

ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам рассмотрения
☒ **возражения** ☐ **заявления**

Коллегия 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 В.Б.Лисовенко (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее 27.12.2013, против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2381026, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2381026 на группу изобретений "Фармацевтические композиции, содержащие микофенольную кислоту или ее соль (микофенолят)" с конвенционным приоритетом от 17.10.2001 выдан по заявке № 2007130786/15 на имя НОВАРТИС АГ (далее – патентообладатель) со следующей формулой изобретения:

«1. Твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием, содержащая фармакологически эффективное количество микофенольной кислоты или микофенолята и фармацевтически приемлемые добавки, где микофенольная кислота или микофенолят присутствуют практически в безводной форме в количестве от приблизительно 20 до приблизительно 95% в пересчете на общую массу твердой дозированной лекарственной формы, включая энтеросолюбильное покрытие.

2. Твердая дозированная лекарственная форма по п.1, представляющая собой гранулу.

3. Твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием по п.1, представляющая собой таблетку, где таблетка дополнительно

содержит фармацевтически приемлемые добавки, пригодные для изготовления таблеток с помощью методов прессования, причем микофенольная кислота или микофенолят присутствуют в количестве от приблизительно 20 до приблизительно 90 мас.% в пересчете на общую массу таблетки, включая энтеросолюбильное покрытие.

4. Твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием по любому из пп.1-3, содержащая натриймикофенолят в кристаллической форме.

5. Твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием по любому из пп.1-3, содержащая микофенольную кислоту или кристаллический мононатриймикофенолят, по существу, в безводной форме.

6. Твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием по любому из пп.1-3, где микофенольная кислота или микофенолят присутствуют в количестве от приблизительно 45 до приблизительно 80 мас.% в пересчете на общую массу твердой лекарственной формы, включая энтеросолюбильное покрытие.

7. Твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием по любому из пп.1-3, где микофенольная кислота или микофенолят присутствуют в количестве от приблизительно 50 до приблизительно 65 мас.% в пересчете на общую массу твердой лекарственной формы, включая энтеросолюбильное покрытие.

8. Способ получения таблетки по одному из пп.3-7, отличающийся тем, что (I) смешивают микофенольную кислоту или микофенолят практически в безводной форме и фармацевтически приемлемые добавки, (II) смесь, полученную на стадии (I), подвергают грануляции, (III) спрессовывают смесь со стадии (I) или гранулы, полученные на стадии (II), и фармацевтически приемлемые добавки с получением таблетки, и (IV) наносят энтеросолюбильное покрытие на микофенольную кислоту или микофенолят, смесь со стадии (I) и/или на гранулы, полученные на стадии (II),

и/или на таблетки, полученные на стадии (III), при этом стадия (II) не является обязательной.

9. Таблетка для подавления иммунной системы, полученная посредством стадий (I)-(IV) способа по п.8, где стадия (II) не является обязательной.

10. Таблетка по п.3 или 9, где фармацевтически приемлемые добавки выбраны из одного или нескольких наполнителей, одного или нескольких разрыхлителей, одного или нескольких связующих веществ, одного или нескольких веществ, улучшающих скольжение, и/или одного или нескольких замасливателей.

11. Применение твердой дозированной лекарственной формы с энтеросолюбильным покрытием по любому из пп.1-7, гранулы по п.2 или таблетки по п.3 или 9 в качестве иммунодепрессанта, прежде всего для предупреждения или лечения отторжения трансплантата нативного или трансгенного органа, ткани или клеточного аллотрансплантата, для лечения или предупреждения опосредуемого иммунной системой и/или воспалительного заболевания, необязательно в сочетании с одновременным, последовательным или раздельным введением другого иммунодепрессанта.

12. Применение по п.11, при котором твердую дозированную лекарственную форму с энтеросолюбильным покрытием, гранулу или таблетку вводят в сочетании с другим иммунодепрессантом, выбранным из группы, включающей циклоспорины, аскомицины или их аналоги, обладающие иммунодепрессантной активностью, рапамицин или его производные, агент хоминга лимфоцитов, кортикостероиды, циклофосфамид, азатиоприн, метотрексат, бреквинар, лефлуномид, мизорибин, 15-дезоксиспергуалин, обладающие иммунодепрессантной активностью моноклональные антитела, их лиганды и другие обладающие иммуномодуляторной активностью соединения.

