формулы (I), являются или апротонными полярными растворителями (сложный эфир жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C1-C6 моновалентного спирта) или неводными полярными растворителями, имеющими протон, который способен отщепляться (полиол). Таким образом, в возражении сделан вывод о том, что из статьи [10] известно влияние отличительных признаков на достигаемый технический результат. При этом в возражении отмечено, что в случае, если технический результат - стабилизация соединений формулы (I), характеризуется не относительно растворителей в таблице 2, а относительно триглицеридов жирных кислот со средней длиной цепи (апротонные полярные растворители), то в данном случае технический результат не достигается.

Признаки зависимого пункта 2 являются частным случаем признаков независимого пункта 1.

Признаки зависимого пункта 3 известны из источников [8] и [14].

Признаки зависимого пункта 4 известны из источника [11].

Признаки зависимого пункта 5 известны из источника [13].

Признаки зависимого пункта 6 известны из источника [15].

Признаки зависимых пунктов 7 и 8 известны из источника [2].

Пункты 2-8, 23, 27, 31 не соответствуют условию патентоспособности изобретательский уровень по той же причине, что и независимый пункт 1.

Относительно несоответствия способа стабилизации по независимому пункту 9 формулы изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении отмечено следующее.

По мнению лица, подавшего возражение, наиболее близким аналогом способа стабилизации по независимому пункту 9 формулы по оспариваемому патенту является техническое решение, известное из заявки [7].

В заявке [7], раскрыт способ стабилизации бициклического соединения формулы (I), включающий смешивание бициклического соединения с триглицеридом (п. 12 формулы).

Отличием способа по оспариваемому патенту от технического решения, известного из заявки [7] является смешивание соединения с полиолом и/или сложным эфиром жирной кислоты, представляющим собой эфир жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C1-C6 моновалентного спирта.

При этом в возражении отмечено, что использование полиолов, в частности, глицерина в композициях, содержащих соединение формулы (I), известно из заявки [8] (с. 16, стр. 7). Сложные эфиры жирной кислоты и пропиленгликоля известны из энциклопедии [11]. Сложный эфир жирной кислоты и полиэтиленгликоля известен из статьи [12] (с. 3, стр. 16). Сложный эфир жирной кислоты и C1-C6 моновалентного спирта известен из статьи [13] (реферат). Технический результат либо не достигается, либо из статьи [10] известно влияние отличительных признаков на достигаемый технический результат.

Кроме того, в возражении отмечено, что содержание зависимых пунктов 10-16, 24, 28, 32 полностью аналогично содержанию зависимых пунктов 2-8, 23, 27, 31. Зависимые пункты 10-16, 24, 28 не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» по той же причине, что и независимый пункт 9.

Относительно несоответствия состава в мягкой желатиновой капсуле по независимому пункту 17 формулы изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении отмечено следующее.

По мнению лица, подавшего возражение, наиболее близким аналогом изобретения по независимому пункту 17 формулы по оспариваемому патенту является техническое решение, известное из заявки [2].

В заявке [2] раскрыто соединение формулы (I) (п. 1 формулы) в качестве активного соединения в композиции, пригодной для облегчения и профилактики запора (слабительного средства) у людей (с. 2, стр. 5), где композиция может содержать фармацевтически приемлемый носитель (с. 26, стр. 10-16) - триглицерид жирной кислоты со средней цепочкой, который является сложным эфиром жирной кислоты, и композиция может содержаться в мягких капсулах.

Отличительным признаком состава по независимому пункту 17 от технического решения, известного из заявки [2], является то, что оболочка мягкой капсулы содержит желатин и полиол в качестве пластификатора.

В возражении отмечено, что мягкие желатиновые капсулы, изготовленные из желатина, пластифицированного полиолом или другим пластификатором, известны из патента [3] (с. 3, левая колонка, стр. 15-20) и патента [4] (колонка 1, абзац 3), где использованы, в частности, глицерин и сорбитол.

В описании к оспариваемому патенту явным образом не определен какой-либо технический результат, связанный с упомянутым отличительным признаком. Однако, по мнению лица, подавшего возражение, присутствие мягкой желатиновой капсулы не влияет на стабильность соединения формулы (I), а стабильность обеспечивается использованием соответствующего растворителя - триглицерида жирной кислоты, как это раскрыто в заявке [2].

Зависимые пункты не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» по той же причине, что и независимый пункт 17.

Относительно несоответствия способа стабилизации по независимому пункту 22 формулы изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении отмечено следующее.

