

ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии палаты по патентным спорам
по результатам рассмотрения ☒ возражения ☐ заявления

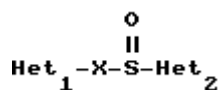
Коллегия палаты по патентным спорам в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 Гражданского кодекса Российской Федерации (далее – Кодекс) и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение компании «ЗЕНТИВА к.с.», Чешская Республика (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее 05.10.2012, против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2166935, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2166935 на группу изобретений "Таблетированная многоединичная лекарственная форма, способ ее получения, способ ингибирования секреции желудочной кислоты или лечения желудочно-кишечных заболеваний у млекопитающих и человека" с приоритетом от 08.07.1994, выдан по заявке № 96107040/14 на имя компании «АСТРА АКТИЕБОЛАГ», Швеция (далее – патентообладатель). Патент действует со следующей формулой:

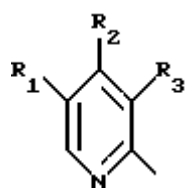
1. Таблетированная многоединичная лекарственная форма, содержащая активное вещество, выбранное из соединения ингибитора H^+K^+ АТФазы, одного его индивидуального энантиомера и его щелочной соли, отличающаяся тем, что индивидуально покрытые энтеросолюбильным слоем единицы материала ядра, содержащие активное вещество, необязательно смешанное со щелочными соединениями, смешано с наполнителями таблетки и спрессовано в таблетки, причем слой энтеросолюбильного покрытия имеет такие механические свойства, что прессование отдельных единиц, смешанных с наполнителями в многоединичную таблетированную лекарственную форму, не оказывает

значительного влияния на кислотостойкость покрытых энтеросолюбильным слоем единиц.

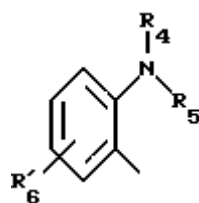
2. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что активным веществом является соединение общей формулы 1, или его щелочная соль, или один из его энантиомеров, или его щелочная соль



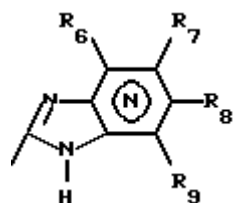
где Het₁ представляет собой



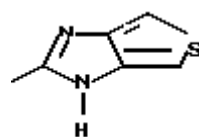
ИЛИ



Het₂ представляет собой

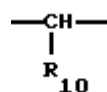


ИЛИ

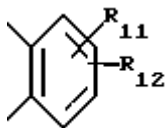


ИЛИ

X обозначает



или



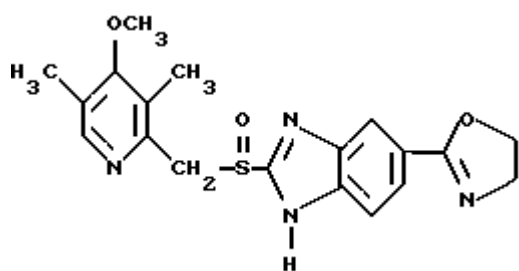
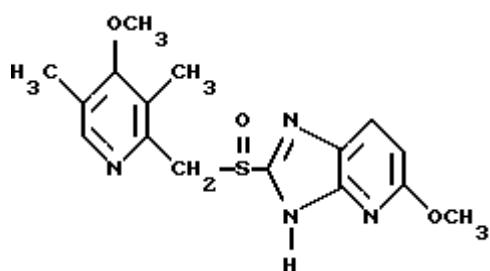
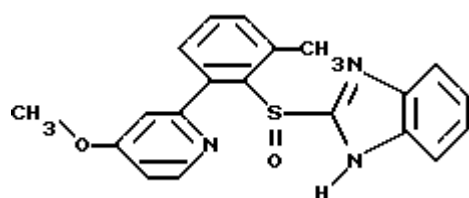
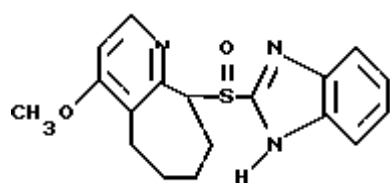
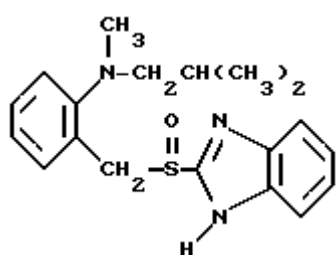
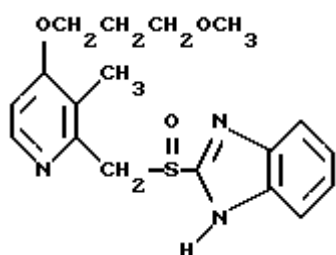
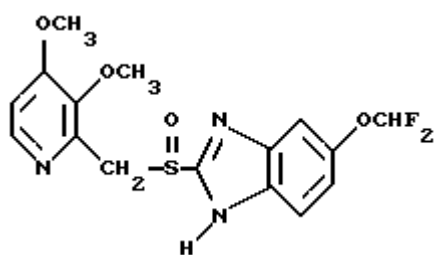
где N в бензимидазольном остатке молекулы обозначает, что один из атомов углерода, замещенных R_6 - R_9 , необязательно заменен атомом азота без каких-либо заместителей;