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса было подано возражение, мотивированное несоответствием группы изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1, 8, 9, 11 формулы по

оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В возражении приведены следующие источники информации:

- патентный документ US 6025391 (далее [1]);
- патентный документ US 4786637 (далее [2]);
- патентный документ US 3880995 (далее [3]);
- Muthiowitz Edith, Controlled Drug Delivery, Vol.2, John Wiley & Sons. Inc., N.Y. page 732, 1999, с переводом на русский язык (далее [4]);
- R. Schmouder et al., "Pharmacokinetics of ERL080A: a new enteric coated formulation of mycophenolic acid-sodium"; Abstract of the 18th Annual Meeting of the American Society of Transplantation (AST), May 15-19, 1999, Chicago, Illinois с переводом на русский язык (далее [5]);
- патентный документ GB 1157100 (далее [6]);
- патентный документ GB 1203328 (далее [7]);
- Libermann et. al., Pharmaceutical Dosage Forms -Tablets, Vol. 1, 2nd Ed., Marcel Dekker Inc. NY. Page 106-107, 1989 с переводом на русский язык релевантных частей (далее [8]);
- патентный документ WO 9412184 A1 (далее [9]);
- учебник Технология лекарственных форм в 2 томах по ред. Л.А. Ивановой, Москва, «Медицина», 1991 (далее [10]);
- P.H. List, Arzneiformenlehre Wissenschaftliche Verlags Gesellschaft 1985 с переводом на русский язык (далее [11]);
- Scurman et al., Toxicology 157, 2001, 207-215 с переводом на русский язык (далее [12]);
- Wie Zhu et al, "Cyclosporine is associated with decreased absolute bioavailability of mycophenolic acid", устный доклад, Чикаго, Май 2001 с переводом на русский язык (далее [13]);
- I.Bjarnason, Enteric coating of mycophenolate sodium: a rational approach to limit topical gastrointestinal lesions and extend the therapeutic of mycophenolate, 2001, Elsevier Science Inc с переводом на русский язык (далее [14]);

-D.K. Granger, Enteric coated mycophenolate sodium: results of two pivotal global multicenter trials, 2001 Elsevier Science Inc с переводом на русский язык (далее [15]);

-M. Salvadori, Therapeutic equivalence of mycophenyl sodium versus mycophenyl mofetil in de novo renal transplant recipients, 2001 Elsevier Science Inc с переводом на русский язык (далее [16]);

-патентный документ ZA 68/4,959 (далее [17]);

-патентный документ WO 9426266 (далее [18]);

-патентный документ EP 1768969 A2 (далее [19]).

Доводы лица, подавшего возражение, сводятся к следующему.

Изобретение по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту с очевидностью для специалиста следует из уровня техники с учетом ближайшего аналога, раскрытого в патентном документе [1] и сведений о количественных признака, характеризующих содержание в композиции микофенольной кислоты или микофенолята и известных из источников информации [1], [2], [5], [6], [8],[12] – [16],

При этом относительно признака «безводная форма» лицо, подавшее возражение, обращает внимание на то, что в патентном документе [1] говорится о возможности присутствия микофенолята натрия либо в кристаллической форме, образованной из перекристаллизации из ацетона, этанола, либо в жидкой форме. Из этого лицо, подавшее возражение, делает вывод, что в патентном документе [1] показана возможность наличия микофенольной кислоты или микофенолята в композиции как в безводной форме, так и с наличием воды.

Относительно объекта изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 8 формулы по оспариваемому патенту «Способ получения таблетки...», лицо, подавшее возражение, предлагает в качестве ближайшего аналога способ получения таблетки, раскрытый в патентном документе [6]. При этом нанесение энтеросолюбильного покрытия, отличающее данное изобретение по оспариваемому патенту от ближайшего аналога [6], известно из патентного

документа [1]. По мнению лица, подавшего возражение, в патентном документе [1] показано, что нанесение энтеросолюбильного покрытия обеспечивает улучшенную стабильность, биодоступность и снижает побочные эффекты.

Относительно объекта изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 11 формулы по оспариваемому патенту «Применение твердой дозированной лекарственной формы...» лицо, подавшее возражение, обращает внимание на то, что возможность воздействия активного компонента микофенольной кислоты и её соли на патологические состояния являются хорошо известными из источников информации [1], [5], [12]-[16].

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

Патентообладатель представил 14.11.2014 отзыв по мотивам возражения, где отметил, в частности, следующее.

При создании изобретения по оспариваемому патенту было установлено, что микофенольную кислоту или микофенолят более предпочтительно применять в безводной форме.

Патентообладатель указывает, что, несмотря на высокое содержание микофенольной кислоты или микофенолята, таблетка по оспариваемому патенту содержит лишь незначительное количество добавок и обладает достаточной механической прочностью.

По мнению патентообладателя, несмотря на высокую лекарственную нагрузку (45-80% от всей массы таблетки), заявленная дозированная форма остаётся приемлемой по размеру и удобна для приёма пациентом.