По мнению лица, подавшего возражение, наиболее близким аналогом изобретения по независимому пункту 22 формулы по оспариваемому патенту является техническое решение, известное из заявки [7].

В заявке [7] раскрыт способ стабилизации бициклического соединения формулы (I), включающий смешивание бициклического соединения с триглицеридом (п. 12 формулы), где такая композиция может быть размещена в капсуле (п. 20 формулы).

Отличительным признаком способа по независимому пункту 22 формулы изобретения по оспариваемому патенту от технического решения, известного из заявки [7], является то, что оболочка мягкой капсулы содержит желатин и полиол в качестве пластификатора.

В возражении отмечено, что мягкие желатиновые капсулы, изготовленные из желатина, пластифицированного полиолом или другим пластификатором известны из патента [3] (с. 3, левая колонка, стр. 15-20) и патента [4] (колонка 1, абзац 3), где использованы, в частности, глицерин и сорбитол.

При этом в возражении отмечено, что упомянутый отличительный признак не связан со стабилизацией бициклического соединения формулы (I).

Признаки зависимого пункта 30 не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» ввиду сведений, известных из источников [5] и [6].

Зависимый пункт 34 не соответствует условию патентоспособности изобретательский уровень по той же причине, что и независимый пункт 22 формулы.

Зависимые пункты 26, 30, 35 не соответствуют условию патентоспособности изобретательский уровень по той же причине, что и независимые пункты 9 и 17 формулы.

Второй экземпляр возражения в установленном порядке был направлен в адрес патентообладателя.

Отзыв от патентообладателем был представлен на заседании коллегии, состоявшемся 26.10.2018.

В своем отзыве патентообладатель отмечает, что из уровня техники, в частности, из противопоставленного документа [2] известно, что не только любипростон, но и отличные от него бициклические соединения формулы (I) обладают активностью слабительного средства. Поэтому, по мнению патентообладателя, нет никаких объективных оснований считать, что предложенная группа изобретений, в части независимых пунктов 1 и 17 не реализует указанное назначение и не удовлетворяет условию «промышленной применимости».

При этом патентообладатель отмечает, что из предшествующего уровня техники не было известно, как растворитель, отличный от триглицеридов, влияет на стабильность бициклического соединения формулы (I) и, в частности, не было известно, что стабильность бициклического соединения формулы (I) повышается при добавлении к нему сложного эфира жирной кислоты, отличного от глицеридов. Таким образом, предлагаемая группа изобретений не следует с очевидностью из уровня техники и удовлетворяет условию «изобретательский уровень».

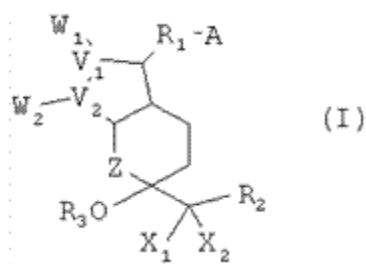
Патентообладатель в своем отзыве выражает несогласие с большинством доводов лица, подавшего возражение. Тем не менее, патентообладатель счел возможным ограничить независимые пункты 1, 9, 17 и 22 формулы изобретения, уточнив структуру соединения формулы (I) как за счет признаков самих независимых пунктов, так и за счет признаков зависимых пунктов 2, 10 и 18 формулы.

Кроме того, в независимых пунктах 1, 9, 17 и 22 уточнены признаки стабилизирующего соединения. Данное уточнение основано на признаках пунктов 27, 28, 29 и 30 формулы.

Зависимые пункты 2, 10, 11, 18, 19, 21, 23-32 формулы изобретения исключены.

Таким образом, патентообладатель счел необходимым вместе с отзывом, поступившим 26.10.2018, представить уточненную формулу группы изобретений в следующей редакции:

«1. Фармацевтическая композиция для лечения или профилактики запора, содержащая бициклическое соединение формулы (I):



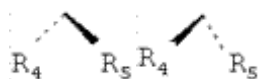
где А представляет собой -COOH;

X₁ и X₂ представляют собой галоген;

V₁ и V₂ представляют собой углерод;

W₁ представляет собой =O;

W₂ представляет собой



где R₄ и R₅ представляют собой водород;

Z представляет собой кислород;

R₁ представляет собой насыщенный двухвалентный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;

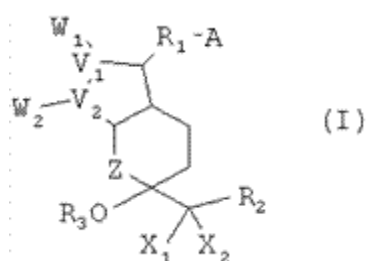
R₂ представляет собой насыщенный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;

R₃ представляет собой водород, и

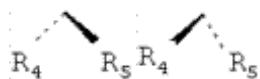
сложный эфир жирной кислоты, представляющий собой эфир жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C₁-C₆ моновалентного спирта.