R_1 , R_2 и R_3 - одинаковы или различны и выбраны из водорода, алкила, алкоксигруппы, необязательно замещенных фтором, алкилтио-, алкоксиалкокси-, диалкиламино-, пиперидино-, морфолиногруппой, галогеном, фенилом и фенилалкоксигруппой;

R_4 и R_5 - одинаковы или различны и выбраны из водорода, алкила и аралкила; R'_6 представляет собой водород, галоген, трифторметил, алкил и алкоксигруппу; R_6 - R_9 - одинаковы или различны и выбраны из водорода, алкила, алкоксигруппы, галогена, галогеналкоксигруппы, алкилкарбонила, алкоксикарбонила, оксазолила, трифторалкила или смежные группы R_6 - R_9 образуют кольцевые структуры, которые могут быть дополнительно замещенными;

R_{10} представляет собой водород или образует вместе с R_3 алкиленовую цепь; R_{11} и R_{12} - одинаковы или различны и выбраны из водорода, галогена или алкила, за исключением соединений 5-метокси-2-[(4-метокси-3,5-диметил-2-пиридинил)метил] сульфинил] -1Н-бензимидазола, 5-фтор-2-[(4-циклопропилметокси-2-пиридинил)метил] сульфинил] -1Н-бензимидазола и 5-карбометокси-6-метил-2-[(3,4-диметокси-2-пиридинил)метил] сульфинил]-1Н-бензимидазола, или их одиночных энантиомеров, или их щелочных солей.

3. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что активным веществом является одно из следующих соединений:



или его щелочная соль, или один из его энантиомеров, или его щелочная соль.

4. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что кислотостойкость отдельно покрытых энтеросолюбильным слоем единиц соответствует требованиям, предъявляемым к покрытым энтеросолюбильным слоем изделиям, определенным в United States Pharmacopeia.
5. Таблетированная лекарственная форма по п.4, отличающаяся тем, что имеет твердость по Викерсу менее 8.
6. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что кислотостойкость отдельно покрытых энтеросолюбильным слоем единиц не уменьшается более чем на 10% во время таблетирования.
7. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что слой энтеросолюбильного покрытия содержит пластификатор.
8. Лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что энтеросолюбильное покрытие имеет толщину по меньшей мере 10 мкм.
9. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что отдельно покрытые энтеросолюбильным слоем единицы дополнительно покрыты защитным слоем, содержащим фармацевтически приемлемые наполнители.
10. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что является разделяемой.
11. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что она является диспергируемой в водном растворе с образованием суспензии отдельно покрытых энтеросолюбильным слоем единиц, содержащих активное вещество.
12. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что разделяющий слой расположен под энтеросолюбильным слоем.
13. Таблетированная лекарственная форма по п.12, отличающаяся тем, что разделяющий слой содержит фармацевтически приемлемые наполнители, которые растворимы или нерастворимы, но дезинтегрируются в воде и необязательно являются щелочными соединениями.

14. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что материал ядра представляет собой включение, прослоенное активным веществом.

15. Таблетированная лекарственная форма по п.12, отличающаяся тем, что включения имеют размер 0,1 - 2 мм.

16. Таблетированная лекарственная форма по пп. 1 - 15 как ингибитор секреции желудочной кислоты или средство лечения желудочно-кишечных воспалительных заболеваний у млекопитающих и человека.

17. Способ получения таблетированной многоединичной лекарственной формы по п. 1, согласно которому единицы материала, содержащие активное вещество, смешивают, в случае необходимости, со щелочными соединениями, затем могут быть покрыты разделяющими слоями, наносят энтеросолубильное покрытие, смешивают с наполнителями и таблетуют.

18. Способ по п.17, отличающийся тем, что отдельно покрытые энтеросолубильным слоем единицы активного вещества дополнительно покрывают защитным слоем перед прессованием.

19. Способ ингибирования секреции желудочной кислоты или лечения желудочно-кишечных заболеваний у млекопитающих и человека путем введения терапевтически эффективной дозы многоединичной таблетированной лекарственной формы по любому из пп.1 - 16.

Против выдачи данного патента в палату по патентным спорам, в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса, было подано возражение, мотивированное несоответствием группы изобретений в объеме независимых пунктов 1, 19 формулы по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень», а пункта 17 формулы по оспариваемому патенту - условию патентоспособности «изобретательский уровень».