В своём отзыве на возражение патентообладатель частично согласился с доводами лица, подавшего возражение, и указал, что «с учётом возражений, выдвинутых Оппонентом, и в частности для их преодоления, Патентообладатель просит ... предоставить ему возможность ограничить формулу изобретения...».

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

С учетом даты международной подачи заявки (16.10.2002), 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 Роспатентом 17.04.1998 №82 и зарегистрированные в Министерстве юстиции Российской Федерации 22.09.1998 № 1612 с изменениями и дополнениями, внесенными приказами Роспатента от 08.07.1999 №133, от 13.11.2000 №2223 (далее – Правила ИЗ), и Правила ППС.

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 19.5.3 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 3 пункта 19.5.3 Правил ИЗ не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные, в частности: на создании средства, состоящего из известных частей, выбор которых и связь между которыми осуществлены на основании

известных правил, рекомендаций и достигаемый при этом технический результат обусловлен только известными свойствами частей этого средства и связей между ними;

Согласно подпункту 7 пункта 19.5.3 Правил ИЗ 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 подпункту 3 пункта 19.5.4 Правил ИЗ если заявлена группа изобретений, проверка патентоспособности проводится в отношении каждого из входящих в нее изобретений. Патентоспособность группы может быть констатирована только тогда, когда патентоспособны все изобретения группы.

В соответствии с пунктом 1 пункта 22.3 Правил ИЗ при определении уровня техники общедоступными считаются сведения, содержащиеся в источнике информации, с которым любое лицо может ознакомиться само, либо о содержании которого ему может быть законным путем сообщено. Датой, определяющей включение источника информации в уровень техники, является для опубликованных описаний к охранным документам - указанная на них дата опубликования.

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, 8, 9, 11 формулы изобретения, приведенной выше.

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.

В независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту предложена твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием, содержащая фармакологически эффективное количество микофенольной кислоты или микофенолята и фармацевтически приемлемые добавки, где микофенольная кислота или микофенолят присутствуют практически в безводной форме в количестве от приблизительно 20 до приблизительно 95% в пересчете на общую массу твердой дозированной лекарственной формы, включая энтеросолюбильное покрытие.

В качестве технического результата от использования изобретения по оспариваемому патенту указано, что «таблетки, предлагаемые в изобретении...удобны для применения... обладают стабильностью, например, при хранении, эффективностью и хорошей переносимостью» (стр. 5, посл. абзац), а также «ценными характеристиками биологической доступности» (стр. 4, абз. 4). При этом не определено, какие именно признаки лекарственной формы по оспариваемому патенту влияют на достижение технического результата.

В описании к оспариваемому патенту описаны средства и способы, с помощью которых такое покрытие «энтеросолюбильное» может быть изготовлено и нанесено (стр. 7-9). Согласно описанию к оспариваемому патенту, дозированная форма может представлять собой таблетки, гранулы и др. (стр.9).

Твердая лекарственная форма по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту содержит микофенольную кислоту (МФК) или микофенолят. При этом, согласно описанию к оспариваемому патенту, в качестве микофенолята (то есть, соли микофенольной кислоты), используют натриймикофенолят (стр. 19, примеры 3,4).

Из патентного документа [1] известна твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием (стр. 2. абз.4 перевода), содержащая фармакологически эффективное количество микофенольной кислоты или микофенолята (стр. 7, пример 1, перевод) и фармацевтически

приемлемые добавки (стр. 2, абз. 5), где микофенолят присутствуют в количестве приблизительно 16% (стр. 7, пример1) в пересчете на общую массу твердой дозированной лекарственной формы, включая энтеросолюбильное покрытие.

Данное средство рассматривается в качестве ближайшего аналога.

В отношении количества микофенолята можно отметить следующее.

Согласно независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту твердая дозированная лекарственная форма содержит микофенольную кислоту или микофенолят в количестве «от приблизительно 20 до приблизительно 95%» в пересчете на общую массу твердой дозированной лекарственной формы, включая энтеросолюбильное покрытие.

При этом, в документе [1] (пример 1) показано, что количество микофенолята натрия в лекарственной форме составляет 53,43 мг. Так, с учетом общей массы ингредиентов, содержащихся в капсуле (314,65 мг) и массы энтеросолюбильного покрытия (17мг), процентное содержание натриймикофенолята в капсуле по примеру 1 составляет: $53,43 / (314,65 + 17) * 100\% = 16,1\%$ или в пересчете на микофенольную кислоту $50 / 331,65 = 15,1\%$. Исходя из расчета с учетом массы пустой капсулы, масса желатиновой капсулы «размера 1» составляет от 71,0 - 81,0 мг, то есть. в среднем 76 мг (см. S1, S2). При этом количество натрий микофенолята в известной из документа [1] (пример 1) композиции составляет: $53,43 / (314,65 + 17 + 76) * 100\% = 13,1\%$ от массы капсулы, или в расчете на микофенольную кислоту $50 / 407,65 * 100\% = 12,3\%$.