2. Композиция по п.1, где указанный сложный эфир жирной кислоты представляет собой сложный эфир пропиленгликоля и жирной кислоты.

3. Композиция по п.1, где указанный сложный эфир жирной кислоты представляет собой сложный эфир жирной кислоты и одновалентного C_1 - C_6 -спирта.
4. Композиция по п.3, где упомянутый сложный эфир жирной кислоты представляет собой изопропилпальмитат.
5. Композиция по п.1 в дозированной форме для перорального применения.
6. Композиция по п.5 в форме капсулы.
7. Способ стабилизации бициклического соединения, представленного формулой (I):



где А представляет собой $-COOH$;
 X_1 и X_2 представляют собой галоген;
 V_1 и V_2 представляют собой углерод;
 W_1 представляет собой $=O$;
 W_2 представляет собой



где R_4 и R_5 представляют собой водород;
 Z представляет собой кислород;
 R_1 представляет собой насыщенный двухвалентный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;
 R_2 представляет собой насыщенный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;
 R_3 представляет собой водород,
включающий смешивание данного соединения с сложным эфиром жирной кислоты, представляющим собой эфир жирной кислоты и спирта,

выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C_1 - C_6 моновалентного спирта.

8. Способ по п.7, где указанный сложный эфир жирной кислоты представляет собой сложный эфир пропиленгликоля и жирной кислоты.

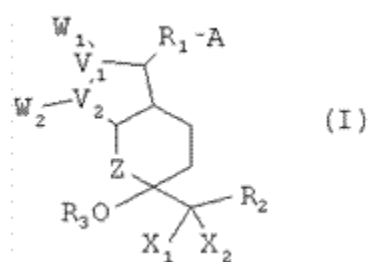
9. Способ по п.7, где указанный сложный эфир жирной кислоты представляет собой сложный эфир жирной кислоты и одновалентного C_1 - C_6 -спирта.

10. Способ по п.9, где упомянутый сложный эфир жирной кислоты представляет собой изопропилпальмитат.

11. Способ по п.7, где получаемая смесь представляет собой дозированную форму, пригодную для перорального применения.

12. Способ по п.11, где дозированная форма представляет собой капсулу.

13. Состав в мягкой желатиновой капсуле для лечения или профилактики запора, содержащий соединение формулы (I):



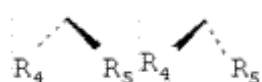
где А представляет собой $-COOH$;

X_1 и X_2 представляют собой галоген;

V_1 и V_2 представляют собой углерод;

W_1 представляет собой $=O$;

W_2 представляет собой



где R_4 и R_5 представляют собой водород;

Z представляет собой кислород;

R_1 представляет собой насыщенный двухвалентный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;

R_2 представляет собой насыщенный низший или среднецепочечный

алифатический углеводородный остаток;

R_3 представляет собой водород,

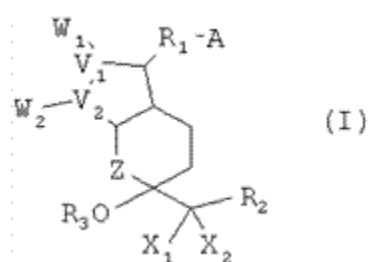
в который входят:

оболочка мягкой желатиновой капсулы, содержащая желатин и полиол в качестве пластификатора, и

смесь, содержащая указанное бициклическое соединение и сложный эфир жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C1-C6 моновалентного спирта, которой заполнена оболочка.

14. Состав по п.13, где сложный эфир жирной кислоты представляет собой глицерид.

15. Способ стабилизации бициклического соединения формулы (I):



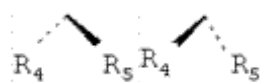
где А представляет собой $-COOH$;

X_1 и X_2 представляют собой галоген;

V_1 и V_2 представляют собой углерод;

W_1 представляет собой $=O$;

W_2 представляет собой



где R_4 и R_5 представляют собой водород;

Z представляет собой кислород;

R_1 представляет собой насыщенный двухвалентный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;

R_2 представляет собой насыщенный низший или среднецепочечный алифатический углеводородный остаток;

R_3 представляет собой водород,

включающий диспергирование или смешивание бициклического соединения с сложным эфиром жирной кислоты, который представляет собой сложный эфир жирной кислоты и спирта, выбранного из группы, состоящей из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и C_1 - C_6 моновалентного спирта, с образованием жидкой смеси, и заключение жидкой смеси в мягкую желатиновую капсулу, оболочка которой содержит желатин и полиол в качестве пластификатора.