К возражению приложены следующие материалы:

- патентный документ EP № 0247983 (далее- [1]);

- статья из журнала Американской ассоциации ученых – фармацевтов «Фармацевтические исследования», № 10, октябрь 1993г (далее- [2]);
- статья «Новая кишечно-растворимая таблетка ацетилсалициловой кислоты». Международный журнал по фармацевтике, 1987, № 37(далее- [3]);
- патентный документ EP № 0519144 (далее- [4]);
- материалы из Интернет-сайта http://www.rlsnet.ru/tn_index_id_1496.htm (далее- [5]);
- материалы из Интернет-сайта www.slovari.yandex.ru (БСЭ), www.medlinks.ru (далее- [6]);
- материалы из Интернет-сайта <http://ru.wikipedia.org/wiki/>(далее- [7]).

По мнению лица, подавшего возражение, охарактеризованное в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту изобретение, не соответствует условию патентоспособности «новизна», исходя из сведений, представленных в патентном документе [1].

В возражении, в частности, отмечено, что в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту введена «лишняя» характеристика свойств энтеросолюбильного покрытия, напрямую следующая из самой природы подобных покрытий. Причем, упругая деформация полимеров, обеспечивающая сохранность покрытия от разрушения при сжатии, зависит от количества используемого для покрытия полимера и физических свойств самого полимера.

В возражении обращается внимание на то, что использование энантиомеров омепразола и энантиомеров его щелочных солей «прямо следует для специалиста из патентного документа [1], поскольку понятие «омепразол» «в большинстве случаев изначально содержит в своём составе смесь энантиомеров». В качестве подтверждения данного мнения лицо, подавшее возражение, указывает Интернет – сайт [6], где содержатся сведения справочного характера о понятиях энантиомера и рацемата. Данная информация, по мнению лица, подавшего возражение, свидетельствует о том, что при всех химических превращениях, при которых образуются асимметричные атомы углерода, всегда получаются рацематы, а так же о том, что препараты, являющиеся ингибиторами

H^+K^+ АТфазы (в том числе омепразол) являются рацематами, то есть, смесью энантиомеров.

Лицо, подавшее возражение считает, что признаки, касающиеся защиты от разрушающего влияния процесса прессования, объективно присущи известному из патентного документа [1] средству.

По мнению лица, подавшего возражение, изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 19 формулы по оспариваемому патенту, также не соответствует условию патентоспособности «новизна», поскольку из патентного документа [1] известны как сама таблетированная лекарственная форма, так и применение именно такой лекарственной формы для регулирования (ингибирования, подавления) секреции желудочной кислоты и/или лечения желудочно-кишечных воспалительных заболеваний.

В отношении несоответствия группы изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1, 17, 19 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в возражении отмечено, в частности, следующее.

Изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту с очевидностью для специалистов следует из уровня техники, представленного в патентном документе [1], статье [2], интернет - сайте [6].

Изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 17 формулы по оспариваемому патенту с очевидностью для специалистов следует из патентного документа [1].

Так, по мнению лица, подавшего возражение, в пункте 17 формулы по оспариваемому патенту изложена лишь общая последовательность действий без указания на использование каких-либо специальных средств для осуществления таких действий и на конкретный вид этих действий. При этом из патентного документа [1] с очевидностью для специалистов данной области техники следует смешивание лекарственных единиц со щелочными соединениями (с.8, линии 3-4), покрытие их разделяющим слоем защитного покрытия (с.8, линии 8-11),

нанесение энтеросолюбильного покрытия (с.8, линии 14-18, с.8 линии 36-37, с.9 линии 1,2) смешивание с наполнителями и таблетирование (с.8, линии 23-24, с.20, линии 36-37).

В отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 19 формулы по оспариваемому патенту в возражении отмечено, что из патентного документа [1] известна как таблетированная лекарственная форма, так и ее применение для ингибирования секреции желудочной кислоты и/или лечения желудочно-кишечных воспалительных заболеваний у человека (с.1, линии 5-7, 12-16, с.9, линии 4-6, реферат). При этом использование для лечения терапевтически эффективной дозы очевидно для специалиста.

В отношении признаков зависимых пунктов 3-16, 18 формулы по оспариваемому патенту в возражении отмечено, что они также известны из источников информации [1] – [4].

В адрес патентообладателя в установленном порядке было направлено уведомление с приложением экземпляра возражения согласно пункту 3.1 Правил ППС.

Патентообладатель представил отзыв по мотивам возражения.

В отзыве обращается внимание на то, что в изобретении по оспариваемому патенту используется не смесь энантиомеров, а один из энантиомеров. При этом мнение лица, подавшего возражение, о том, что «использование энантиомеров определенного ингибитора ($H^+K^+ATФазы$) следует из патентного документа [1], поскольку само вещество омепразол в большинстве случаев уже изначально содержит в своем составе смесь энантиомеров», является ошибочным.