Кроме того, необходимо подчеркнуть, что в патентном документе [1] описан способ получения мононатриймикофенолята путем перекристаллизации в смеси ацето/этанол, где температура плавления мононатриймикофенолята составляет 189-191 С. Точно такой же способ получения указан в описании к оспариваемому патенту (стр. 6). Таким образом в композиции по патентному документу [1] микофенольная кислота или микофенолят присутствуют практически в безводной форме.

Отличием изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту от известного из документа [1] ближайшего аналога, является количество микофенолята «от 20 до приблизительно 95 мас. %»).

В патентном документе [2] описаны фармацевтические композиции, содержащие микофенолят в количестве 67% (стр.13, пример 6). Так, приведены примеры композиций для перорального введения, содержащие 66,7% ($400/(400+145+5+50)*100\%$) активного соединения (пример 6). Также указано, что композиции могут представлять собой различные твердые дозированные формы (таблетки, капсулы, гранулы, порошки и др.) (стр. 9, абз. 5).

Таким образом, можно констатировать, что в возражении приведены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Анализ доводов лица, подавшего возражение и доводов патентообладателя, касающихся оценки соответствия изобретения по независимому пункту 8 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности "изобретательский уровень", показал следующее.

Из патентного документа [6] известен способ получения таблеток, включающий: смешивание микофенольной кислоты и фармацевтически приемлемые добавки; грануляцию смеси, полученной на стадии (I); и спрессовывание гранул, полученных на стадии (II), получают таблетки (стр. 3, пример). Данный способ рассматривается в качестве ближайшего аналога. О том, что спрессовывают смесь для получения таблетки известно из документа [6] (стр. 3, пример).

Отличительным признаком изобретения, охарактеризованного в независимом пункте 9 формулы по оспариваемому патенту, является стадия нанесения энтеросолюбильного покрытия и использование на стадии 1 практически безводной формы микофенольной кислоты.

Из патентного документа [1] известна возможность нанесения энтеросолнубильного покрытия на композицию (стр. 2, абз.3-6), и использование в композиции микофенолята в практически безводной форме (стр. 2, абз.1).

Из патентного документа [1] также известно, что указанное энтеросолнубильное покрытие наносят для обеспечения улучшенной стабильности, биодоступности и снижения побочных эффектов композиции, содержащей микофенольную кислоту или ее соль (пример 1, стр. 5-7).

Таким образом, можно констатировать, что в возражении приведены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 8 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Анализ доводов лица, подавшего возражение и доводов патентообладателя, касающихся оценки соответствия изобретения по независимому пункту 9 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности "изобретательский уровень", показал следующее.

Изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 9 формулы по оспариваемому патенту представляет собой таблетку, полученную с помощью стадий (I)-(IV), где стадия (II) не является обязательной. Данные стадии указаны в независимом пункте 9 формулы по оспариваемому патенту, которые, проанализированы выше.

При этом таблетка для подавления иммунной системы известна из патентного документа [1] (стр. 4, абз. 2).

Таким образом, можно констатировать, что в возражении приведены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 9 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

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

независимому пункту 11 формулы по оспариваемому патенту условию патентоспособности "изобретательский уровень", показал следующее.

Применение по независимому пункту 11 формулы по оспариваемому патенту включает признаки независимого пункта 1 формулы по оспариваемому патенту, проанализированного выше.

Из патентного документа [1] известна возможность использования лекарственных форм, содержащих указанные активные компоненты (микофенолят) для предупреждения или лечения отторжения трансплантата нативного или трансгенного органа, ткани или клеточного аллотрансплантата, для лечения или предупреждения опосредуемого иммунной системой и/или воспалительного заболевания, необязательно в сочетании с одновременным, последовательным или раздельным введением другого иммунодепрессанта (стр. 4, абз. 6, 7).

Таким образом, можно констатировать, что в возражении приведены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 11 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

На заседании коллегии патентообладателю было предоставлено право откорректировать формулу изобретения, согласно пункту 4.9 Правил ППС

Патентообладатель обратился с просьбой принять к рассмотрению приобщенную к отзыву формулу изобретения, уточненную с учетом приведенных в возражении доводов, в следующей редакции:

«1. Твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием, содержащая фармакологически эффективное количество микофенолята и фармацевтически приемлемые добавки, содержащая натриймикофенолят в кристаллической, практически безводной форме в количестве от приблизительно 45 до приблизительно 80% в пересчете на общую массу твердой дозированной лекарственной формы, включая энтеросолюбильное покрытие, представляющая собой таблетку, где таблетка

дополнительно содержит фармацевтически приемлемые добавки, пригодные для изготовления таблеток с помощью методов прессования.

2. Твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием по п.1, содержащая кристаллический натриймикофенолят, по существу, в безводной форме.

3. Способ получения таблетки по одному из пп.1-2, отличающийся тем, что (I) смешивают микрофенолят практически в безводной форме и фармацевтически приемлемые добавки, (II) смесь, полученную на стадии (I), подвергают грануляции, (III) спрессовывают смесь со стадии (I) или гранулы, полученные на стадии (II), и фармацевтически приемлемые добавки с получением таблетки, и (IV) наносят энтеросолюбильное покрытие на микрофенолят, смесь со стадии (I) и/или на гранулы, полученные на стадии (II), и/или на таблетки, полученные на стадии (III), при этом стадия (II) не является обязательной.

4. Таблетка для подавления иммунной системы, полученная посредством стадий (I)-(IV) способа по п.3, где стадия (II) не является обязательной.

5. Таблетка по п.1 или 4, где фармацевтически приемлемые добавки выбраны из одного или нескольких наполнителей, одного или нескольких разрыхлителей, одного или нескольких связующих веществ, одного или нескольких веществ, улучшающих скольжение, и/или одного или нескольких замасливателей.

6. Применение твердой дозированной лекарственной формы с энтеросолюбильным покрытием по любому из пп.1-2, или таблетки по п.4 в качестве иммунодепрессанта, прежде всего для предупреждения или лечения отторжения трансплантата нативного или трансгенного органа, ткани или клеточного аллотрансплантата, для лечения или предупреждения опосредуемого иммунной системой и/или воспалительного заболевания, необязательно в сочетании с одновременным, последовательным или раздельным введением другого иммунодепрессанта.

7. Применение по п.6, при котором твердую дозированную лекарственную форму с энтеросолюбильным покрытием, гранулу или таблетку вводят в сочетании с другим иммунодепрессантом, выбранным из группы, включающей циклоспорины, аскомицины или их аналоги, обладающие иммунодепрессантной активностью, рапамицин или его производные, агент хоминга лимфоцитов, кортикостероиды, циклофосфамид, азатиоприн, метотрексат, бреквинар, лефлуномид, мизорибин, 15-дезоксиспергуалин, обладающие иммунодепрессантной активностью моноклональные антитела, их лиганды и другие обладающие иммуномодуляторной активностью соединения».

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

До даты заседания коллегии были представлены результаты указанного информационного поиска и заключение экспертизы (далее – заключение).

В представленном отчете по результатам проведения дополнительного поиска указаны известные технические решения, порочащие патентоспособность группы изобретений в рамках уточненной формулы/

Согласно заключению, группа изобретений, охарактеризованных в уточненной формуле, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», исходя из сведений, представленных в следующих источниках информации:

- патентный документ [1] (реферат, формула, колонка 1 (1,2 абзацы снизу), колонка 2 (1,3 абзацы сверху), колонка 3 (строки 29-32) (далее – [1]);
- учебник [10], стр.134-142 (далее – [10]);
- учебник Чуешов В.И. Промышленная технология лекарств. Т.2. – Х.:МТК-Книга, Издательство НФАУ, 2002.-716с., стр.330-334. (далее – [20]);
- патентный документ [6] ,пример 1, формула, реферат (далее – [6]);
- патентный документ [2], реферат, формула, пример 6 (далее – [2]);
- патентный документ [7], Пример 1, формула, реферат (далее – [7]).

Приведенные в заключении доводы были рассмотрены на заседании коллегии.

При этом было установлено следующее.

В патентном документе [1] раскрыта твердая дозированная лекарственная форма с энтеросолюбильным покрытием, содержащая фармакологически эффективное количество микофенолята и фармацевтически приемлемые добавки, содержащая натриймикофенолят в кристаллической, практически безводной форме, представляющая собой таблетку, где таблетка дополнительно содержит фармацевтически приемлемые добавки.

Данная композиция является стабильной при хранении, то есть, позволяет достичь тот же технический результат, что и от использования средства по оспариваемому патенту.

Отличием твердой дозированной лекарственной формы по независимому пункту 1 уточненной формулы является количественный признак: количество от приблизительно 45 до приблизительно 80% в пересчёте на общую массу твёрдой дозированной лекарственной формы, включая энтеросолюбильное покрытие, а также изготовление таблетки путём прессования.