16. Состав по п.13, в котором полиол, используемый в качестве пластификатора, представляет собой глицерин.

17. Способ по п.15, в котором полиол, используемый в качестве пластификатора, представляет собой глицерин».

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

С учетом даты подачи заявки (23.01.2007), по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки соответствия изобретения по указанному патенту условиям патентоспособности включает Патентный закон Российской Федерации от 23 сентября 1992 г. №3517-I (далее - Закон) и Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 06.06.2003, зарегистрированные в Министерстве юстиции Российской Федерации 30.06.2003 № 386 (далее - Правила).

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

Изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники.

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

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

Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.1 Правил при установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения. Проверяется также, описаны ли в первичных материалах заявки средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в любом из пунктов формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в материалах заявки допустимо, чтобы указанные средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступными до даты приоритета изобретения. Кроме того, следует убедиться в том, что, в случае осуществления изобретения по любому из пунктов формулы действительно возможна реализация указанного заявителем назначения.

В соответствии с подпунктом 4 пункта 19.5.1 Правил, в отношении изобретения, для которого установлено несоответствие условию промышленной применимости, проверка новизны и изобретательского уровня не проводится.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.3. Правил 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 аналога в соответствии с пунктом 3.2.4.2 настоящих Правил;
- 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 7 пункта 19.5.3. Правил подтверждения известности влияния отличительных признаков на технический результат не требуется, если в отношении этих признаков такой результат не определен заявителем или в случае, когда установлено, что указанный им технический результат не достигается.

Согласно пункту 3.2.4.2. Правил в качестве аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений, ставших общедоступными до даты приоритета изобретения, характеризующее совокупностью признаков, сходной с совокупностью существенных признаков изобретения.

При описании каждого из аналогов приводятся библиографические данные источника информации, в котором он раскрыт, признаки аналога с указанием тех из них, которые совпадают с существенными признаками заявляемого изобретения, а также указываются известные заявителю причины, препятствующие получению требуемого технического результата.

Согласно пункту 22.3 Правил 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 пункту 4.9 Правил ППС при рассмотрении возражения против выдачи патента на изобретение, полезную модель и промышленный образец, коллегия палаты по патентным спорам вправе предложить патентообладателю внести изменения в формулу изобретения, в случае, если без внесения указанных изменений оспариваемый патент должен быть признан недействительным полностью, а при их внесении могут быть признаны

недействительным частично. Указанные изменения должны соответствовать изменениям формулы изобретения, которые предусмотрены правилами составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, правилами составления, действовавшими на дату подачи заявки.

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

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «изобретательский уровень», показал следующее.

В каждом независимом пункте формулы, характеризующей группу изобретений по оспариваемому патенту, указано назначение изобретений.

Действительно, можно согласиться с мнением патентообладателя о том, что соединения общей формулы (I), лежащие в основе группы изобретений по оспариваемому патенту, по большей части известны из уровня техники, раскрытом в описании к оспариваемому патенту, а также известна как их фармакологическая активность, так и возможность их стабилизирования глицеридом. Однако, следует отметить, что оспариваемая группа изобретений направлена не на поиск новых соединений для лечения, в том числе запора, а на поиск растворителей, отличных от глицерида, для стабилизации терапевтически активных бициклических простогландинов общей формулы (I). Здесь следует согласиться с мнением лица, подавшего возражение, что соответствующие данные, иллюстрирующие данное свойство (назначение) приведены только в отношении стабилизации любипростона и его ближайших аналогов.

Таким образом, сведения, подтверждающие возможность осуществления изобретения, в описании к оспариваемому патенту приведены только в отношении композиций, содержащих в качестве стабилизируемого соединения – соединение 1, входящее в группу соединений формулы (I), лежащих в основе группы изобретений по оспариваемому патенту. Соединение 1 представляет собой простогландин, имеющий международное непатентованное название «лубипростон» (далее – любипростон). Реализация назначения группы изобретений по оспариваемому патенту также продемонстрирована только в отношении любипростона в различных средах (растворителях) (пример 1, сравнительный пример 2).

Можно констатировать, что в описании к оспариваемому патенту действительно не показана реализация назначения для всего объема соединений формулы (I), лежащих в основе группы изобретений по оспариваемому патенту, а показана только в отношении любипростона.