По мнению патентообладателя, источник информации [2] не относится к рассматриваемой области техники – многоединичным таблеткам, спрессованным из единиц ингибиторов $H^+K^+ATФазы$, покрытых энтеросолюбильным слоем. Также в источнике [2] не упоминаются ингибиторы $H^+K^+ATФазы$ или иное неустойчивое к кислоте вещество.

В отзыве отмечено, что механические свойства покрытия, сформулированные в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту,

не связаны с какими-либо конкретными показателями твёрдости и определяются свойством энтеросолюбильного покрытия «защищать активное вещество от агрессивных сред, несмотря на прессование единиц в таблетку».

Известная из источника информации [2] величина разрушения плёночного покрытия, «неприемлема для активного вещества», используемого в изобретении по оспариваемому патенту.

Патентообладатель обращает внимание на то, что относительные величины потерь активного вещества не могут механически переноситься с одного вещества на другое без учёта свойств конкретного активного вещества. Так, в статье [3] применяется ацетилсалициловая кислота, в то время как в изобретении по оспариваемому патенту - ингибитор H^+K^+ АТфазы. По мнению патентообладателя, по отношению к таким веществам, как ингибиторы H^+K^+ АТфазы, процент потерь активного вещества будет больше, чем показанные в D3 10% для ацетилсалициловой кислоты.

В отзыве отмечено, что разделительный слой, который лицо, подавшее возражение, считает защитным, напротив, является самостоятельным и отдельным от защитного слоя.

Патентообладатель указывает, что, поскольку способ по независимому пункту 17 формулы по оспариваемому патенту предназначен для получения лекарственной формы по независимому пункту 1 данной формулы, то приведенные выше аргументы также относятся к решению по независимому пункту 17 формулы по оспариваемому патенту.

Кроме того, патентообладатель указывает, что последовательность действий при получении лекарственной формы не раскрыта в представленных в возражении источниках информации [1]-[5]. По мнению патентообладателя, лицо, подавшее возражение, неоправданно совмещает различные стадии приготовления лекарственных форм из различных частей патентного документа [1], относящиеся к различным лекарственным формам.

Признаки, касающиеся стадии «смешивают с наполнителями и таблетуют» по независимому пункту 17 формулы по оспариваемому патенту

описывают смешивание с наполнителями таблетки и прессование в таблетки не гранулированной смеси активного вещества, а последовательно покрытых энтеросолюбильным слоем единиц, что не соответствует изложенному в патентном документе [1].

Патентообладатель также обращает внимание на то, что в источниках информации [1]-[6] не содержится сведений об известности признаков по всем зависимым пунктам формулы по оспариваемому патенту.

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

С учетом даты международной подачи заявки (07.06.1995), на основании которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для проверки патентоспособности группы изобретений по указанному патенту включает Патентный закон Российской Федерации от 23 сентября 1992 г. № 3517-1 (далее – Закон), Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатентом от 20.09.1993, зарегистрированными в Минюсте РФ 05.11.1993, № 386 (далее Правила ИЗ).

Согласно пункту 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.

Согласно подпункту 1 пункта 3.3.1 Правил ИЗ формула изобретения предназначается для определения объема правовой охраны, предоставляемой патентом.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.2 Правил ИЗ, проверка новизны изобретения проводится в отношении всей совокупности признаков, содержащихся в независимом пункте формулы изобретения.

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.2 Правил ИЗ, изобретение не признается соответствующим условию новизны, если в уровне техники выявлено средство, которому присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в предложенной заявителем формуле изобретения, включая характеристику назначения.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.3 Правил ИЗ, проверка изобретательского уровня проводится в отношении изобретения, охарактеризованного в независимом пункте формулы, и включает:

- определение наиболее близкого аналога;
- выявление признаков, которыми отличается заявленное изобретение от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);
- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками рассматриваемого изобретения.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.3 Правил ИЗ, изобретение признается соответствующим условию изобретательского уровня, если не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно подпункту 5 пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение не рассматривается как не соответствующее изобретательскому уровню из-за его кажущейся простоты и раскрытия в материалах заявки механизма достижения технического результата, если такое раскрытие стало известно не из уровня техники, а только из материалов заявки.

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.4 Правил ИЗ, если заявлена группа изобретений, проверка патентоспособности проводится в отношении каждого из входящих в нее изобретений. Патентоспособность группы может быть констатирована только тогда, когда патентоспособны все изобретения группы.

Согласно подпункту 8 пункта 19.5.4 Правил ИЗ, если заявленное изобретение, охарактеризованное в многозвенной формуле, содержащей зависимые пункты, признано соответствующим условию изобретательского

уровня в отношении независимого пункта, дальнейшая проверка в отношении зависимых пунктов формулы не проводится.