Следует отметить, что признак «приблизительно» не даёт чётких границ объёма притязаний, остаётся неясным, какие количественные показатели следует считать относящимися к «приблизительно 45», а какие не являются приближёнными к 45.

При этом из патентного документа [2] известно содержание производных микофенольной кислоты в фармацевтической композиции в количестве, входящем в диапазон по независимому пункту 1 формулы уточненной формулы (примеры 5, 6).

Изготовление таблеток путём прессования является широко известным методом, в том числе, прессование также известно из патентного документа [2] (пример 6).

Таким образом, твердая дозированная лекарственная форма по независимому пункту 1 уточненной формулы является дополнением известной

композиции (содержащей микофенолят натрия, имеющей энтеросолюбильное покрытие) известным количественным признаком, при этом технический результат достигается в ближайшем аналоге, получение какого-либо неочевидного технического результата из-за использования отличительного количественного признака не подтверждено.

Таким образом, можно констатировать, что в заключении приведены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В отношении объекта, охарактеризованного в независимом пункте 3 уточненной формулы необходимо отметить следующее.

Ближайшим аналогом является способ получения таблетки, раскрытый в патентном документе [6] (пример 1). Согласно раскрытому в этом документе [6] способу, смешивают микофенольную кислоту и фармацевтически приемлемые добавки, спрессовывают смесь и фармацевтически приемлемые добавки с получением таблетки.

Отличием способа по независимому пункту 3 уточненной формулы является использование для получения таблетки микофенолята в практически безводной форме и нанесение энтеросолюбильного покрытия, что обеспечивает стабильность композиции.

Такие действия при осуществлении способа получения таблетки с достижением такого технического результата известны из патентного документа [1].

На основании изложенного, изобретение по независимому пункту 3 уточненной формулы является дополнением известного способа (смешивание и спрессовывание с получением таблетки) известными частями (микофенолят в практически безводной форме, нанесение энтеросолюбильного покрытия, что способствует увеличению стабильности композиции).

Таким образом, можно констатировать, что в заключении приведены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 3

формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В отношении объекта, охарактеризованного в независимом пункте 4 уточненной формулы необходимо отметить следующее.

Объектом изобретения по независимому пункту 4 уточненной формулы является таблетка, полученная способом по пункту 3, где стадия (II), то есть грануляция, не является обязательной.

Такой способ получения таблетки, как было показано выше, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Таким образом, можно констатировать, что в заключении приведены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 4 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В отношении объекта, охарактеризованного в независимом пункте 6 уточненной формулы необходимо отметить следующее.

Назначением изобретения по независимому пункту 6 уточненной формулы является применение твердой дозированной лекарственной формы с энтеросолюбильным покрытием по пунктам 1-2, или таблетки по пункту 4 в качестве иммунодепрессанта, далее перечисляется список патологических состояний, при которых указанные лекарственные формы применяются.

Применение лекарственной формы с энтеросолюбильным покрытием и таблетки, содержащий в качестве активного вещества натриймикофенолят, для лечения указанные в пункте 6 уточненной формулы патологических состояний известно из патентного документа [1].

Таким образом, можно констатировать, что в заключении приведены доводы, позволяющие признать изобретение по независимому пункту 6 формулы по оспариваемому патенту несоответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В корреспонденциях, поступивших от патентообладателя 19.05.2016 и 06.07.2016 указывается что в патентном документе [1] отсутствуют сведения о

том, что кристаллический микофенолят натрия может быть безводным. По мнению патентообладателя, при перекристаллизации в присутствии воды безводная форма активного вещества не может быть получена, а документ [1], как и уровень техники в целом, не дает никаких оснований для возможного вывода об идентичности признака безводные кристаллы МФК-натрия по оспариваемому патенту признаку, известному из патентного документа [1].

В ответ на это целесообразно отметить следующее.

В описании к оспариваемому патенту отсутствуют какие-либо другие особые способы получения безводной формы активного вещества. Указан только один способ (стр. 5, 6 описания), который известен из патентного документа [1]. То есть, в патентном документе [1] раскрыт точно такой же способ получения кристаллической формы моонатриймикофенолята как и в описании к оспариваемому патенту. При этом, как в описании к оспариваемому патенту, так и в патентном документе [1] указано, что в способе может быть «при необходимости» добавлена вода. То есть, перекристаллизация может быть проведена как с использованием воды, так и без нее, а способ перекристаллизации может происходить из смеси ацетон/этанол без использования воды в качестве растворителя. Таким образом, получение безводной формы активного вещества из растворителей, не включающих воду, описывается в обоих документах (в описании к оспариваемому патенту и в документе [1]).