Таким образом, группа изобретений по оспариваемому патенту в большей части альтернатив не соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (пункт 1 статьи 4 Закона).

Представленная патентообладателем уточненная формула ограничена в отношении соединений формулы (I), входящих в объекты по независимым пунктам 1, 9, 17 и 22 (пункты 1, 7, 13 и 15 уточнённой редакции), соединением 1 (любипростон) и его аналогами той же химической природы. Кроме того, группа изобретений уточнена в отношении системы стабилизирующих растворителей путем внесения признаков из зависимых пунктов 27, 28, 29 и 30 формулы.

В отношении изобретений по независимым пунктам 1, 7, 13 и 15 уточненной патентообладателем формулы следует отметить, что поскольку объем данных пунктов уточнен в части соединений формулы (I) любипростоном и его аналогами той же химической природы, в отношении которых показана реализация назначения, то представленная уточненная

формула изобретения соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость».

Таким образом, уточненная заявителем формула изобретения, содержащая четыре независимых пункта 1, 7, 13 и 15 (фармацевтическая композиция, способ стабилизации, состав в мягкой желатиновой капсуле и способ стабилизации с заключением полученной композиции в мягкую желатиновую капсулу), принята к рассмотрению.

Ввиду того, что патентообладатель уточнил формулу изобретения, не только ограничив соединения формулы (I), но и внес признаки зависимых пунктов, уточняющие растворители для стабилизации простагландинового соединения, уточненная формула в соответствии с п.5.1. Правил ППС была направлена на дополнительный информационный поиск.

По результатам проведения указанного поиска 11.01.2019 был представлен отчет о проведении дополнительного поиска и заключение экспертизы.

К отчету приложены следующие источники информации (копии):

- заявка WO 02/20007, дата публикации 14.03.2002 (далее - [2]);
- патент US 6673841, дата публикации 06.01.2004 (далее - [16]);
- патент US 4409239, дата публикации 11.10.1983 (далее - [17]);
- заявка EP 0008227, дата публикации 20.02.1980 (далее - [18]);
- заявка US 2004253306, дата публикации: 16.12.2004 (далее - [19]);
- патент US 4935243, дата публикации 19.06.1990 (далее - [20]);
- Краткая химическая энциклопедия под ред. Кнунянц И.Л. -М.: Советская энциклопедия, 1967, том 5, кол.1057-1062 (далее - [21]).

Согласно заключению экспертизы группа изобретений по уточненной заявителем формуле удовлетворяет условию патентоспособности «новизна», предусмотренному п.1 статьи 4 Закона.

В отношении соответствия группы изобретений по уточненной заявителем формуле условию патентоспособности «промышленная применимость» в заключении экспертизы отмечено следующее.

Изобретения по пунктам 1-6, 10, 13, 14, 16 формулы соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость».

Для способов стабилизации бициклического соединения формулы (I) по независимым пунктам 7 и 15 в альтернативах, когда в качестве сложного эфира выбран:

- сложный эфир жирной кислоты и полиэтиленгликоля;
- сложный эфир жирной кислоты и пропиленгликоля;
- сложный эфир жирной кислоты и одновалентного C1-C6 спирта, отличного от изопропилпальмитата,

возможность реализации назначения не продемонстрирована примерами.

Так, в заключении экспертизы отмечено, что в отношении использования сложного эфира жирной кислоты и полиэтиленгликоля данных не представлено.

При использовании сложного эфира жирной кислоты и пропиленгликоля наблюдалось более чем десятипроцентное снижение концентрации соединения 1, т.е. указанное назначение не реализуется.

В отношении использования сложного эфира жирной кислоты и одновалентного C1-C6 спирта, отличного от изопропилпальмитата, данных не представлено.

При этом из энциклопедии [21] известно, что различные сложные эфиры отличаются по физическим и химическим свойствам в зависимости от строения (колонки 1058-1061). В частности, раскрыто, что термическая устойчивость сложных эфиров существенно зависит от длины цепи и степени разветвленности радикалов (колонка 1059).

Таким образом, в заключении экспертизы сделан вывод о том, что способы стабилизации по независимым пунктам 7 и 15, а также зависимые от

них пункты 8, 9, 11, 12, 17 в указанных альтернативах не соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость».

Изобретения по пунктам 7, 9, 11, 12, 15, 17 в альтернативе, включающей использование изопропилпальмитата соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость».

В отношении соответствия группы изобретений по уточненной заявителем формуле условию патентоспособности «изобретательский уровень» в заключении экспертизы отмечено следующее.