В соответствии с пунктом 22.3 Правил ИЗ при определении уровня техники общедоступными считаются сведения, содержащиеся в источнике информации, с которым любое лицо может ознакомиться само, либо о содержании которого ему может быть законным путем сообщено.

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. При описании группы изобретений сведения об аналогах приводятся для каждого изобретения в отдельности.

Согласно пункту 4.9 Правил ППС, при рассмотрении возражения против выдачи патента на изобретение коллегия палаты по патентным спорам вправе предложить патентообладателю внести изменения в формулу изобретения, если без указанных изменений оспариваемый патент должен быть признан недействительным полностью, а при их внесении - может быть признан недействительным частично.

Группе изобретений по оспариваемому патенту представлена правовая охрана в объеме признаков, содержащихся в независимых пунктах 1, 17, 19 формулы изобретения, приведенной выше.

Здесь целесообразно отметить, что изобретения по независимым пунктам 17 и 19 формулы по оспариваемому патенту относятся к объектам изобретения «способ», которые включают в себя использование таблетированной многоединичной лекарственной формы, охарактеризованной в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту.

Анализ доводов лица, подавшего возражение и доводов патентообладателя, касающихся оценки соответствия изобретения по

независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности "новизна", показал следующее.

Изобретение по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту охарактеризовано тремя совокупностями существенных признаков с использованием альтернативных признаков, касающихся содержания в таблетированной многоединичной форме активного вещества, выбранного из:

- из соединения ингибитора H^+K^+ АТФазы (альтернатива 1);
- одного его индивидуального энантиомера (альтернатива 2);
- щелочной соли омепразола (альтернатива 3).

Из патентного документа [1] известна таблетированная лекарственная форма, содержащая активное вещество, представляющее собой ингибитор H^+K^+ АТФазы, которым является омепразол (альтернатива 1), или щелочная соль омепразола (альтернатива 3). При этом индивидуально покрытые энтеросолюбильным слоем единицы материала ядра, содержащие активное вещество, необязательно смешанное со щелочными соединениями, смешаны с наполнителями таблетки и спрессованы в таблетки.

Отличием лекарственных форм, включающих альтернативы 1 и 3 от формы, известной из патентного документа [1], является признак «слой энтеросолюбильного покрытия имеет такие механические свойства, имеет такие механические свойства, что прессование отдельных единиц, смешанных с наполнителями в многоединичную лекарственную форму, не оказывает значительного влияния на кислотостойкость покрытых энтеросолюбильным слоем единиц».

Что касается лекарственной формы, включающей альтернативу 2, то такая лекарственная форма не описана в патентном документе [1].

Таким образом, в возражении не представлены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту (во всех альтернативных вариантах) несоответствующим условию патентоспособности "новизна".

Анализ доводов лица, подавшего возражение и доводов патентообладателя, касающихся оценки соответствия изобретения по независимому пункту 19 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности "новизна", показал следующее.

Данное изобретение представляет собой способ ингибирования секреции желудочной кислоты или лечения желудочно-кишечных заболеваний у млекопитающих и человека путём введения терапевтически эффективной дозы многоединичной таблетированной лекарственной формы по любому из пунктов 1-16 формулы по оспариваемому патенту.

При этом в патентном документе [1] отсутствуют сведения обо всех признаках лекарственной формы по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту (см. выше).

Таким образом, в возражении не представлены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 19 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности "новизна".

Анализ доводов лица, подавшего возражение и доводов патентообладателя, касающихся оценки соответствия изобретения по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности "изобретательский уровень", показал следующее.

Как уже говорилось выше, изобретение по оспариваемому патенту (в части альтернатив 1 и 3), отличается от ближайшего аналога, описанного в патентном документе тем, что слой энтеросолюбильного покрытия «...имеет такие механические свойства, что прессование отдельных единиц, смешанных с наполнителями в многоединичную лекарственную форму, не оказывает значительного влияния на кислотостойкость покрытых энтеросолюбильным слоем единиц».

Согласно описанию изобретения к оспариваемому патенту, данное отличие направлено на получение технического результата, заключающегося в хорошей химической и механической стабильности, снижении влияния процесса уплотнения (прессования) единичной таблетированной дозированной формы на

устойчивость к кислоте покрытых энтеросолюбильным покрытием шариков с активным веществом. То есть, при использовании лекарственной формы по оспариваемому патенту, содержащееся в ней активное вещество, предохраняется от деградации и растворения в кислых средах и имеет хорошую стабильность при долгосрочном хранении.

Однако, данные признаки с достижением указанного результата известны из статьи [2].

Таким образом, в возражении представлены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту (альтернативы 1 и 3) несоответствующим условию патентоспособности "изобретательский уровень".