Как указывалось выше, в документе [1] описан точно такой же способ получения кристаллических солей микофенолята, как и в описании к оспариваемому патенту (стр.5-6 описания). Осуществление одних и тех же операций способа перекристаллизации в присутствии одинакового сочетания растворителей позволяет утверждать, что лекарственные средства, полученные одинаковым способом, характеризуются одинаковыми свойствами. В частности, это утверждение подтверждает и наличие идентичного интервала температуры плавления (189-191°C) индивидуального вещества (как указано в патентном документе [1] и в описании к оспариваемому патенту). При этом, как известно

из курса органической химии (Птицина О.А. и др. Лабораторные работы по органическому синтезу. М.:Просвещение, 1979, стр.53), идентичность интервала плавления индивидуальных веществ свидетельствует об одинаковом составе полученного вещества. Таким образом, «безводная форма» кристаллического мономикофенолята известен из патентного документа [1].

Патентообладатель также обращает внимание на то, что в ни в патентном документе [1], ни в других документах [2]-19] не содержалось никаких указаний на то, что микофенольная соль может находиться в безводной форме и не выявлено источников, раскрывающих безводные формы МФК, и монопартитовой соли МФК до даты приоритета изобретения по оспариваемому патенту.

С данным мнением нельзя согласиться, поскольку из патентного документа [1] известен точно такой же способ получения кристаллического мононатриймикофенолята, как и в оспариваемом патенте. В патентном документе [1], как и в описании к оспариваемому патенту указан выбор одних и тех же растворителей (ацетон/этанол) без использования воды. При этом получается одно и то же вещество. Далее, согласно сведениям из патентного документа [17] (пример 3) показана возможность получения безводной формы мононатриймикофенолята.

Далее, в представленных корреспонденциях патентообладатель указывает на то, что для нанесения энтеросолюбильного покрытия используют органические растворители, например, этиловый спирт, ацетон и их смеси, которые могут содержать определенное количество воды, то есть не могут быть в полной мере отнесены к неводным растворителям.

Однако, общеизвестно (см., например учебник Крешков А.П. Аналитическая химия неводных растворов. М.:Химия, 1982. стр.10-14), что неводные растворители могут содержать воду. Например, нефть является неводным раствором, хотя она и может содержать примеси воды. При этом, на стр.10 описания к оспариваемому патенту указано, что при нанесении энтеросолюбильного покрытия из воды возникают проблемы, поэтому

предпочтительнее использовать «неводное покрытие, например, на основе органических соединений».

Следует отметить, что как в патентном документе [1] (колонка 3 6-7, абз.), так и в оспариваемом патенте (стр.10 описания) указаны предпочтительные растворители для энтеросолюбильного покрытия: этанол, ацетон, смесь этанол/ацетон в соотношении от 1:1 до 10:1. При этом указанная смесь этанола и ацетона используется во всех примерах получения лекарственных форм изобретений по патентному документу [1] и в описании к оспариваемому патенту.

Таким образом, признак независимого пункта 1 формулы по оспариваемому патенту «неводный растворитель» полностью раскрыт и описан в патентном документе [1].

В особом мнении указывается, что добавки, присутствующие в ядре капсулы по патентному документу [1] не позволяют использовать состав для получения таблеток МФК-натрия с заданными в изобретении по оспариваемому патенту характеристиками и включают: наполнитель, глидант, лубрикант. Из сказанного следует, что в числе перечисленных добавок ядра твердой дозированной формы по патентному документу [1] отсутствуют такие компоненты, как связующее и разрыхлитель, приведенные в качестве необходимых в описании и примерах к оспариваемому патенту, и, обеспечивающих возможности гранулирования и прессования смеси по оспариваемому патенту.

Здесь необходимо отметить, что в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту используется признак «добавки, пригодные для изготовления таблеток с помощью методов прессования». При этом в независимом пункте 1 формулы по оспариваемому патенту отсутствуют какие-либо конкретные группы вспомогательных веществ, пригодных для прессования (например, связующее или разрыхлитель). То есть, если в способе по патентному документу [1] получают таблетку (2 колонка 1 абз.), то она уже содержит

необходимые вспомогательные вещества для ее прессования (при том сказано, что получают таблетки, пеллеты, гранулы общепринятыми способами).

Патентообладатель указывает, что для препарата Майфортик, полученного согласно примеру 1 и 2 оспариваемого патента, срок годности составляет 2,5 года, что подтверждает заявленный технический результат – стабильность при хранении для всей совокупности существенных признаков по независимому пункту 1 формулы по оспариваемому патенту (в частности, для безводной формы кристаллического мононатриймикофенолята).