Наиболее близким аналогом изобретений по независимому пункту 1 (пункты 2-6 зависимые) и независимому 13 (пункт 16 зависимый) является заявка [2], в которой раскрыты слабительные композиции, включающие простагландины, в т.ч. соответствующие формуле (I) настоящей заявки. Указанные композиции могут также содержать триглицериды со среднецепочечными жирнокислотными остатками, причем согласно примеру, приведенному в описании (с.34-38), растворение простагландина в триглицериде увеличивает его стабильность при хранении по сравнению с кристаллической формой. Кроме того, из заявки [2] известно, что слабительная композиция может быть представлена в виде жидкой композиции, заключенной в мягкие желатиновые капсулы (с.41 описания, пример с. 44-45).

Отличием изобретений по независимым пунктам 1 и 13 уточненной формулы является то, что в качестве соединения, повышающего стабильность простагландина формулы (I), вместо триглицеридов выбраны другие сложные эфиры, а именно сложные эфиры жирной кислоты и спирта, выбранного из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и одновалентного C1-C6 спирта. Изобретение по независимому пункту 13 уточненной формулы дополнительно отличается указанием, что в качестве пластификатора мягких желатиновых капсул используется полиол.

Однако, создание композиций соединений, относящихся к классу простагландинов, в сочетании со сложными эфирами пропиленгликоля и

полиэтиленгликоля известно из патента [16] (колонка 3 описания, п.1 формулы).

Стабильные фармацевтические композиции соединений PGE-типа, включающие указанное соединение и, по меньшей мере, один диэфир пропиленгликоля и короткоцепочечной жирной кислоты, известны из патента [17] (п. 1 формулы).

Фармацевтические композиции, содержащие простагландиновые соединения, в том числе соответствующие соединениям формулы (I) оспариваемого патента, содержащие сложный эфир полиэтиленгликоля, известны из заявки [18] (ПЭГ диолеат с. 12 описания, примеры 10, 14 и ПЭГ моностеарат пример 9).

Что касается использования полиолов в качестве пластификаторов мягких желатиновых капсул, то это распространенный прием в области фармацевтики, известный специалисту в данной области техники. Так, из технического решения по заявке [19] известно, что полиолы, такие как глицерин или сорбитол, используются в качестве пластификаторов мягких желатиновых капсул, которые могут включать жидкое, полужидкое или пастообразное содержимое (абзац [0006]). В техническом решении, известном из заявки [20], раскрыто, что мягкие желатиновые капсулы пластифицируют глицерином, сорбитолом или подобными полиолами (колонка 1; пп.1-3 формулы).

Как следует из описания к оспариваемому патенту и дополнительных материалов, в качестве технического результата указывается либо повышенная стабильность соединения формулы (I), либо расширение арсенала технических средств определенного назначения - композиций стабильного бициклического соединения формулы (I).

Как отмечено выше, достижение технического результата и реализация назначения изобретений показаны только в отношении сложного эфира жирной кислоты и изопропилпальмитата.

Что касается применения полиола в качестве пластификатора мягких желатиновых капсул, то для данного признака заявителем не определен обеспечиваемый им технический результат.

Таким образом, изобретения по независимым пунктам 1 и 13 уточненной формулы, а также зависимые пункты 2, 3, 5, 6, 16 в альтернативах применения сложного эфира жирной кислоты и полиэтиленгликоля, сложного эфира жирной кислоты и пропиленгликоля или сложного эфира жирной кислоты и одновалентного C1-C6 спирта, отличного от изопропилпальмитата, не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Что касается изобретений по независимым пунктам 1 и 13 уточненной формулы изобретения (зависимые пункты 3, 4, 5, 6, 16) в альтернативе использования изопропилпальмитата, то указанные изобретения соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Что касается способов по независимым пунктам 7 и 15 (зависимые пункты 9, 10, 11, 12, 17) в альтернативе использования изопропилпальмитата, то в уровне техники не обнаружено способов стабилизации соединения формулы (I) путем добавления указанного сложного эфира. Изобретения по данным пунктам соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Анализируя вышеизложенное, следует согласиться с мнением экспертизы о том, что уточненная формула группы изобретений по пунктам 1-6, 10, 13, 14, 16 формулы соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость».

Также целесообразно согласиться с мнением экспертизы, что для способов стабилизации бициклического соединения формулы (I) по независимым пунктам 7 и 15 в альтернативе, когда в качестве сложного эфира выбран сложный эфир жирной кислоты и полиэтиленгликоля, возможность реализации назначения не продемонстрирована.

