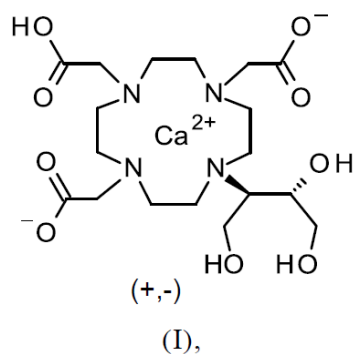


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии палаты по патентным спорам
по результатам рассмотрения ☒ возражения ☐ заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01.01.2008 Федеральным законом от 18.12.2006 № 231-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации и отдельные законодательные акты Российской Федерации» (далее-Кодекс), и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденными приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020 № 644/261, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020 № 59454 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение компании Байер Фарма Акциенгезельшафт, DE (далее – заявитель), поступившее 26.08.2022, на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее Роспатент) от 11.03.2022 об отказе в выдаче патента Российской Федерации на изобретение по заявке № 2019111919, при этом установлено следующее.

Заявлена группа изобретений «Способ получения кристаллической формы модификации А калкобутарола», охарактеризованная в формуле, представленной в корреспонденции от 13.01.2022, в следующей редакции:

«1. Соединение формулы (I) в кристаллической форме модификации А



которое отличается тем, что оно представляет собой моногидрат с 2.0 - 2.2 мас.% этанола и что диаграмма рентгеновской порошковой дифрактометрии соединения показывает максимум пика угла 2θ при 7.6° , 9.1° , 11.1° , 11.3° , 11.9° и 12.3° .

2. Способ получения соединения формулы (I) по п. 1, который отличается тем, что подвергают разложению гадолиниевый комплекс дигидрокси-гидрокси-метилпропил-тетраазациклододекан-триуксусной кислоты (гадобутрол), осажденную соль гадолиния удаляют, затем раствор с свободными лигандами связывают с кислотной ионообменной смолой, затем элюируют водным основным раствором, затем связывают в комплекс с ионами кальция²⁺, затем стехиометрию Ca:бутрол доводят до 1:1, затем осуществляют кристаллизацию из водного этанола при содержании воды 9 - 11 мас.% и затем продукт сушат и, таким образом, выделяют соединение формулы (I) по п. 1.

3. Способ получения соединения формулы (I) по п. 1, который отличается тем, что гадолиниевый комплекс дигидрокси-гидрокси-метилпропил-тетраазациклододекан-триуксусной кислоты (гадобутрол) подвергают разложению щавелевой кислотой в воде при нагревании, осажденный оксалат гадолиния отфильтровывают, затем свободный лиганд связывают с кислотной ионообменной смолой, затем элюируют водным раствором аммиака, и связывают в комплекс с ионами кальция²⁺ после концентрирования раствора, затем стехиометрию Ca:бутрол доводят до 1:1, затем его нагревают с обратным холодильником из водного этанола при содержании воды 9 - 11 мас.% воды, затем охлаждают, после его выделения сушат, и таким образом выделяют соединение формулы (I) по п. 1.

4. Способ получения соединения формулы (I) по п. 2 5 или п. 3, который отличается тем, что для комплексообразования применяют карбонат кальция.

5. Способ получения соединения формулы (I) по п. 2, 3 или 4, который отличается тем, что для комплексообразования применяют карбонат кальция и что комплексообразование проводят в температурном диапазоне $\geq 20^{\circ}\text{C}$ и $\leq 25^{\circ}\text{C}$.

6. Соединение формулы (I) в кристаллической форме модификации А имеющее структуру по п.1, полученное одним из способов по любому из пп. 2-5.

7. Соединение формулы (I) по п. 6, которое получено с чистотой 99.7%».