При этом в возражении не представлено доводов об известности наличия ингибитора H^+K^+ АТФазы в составе лекарственной формы в виде одного индивидуального энантиомера (альтернатива 2).

Анализ доводов лица, подавшего возражение и доводов патентообладателя, касающихся оценки соответствия изобретения по независимому пункту 17 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности "изобретательский уровень", показал следующее.

Данное изобретение относится к способу получения таблетированной многоединичной лекарственной формы по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту и охарактеризовано определенной последовательностью приемов, необходимых для получения этой лекарственной формы (см. формулу изобретения).

В отношении данного изобретения в возражении приведен анализ только патентного документа [1].

При этом в патентном документе [1] отсутствуют сведения обо всех признаках лекарственной формы по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту (см. выше), а также о смешивании отдельных единиц материала ядра, содержащего активное вещество, с наполнителями именно после нанесения энтеросолюбильного покрытия и перед таблетированием.

В частности, в патентном документе [1] (стр. 20-22) приводится описание приготовления покрытых энтеросолюбильным слоем таблеток, спрессованной гранулированной смеси активного вещества, гранулы которой (пеллеты) не являются покрытыми. Согласно описанию данного документа [1] разделительный и энтеросолюбильный слой наносится на таблетку в целом, а не на составляющие ее гранулы. Так, в этом документе [1] содержатся следующие сведения: «Порошковая смесь была тщательно гомогенизирована и гранулирована в растворе. Влажная масса была высушена в сушилке с кипящим слоем с использованием притока воздуха с температурой 50⁰С в течение 30 минут. Затем высушенная смесь была пропущена через сито с отверстиями 0,5 мм. После смешивания со стеаратом магния гранулированная смесь была таблетирована на таблетированной машине...» (стр. 20, строки 33-37).

Однако стадии «смешивают с наполнителями и таблетировуют», необходимые для получения таблетированной многоединичной лекарственной формы по независимому пункту 17 формулы по оспариваемому патенту, характеризуют смешивание с наполнителями таблетки и прессование в таблетки не гранулированной смеси активного вещества, а последовательно покрытых разделительным и энтеросолюбильным слоем единиц, то есть совершенно иные стадии другого процесса, никак не связанного с получением моноединичной таблетки, описанной в патентном документе [1].

Таким образом, в возражении не представлены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 17 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности "изобретательский уровень".

Анализ доводов лица, подавшего возражение и доводов патентообладателя, касающихся оценки соответствия изобретения по независимому пункту 19 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности "изобретательский уровень", показал следующее.

В патентном документе [1] раскрыт способ применения таблетированной многоединичной лекарственной формы для лечения желудочно-кишечных

заболеваний путем ингибирования секреции желудочной кислоты, который рассматривается в качестве ближайшего аналога.

Согласно способу по оспариваемому патенту, лечение желудочно-кишечных заболеваний осуществляют путем введения терапевтически эффективной дозы многоединичной таблетированной лекарственной формы, охарактеризованной в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту. То есть, сама лекарственная форма представлена тремя альтернативными вариантами (см. выше). Однако, как уже показано выше, лекарственная форма, охарактеризованная альтернативными вариантами 1 и 3, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Таким образом, в возражении представлены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 19 формулы по оспариваемому патенту (в части альтернатив 1 и 3) несоответствующим условию патентоспособности "изобретательский уровень".

Материалы с Интернет-сайтов [5]-[7] не анализировались в связи с отсутствием документов, подтверждающих дату, с которой представленная в них информация стала общедоступной.

Коллегия палаты по патентным спорам в соответствии с пунктом 4.9 Правил ППС предложила патентообладателю уточнить формулу изобретения по оспариваемому патенту.

До даты заседания коллегии патентообладатель, в соответствии с пунктом 4.9 Правил ППС, представил уточненный вариант формулы изобретения, включив в независимый пункт 1 формулы признаки из зависимых пунктов 6 и 8.

Так, признак, касающийся толщины слоя энтеросолюбильного покрытия является существенным для лекарственной формы по оспариваемому патенту. Согласно описанию к оспариваемому патенту, выбор толщины энтеросолюбильного покрытия от 10 мкм необходим для защиты такого чувствительного к кислоте вещества лекарственной формы по оспариваемому патенту, как H^+K^+ АТФазы, а также для получения приемлемой кислотостойкости многоединичной таблетированной лекарственной формы. То есть, выбор

значения толщины энтеросолюбильного покрытия ниже 10 мкм не обеспечивает защиту активного вещества лекарственной формы от кислой среды желудка. При этом толщина покрытия 10 мкм и выше обуславливает способность индивидуально покрытых энтеросолюбильным слоем единиц ингибитора H^+K^+ АТФазы сохранять до 90% кислотоустойчивости после прессования в таблетку. Таким образом, выбор толщины энтеросолюбильного покрытия (от 10 мкм и выше) влияет на получение технических результатов, указанных в описании к оспариваемому патенту (хорошая химическая и механическая стабильность лекарственной формы, снижение влияния процесса уплотнения (прессования) единичной таблетированной дозированной формы на устойчивость к кислоте покрытых энтеросолюбильным покрытием шариков с активным веществом, предохранение активного вещества, содержащегося в лекарственной форме от его деградации и растворения в кислых средах).