Что касается альтернативы, согласно которой в качестве сложного эфира выбран сложный эфир жирной кислоты и одновалентного C1-C6 спирта, то

следует отметить, что реализация назначения действительно продемонстрирована в случае, когда в качестве сложного эфира жирной кислоты и одновалентного C1-C6 спирта выступает изопропилпальмитат. При этом из энциклопедии [21] известно, что сложные эфиры отличаются по физическим и химическим свойствам, их поведение зависит как от длины цепи, так и от степени разветвленности. В связи с этим невозможно экстраполировать данные, полученные для одного изопропилпальмитата, который является соединением изопропилового спирта и пальмитиновой кислоты, на всю группу сложных эфиров жирной кислоты и одновалентного C1-C6 спирта. Таким образом, в данном случае также можно согласиться с мнением, изложенным в заключении экспертизы, о том, что условию промышленной применимости соответствует только частный случай упомянутой альтернативы, а именно, использование изопропилпальмитата.

Назначением изобретений по пунктам 7 и 15 является стабилизация соединения формулы (I), однако, в случае альтернативы, когда в качестве сложного эфира выбран сложный эфир жирной кислоты и пропиленгликоля, в реализации упомянутого назначения действительно можно усомниться. Так, при использовании сложного эфира жирной кислоты и пропиленгликоля наблюдалось более чем десятипроцентное снижение концентрации соединения I. При этом следует отметить, что такое снижение зафиксировано уже на 10-й день эксперимента, т.е. указанное назначение действительно не будет реализовано, несмотря на то, что патентообладатель отмечает, что не ставилась задача повышения стабильности, а лишь достижение стабильности соединения формулы (I).

Таким образом, способы стабилизации по независимым пунктам 7 и 15 уточненной формулы соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость» в альтернативе использования изопропилпальмитата.

В отношении соответствия группы изобретений по уточненной заявителем формуле условию патентоспособности «изобретательский уровень» необходимо отметить следующее.

Наиболее близким аналогом изобретений по независимому пункту 1 и независимому пункту 13 уточненной формулы является заявка [2], в которой раскрыты слабительные композиции, включающие простагландины, в т.ч. соответствующие формуле (I) по оспариваемому патенту, которые могут также содержать триглицериды со среднецепочечными жирнокислотными остатками. При этом, из технического решения, раскрытого в заявке [2] (с.34-38), известно, что триглицериды увеличивают стабильность простагландинов при хранении по сравнению с кристаллической формой (которая сама по себе более стабильна, чем соединение в аморфной форме).

Также из технического решения, раскрытого в заявке [2] (с. 44-45), известно, что слабительная композиция может быть представлена в виде жидкой композиции, заключенной в мягкие желатиновые капсулы.

Следует согласиться с мнением, изложенным в заключении экспертизы, что отличием изобретений по независимым пунктам 1 и 13 уточненной формулы является использование в качестве соединений, повышающих стабильность простагландина формулы (I), сложных эфиров жирной кислоты и спирта, выбранного из пропиленгликоля, полиэтиленгликоля и одновалентного C1-C6 спирта.

Композиции соединений, относящихся к классу простагландинов, в сочетании со сложными эфирами пропиленгликоля и полиэтиленгликоля известны из патента [16].

Так, техническое решение, известное из патента [16], описывает композицию, содержащую алкиловый эфир алпростадилла (соединение PGE1-типа), масляный носитель, усилитель проникновения через кожу и средство против раздражения. В качестве алкилового эфира алпростадилла в техническом решении, известном из патента [16], может быть использован любой алпростадил, этерифицированный низшим алкилом, имеющим 1-5 атомов

углерода. В частности, техническое решение по патенту [16] основано на использовании этиловых эфиров алпростадилла. Примеры масляного носителя, содержащегося в композиции, включают сложные эфиры глицерина и жирных кислот, такие как моно- или триглицериды жирных кислот, включая их комплекс с полиэтиленгликолем, сложные эфиры полиэтиленгликоля растительных масел и сложные эфиры пропиленгликоля жирных кислот. Одной из задач, на выполнение которой направлено техническое решение, известное из патента [16], является стабильность композиции алпростадилла.

Здесь уместно отметить, что в оспариваемом патенте композиции содержат, как моноциклическую форму соединения I, так и бициклическую форму при следующих вариантах соотношения 1:6, 1:10, 50:50, 10:90 (с.9 описания к оспариваемому патенту). Т.е., стабилизируется состав, как он есть, а не только бициклическая форма.