Однако, нельзя согласиться с данным мнением, поскольку, согласно приведенной инструкции, в препарате Майфортик используется, также как и в примере 1-2 к оспариваемому патенту микофенолят натрия (без указания какой-либо особой формы, например безводной и кристаллической формы). Таким образом, приведенный аргумент патентообладателя не позволяет судить о возможности достижения технического результат для безводных кристаллических форм мононатриймикофенолята.

В корреспонденции от 06.07.2016 патентообладатель указывает на доказательство новизны и изобретательского уровня изобретений уточненной формулы. В частности, патентообладатель говорит, что ни в одном из цитированных документов уровня техники [1]-[19] не раскрыта заявленная таблетка, характеризующаяся сочетанием признаков независимых пунктов 1 и 4, а также способ ее получения и применения согласно независимым пунктам 3,6 формулы по оспариваемому патенту.

Однако, нельзя согласиться с данным мнением, поскольку из документов [1], [17] известен признак «безводной формы» активного начала, в документах [1], [2] известно высокое содержание активного начала в таблетке, в документах [1] и [19] раскрыт признак, относящийся к добавкам, пригодным для прессования таблеток.

По мнению патентообладателя, в уровне техники не раскрыт способ, обеспечивающий возможность получения заявленной таблетки, поскольку способы документов уровня техники не обеспечивают возможность получения

заявленной таблетки по независимым пунктам 1, 4 формулы по оспариваемому патенту.

Однако, как указано в учебниках [10], [19] и в патентных документах [2] и [6] способ получения таблетки по независимому пункту 3 уточненной формулы является общеизвестным и традиционно используется для получения таблеток, на что обращалось внимание выше.

По мнению патентообладателя, ни один из документов [1]-[19] «не дает специалисту указаний, на основании которых мог бы быть осуществлен выбор направления исследований или раскрыта мотивация для получения заявленных таблеток».

Однако, сведения из документа [1] позволяют мотивировать специалиста на выбор безводной формы активного начала, а также на комбинирование указанного начала с различными общепринятыми вспомогательными веществами и, таким образом, на создание необходимой лекарственной формы.

Что касается мнения патентообладателя о том, что в источниках информации [1]-[19] не раскрыта безводная кристаллическая форма мононатриймикофенолята, использованная для получения таблеток по оспариваемому патенту, то данные доводы проанализированы и отражены в настоящем заключении выше.

Патентообладатель подчеркивает, что изобретение по оспариваемому патенту представляет собой таблетку, характеризующуюся сочетанием новой и неочевидной комбинации свойств, стабильностью при хранении, высоким содержанием активного начала, прочностью и удобным размером, что не является очевидным для твердых дозированных форм МФК, по сравнению с известными из источников информации [1]-[19] техническими решениями.

Однако, как уже отмечалось выше, все указанные свойства показаны в описании к оспариваемому патенту только для кристаллической формы мононатриймикофенолята, причем некоторые из них носят исключительно декларативный характер, не подкрепленный примерами конкретного выполнения. Все объекты, согласно уточненной формуле, относятся к безводной

форме кристаллического мононариймикофенолята. При этом, как в примерах конкретного выполнения, так и в описании к оспариваемому патенту не продемонстрированы указанные выше свойства именно для этой формы. Отсутствие таких сведений не служит доказательством указанного патентообладателем утверждения о достижении технических результатов.

Патентообладатель утверждает, что признаки, характеризующие изобретения по независимым пунктам 1,3,4,6 уточненной формулы придают им полезные качества и существенные преимущества перед известными из источников информации [1]-[19] решениями.

Однако, как уже отмечалось выше, в описании к оспариваемому патенту указанные полезные качества (технические результаты) только задекларированы. При этом в примерах конкретного выполнения таблеток по оспариваемому патенту отсутствуют какие-либо сведения, свидетельствующие о наличии этих качеств у безводной формы кристаллического мононатриймикофенолята (см. доводы выше).

Патентообладатель считает, что из рассмотрения был исключён признак «практически безводная форма» и рассматривался только признак «безводная форма».

Относительно данного довода патентообладателя следует отметить, что в источнике информации [1] показана возможность получения, как безводной формы, так и формы с наличием жидкости, о чем уже было сказано выше.

В отношении признака «практически» следует отметить следующее.

Употребив в формуле изобретения термин «практически», заявитель не дал чёткой трактовки объёма своих притязаний. Признак «практически безводная форма» можно трактовать как «полностью безводная» или, как «почти безводная».

Таким образом, в заключении приведены доводы и сведения, которые свидетельствуют о том, что изобретения, охарактеризованные в уточненной формуле, с очевидностью для специалиста следуют из уровня техники.

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

удовлетворить возражение, поступившее 27.12.2013, патент Российской Федерации на изобретение № 2381026 признать недействительным полностью.