Уточненная патентообладателем формула изобретения была принята коллегией палаты по патентным спорам к рассмотрению. Материалы заявки направлены для проведения дополнительного информационного поиска в соответствии с пунктом 5.1 Правил ППС.

До даты заседания проведения коллегии в палату по патентным спорам были представлены результаты указанного информационного поиска и заключение экспертизы.

В представленном отчете по результатам проведения дополнительного поиска не указано каких-либо известных технических решений, порочащих патентоспособность группы изобретений в рамках уточненной формулы.

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

удовлетворить возражение, поступившее 05.10.2012, патент Российской Федерации на изобретение № 2166935 признать недействительным частично и выдать новый патент Российской Федерации на изобретение с уточненной патентообладателем формулой.

(21) 96107040/14

(51)МПК

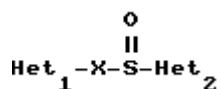
А 61 К 9/20, 31/4184;

А 61 Р 1/04

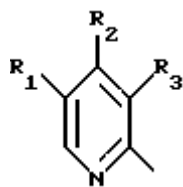
(57)

1. Таблетированная многоединичная лекарственная форма, содержащая активное вещество, выбранное из соединения ингибитора H^+K^+ АТФазы, одного его индивидуального энантиомера и его щелочной соли, отличающаяся тем, что индивидуально покрытые энтеросолюбильным слоем единицы материала ядра, содержащие активное вещество, необязательно смешанное со щелочными соединениями, смешано с наполнителями таблетки и спрессовано в таблетки, причем слой энтеросолюбильного покрытия имеет толщину по меньшей мере 10 мкм и имеет такие механические свойства, что прессование отдельных единиц, смешанных с наполнителями в многоединичную таблетированную лекарственную форму, не уменьшает кислотостойкость покрытых энтеросолюбильным слоем единиц более чем на 10%.

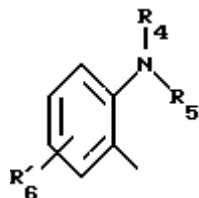
2. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что активным веществом является соединение общей формулы 1, или его щелочная соль, или один из его энантиомеров, или его щелочная соль



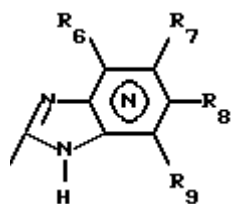
где Het_1 представляет собой



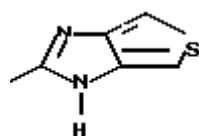
или



Het₂ представляет собой

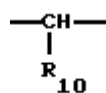


или

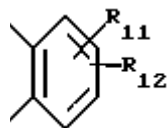


или

X обозначает



или



где N в бензимидазольном остатке молекулы обозначает, что один из атомов углерода, замещенных R₆-R₉, необязательно заменен атомом азота без каких-либо заместителей;

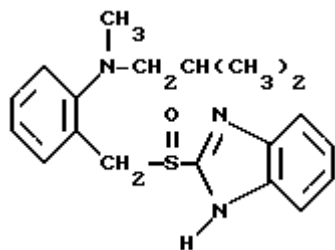
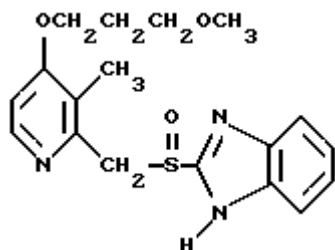
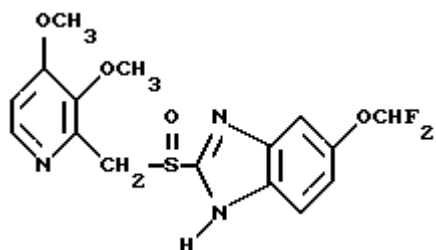
R₁, R₂ и R₃ - одинаковы или различны и выбраны из водорода, алкила, алкоксигруппы, необязательно замещенных фтором, алкилтио-, алкоксиалкокси-, диалкиламино-, пиперидино-, морфолиногруппой, галогеном, фенилом и фенилалкоксигруппой;