Кроме того, стабильные фармацевтические композиции соединений PGE-типа, включающие соединение формулы I, и, по меньшей мере, один диэфир пропиленгликоля и короткоцепочечной жирной кислоты, известны из патента [17] (п. 1 формулы).

Композиции, содержащие простагландиновые соединения, в том числе соответствующие соединениям формулы (I) по оспариваемому патенту, содержащие сложный эфир полиэтиленгликоля, известны из заявки [18].

Что касается использования полиолов в качестве пластификаторов мягких желатиновых капсул, то следует согласиться с мнением, изложенным в заключении экспертизы, о том, что это распространенный прием в области фармацевтики, известный специалисту в данной области техники из источников информации [19] и [20].

Таким образом, изобретение по пунктам 1 и 13 уточненной формулы по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» только в части альтернативы, представляющей собой сложный эфир жирной кислоты и одновалентного C1-C6 спирта, в качестве которого выступает изопропилпальмитат.

Что касается способов по независимым пунктам 7 и 15 в альтернативе использования изопропилпальмитата, то, как отмечено выше, в уровне техники не обнаружено способов стабилизации соединения формулы (I) путем добавления упомянутого сложного эфира.

Таким образом, изобретения по независимым пунктам 7 и 15 уточненной формулы соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» в части альтернативы, представляющей собой сложный эфир жирной кислоты и одновалентного C1-C6 спирта, в качестве которого выступает изопропилпальмитат.

Поскольку уточненная формула изобретения признана несоответствующей условию патентоспособности «изобретательский уровень» частично, то патентообладателю было предложено скорректировать уточненную формулу изобретения с учетом отчета о дополнительном информационном поиске и разъяснений экспертизы.

На заседании коллегии, состоявшемся 15.04.2019, патентообладателем была представлена скорректированная формула изобретения (см. приложение 2 к протоколу), уточненная путем исключения из независимых пунктов признаков одной из трех признанных непатентоспособными альтернатив, а именно исключена альтернатива, представляющая собой применения сложного эфира жирной кислоты и полиэтиленгликоля. Также исключен зависимый пункт 14, оставленный в уточненной формуле по ошибке, что также было отмечено в заключении экспертизы.

Кроме того, на заседании коллегии, состоявшемся 15.04.2019, патентообладателем представлено особое мнение, в котором приведены доводы о соответствии повторно уточненной формулы группы изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень».

В отношении соответствия условию патентоспособности «промышленная применимость» доводы патентообладателя по существу повторяют доводы, изложенные им в отзыве, которые проанализированы выше.

В отношении доводов, изложенных в особом мнении о соответствии группы изобретений условию патентоспособности «новизна» следует отметить, что ни в возражении, ни в отчете о дополнительном поиске не было приведено источников информации порочащих новизну изобретений по оспариваемому патенту.

В отношении соответствия условию патентоспособности «изобретательский уровень» в особом мнении отмечено следующее.

Патентообладатель акцентирует внимание на том, что, по его мнению, неверно трактуется технический результат достигаемый изобретением. Так, в особом мнении подчеркивается, что на момент создания группы изобретений была известна способность стабилизировать соединения формулы (I) с использованием триглицеридов. Однако, превосходная активность соединений формулы (I), являющихся малостабильными, диктовала необходимость поиска альтернативных стабилизирующих веществ. Таким образом, по мнению патентообладателя, технический результат изобретения можно сформулировать, как получение альтернативных стабильных композиций любипростона или как расширение арсенала методов стабилизации соединений формулы I.

Иными словами, не смотря на то, что соединения класса простогландинов были стабилизированы ранее в известном уровне техники, патентообладатель полагает, что технический результат заключается не в повышении стабильности простогландинов, а в расширении арсенала средств для стабилизирования упомянутых соединений.

Патентообладатель в особом мнении приводит свой анализ источников информации [1]-[21], которые проанализированы выше в данном заключении.

Относительно технического результата, представляющего собой расширение арсенала средств для стабилизации простогландинов, следует отметить, что такая трактовка технического результата была учтена при проведении дополнительного информационного поиска. Указанное нашло свое отражение в заключении экспертизы, на основании которого был сделан вывод

о несоответствии группы изобретений по уточненной патентообладателем формуле условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Следует констатировать, что повторно уточненная формула группы изобретений по оспариваемому патенту не устранила причин, послуживших основанием для сделанного выше вывода.

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

удовлетворить возражение, поступившее 24.07.2018 патент Российской Федерации на изобретение №2440144 признать недействительным полностью.