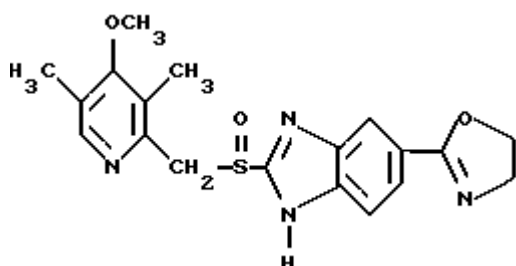
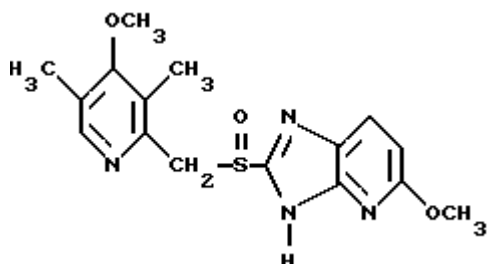
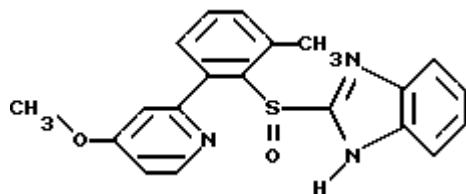
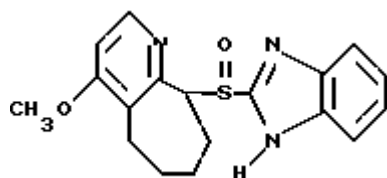
R_4 и R_5 - одинаковы или различны и выбраны из водорода, алкила и аралкила;
 R'_6 представляет собой водород, галоген, трифторметил, алкил и алкоксигруппу;

R_6 - R_9 - одинаковы или различны и выбраны из водорода, алкила, алкоксигруппы, галогена, галогеналкоксигруппы, алкилкарбонила, алкоксикарбонила, оксазолила, трифторалкила или смежные группы R_6 - R_9 образуют кольцевые структуры, которые могут быть дополнительно замещенными;

R_{10} представляет собой водород или образует вместе с R_3 алкиленовую цепь;
 R_{11} и R_{12} - одинаковы или различны и выбраны из водорода, галогена или алкила, за исключением соединений 5-метокси-2-[[[(4-метокси-3,5-диметил-2-пиридирил)метил] сульфинил] -1H-бензимидазола, 5-фтор-2-[[[(4-циклопропилметокси-2-пиридирил)метил] сульфинил] -1H-бензимидазола и 5-карбометокси-6-метил-2-[[[(3,4-диметокси-2-пиридирил)метил] сульфинил]-1H-бензимидазола, или их одиночных энантиомеров, или их щелочных солей.

3. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что активным веществом является одно из следующих соединений:





или его щелочная соль, или один из его энантиомеров, или его щелочная соль.

4. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что кислотостойкость отдельно покрытых энтеросолюбильным слоем единиц соответствует требованиям, предъявляемым к покрытым энтеросолюбильным слоем изделиям, определенным в United States Pharmacopeia.

5. Таблетированная лекарственная форма по п.4, отличающаяся тем, что имеет твердость по Викерсу менее 8.

6. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что слой энтеросолюбильного покрытия содержит пластификатор.

7. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что отдельно покрытые энтеросолюбильным слоем единицы дополнительно покрыты защитным слоем, содержащим фармацевтически приемлемые наполнители.

8. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что является разделяемой.

9. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что она является диспергируемой в водном растворе с образованием суспензии отдельно покрытых энтеросолюбильным слоем единиц, содержащих активное вещество.

10. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что разделяющий слой расположен под энтеросолюбильным слоем.

11. Таблетированная лекарственная форма по п.12, отличающаяся тем, что разделяющий слой содержит фармацевтически приемлемые наполнители, которые растворимы или нерастворимы, но дезинтегрируются в воде и необязательно являются щелочными соединениями.

12. Таблетированная лекарственная форма по п.1, отличающаяся тем, что материал ядра представляет собой включение, прослоенное активным веществом.

13. Таблетированная лекарственная форма по п.12, отличающаяся тем, что включения имеют размер 0,1 - 2 мм.

14. Таблетированная лекарственная форма по пп. 1 - 15 как ингибитор секреции желудочной кислоты или средство лечения желудочно-кишечных воспалительных заболеваний у млекопитающих и человека.

15. Способ получения таблетированной многоединичной лекарственной формы по п. 1, согласно которому единицы материала, содержащие активное вещество, смешивают, в случае необходимости, со щелочными соединениями, затем могут быть покрыты разделяющими слоями, наносят энтеросолюбильное покрытие, смешивают с наполнителями и таблетуют.

16. Способ по п.17, отличающийся тем, что отдельно покрытые энтеросолюбильным слоем единицы активного вещества дополнительно покрывают защитным слоем перед прессованием.

17. Способ ингибирования секреции желудочной кислоты или лечения желудочно-кишечных заболеваний у млекопитающих и человека путем введения терапевтически эффективной дозы многоединичной таблетированной лекарственной формы по любому из пп.1 - 16.