По результатам проведения экспертизы по существу Роспатентом было принято решение об отказе в выдаче патента ввиду несоответствия изобретений, заявленных в независимых пунктах 1 и 6 формулы, условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В подтверждение данного мнения в решении указаны следующие источники информации:

- патентный документ WO 2011054827 A1, дата публикации 12.05.2011 (далее - [1]);

- статья (Mino R. Caira, «Cristalline Polimorfism of organic compounds», TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY, 1998, vol.198, p.163-208 (далее - [2]);

- статья Sherry L.Morissette et al. High-throughput crystallization: polymorphs, salts, co-crystals and solvates of pharmaceutical solids, Advanced drug Delivery Reviews, 2004, v.56, pp.275-300, (section 1) (далее – [3]);

- патентный документ ЕА 10198 В1, дата публикации 30.06.2008 (далее [4]).

Данное решение мотивировано тем, что изобретения, охарактеризованные в независимых пунктах 1 и 6 (зависимый пункт 7) формулы, представленной в корреспонденции от 13.01.2022, не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку для специалиста явным образом следуют из уровня техники [1]-[3].

Так, в решении Роспатента отмечено, что из патентного документа [1] известна кристаллическая форма калькобутрола, используемая в качестве добавки в композициях контрастного вещества гадобутрола.

Предложенная кристаллическая модификация А соединения формулы (I) (калькобутрола) отличается от известной из патентного документа [1] характеристическими пиками порошковой рентгенограммы.

Технический результат предложенного изобретения заключается в получении новой кристаллической формы соединения формулы (I), обладающей улучшенной гигроскопичностью.

При этом в решении Роспатента отмечено, что для специалиста в данной области техники создание кристаллической формы соединения (I) модификации А с улучшенной гигроскопичностью с целью использования ее по указанному назначению явным образом следует из уровня техники [1]-[3].

Вместе с тем, в решении Роспатента отмечено, что способы получения кристаллической модификации А соединения формулы (I) (калькобутрола) (независимые пункты 2 и 3 формулы) соответствуют всем условиям патентоспособности.

Дополнительно в решении Роспатента указано, что пункт 7 не может являться зависимым от пункта 6 формулы, поскольку признаки, характеризующие, что соединение формулы (I) получено с чистотой 99.7%, изучаются после получения формы вещества. При этом, из патентного документа [4] (пункт 2 формулы изобретения) известно, что чистота и содержание кристаллической формы в продукте может составлять не менее 99%. Между тем согласно родовому понятию независимого пункта 6 формулы, от которого зависит пункт 7, заявлено конкретное соединение в кристаллической форме, а не продукт его содержащий.

На решение об отказе в выдаче патента на группу изобретений в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса поступило возражение, суть доводов которого сводится к следующему.

Заявитель не согласен с выводом, сделанным в решении Роспатента о том, что изобретения по независимым пунктам 1 и 6 формулы не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» (доводы в возражении не приведены), однако принял решение ограничить формулу изобретения независимыми пунктами 2 и 3, которые были признаны в решении патентоспособными, а также связанными с ними зависимыми пунктами.

Измененная формула, приложенная к возражению, содержит два независимых пункта 1 и 2 (ранее пункты 2 и 3) и зависимые от них пункты 3-4 (ранее пункты 4-5) формулы.

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

С учетом даты подачи заявки (11.09.2017) правовая база для оценки патентоспособности включает Кодекс, Правила составления, подачи и рассмотрения документов, являющихся основанием для совершения юридически значимых действий по государственной регистрации изобретений, и их формы (далее – Правила ИЗ), утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 № 42800, Требования к документам заявки на выдачу патента на изобретение (далее – Требования ИЗ), утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 № 42800.

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

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

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

Согласно пункту 4 статьи 1350 Кодекса изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении, других отраслях экономики или в социальной сфере.

Согласно пункту 75 Правил ИЗ при проверке изобретательского уровня изобретение признается имеющим изобретательский уровень, если установлено, что оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

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

- определение наиболее близкого аналога изобретения;
- выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);
- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками заявленного изобретения;
- анализ уровня техники в целях подтверждения известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на указанный заявителем технический результат.

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

- на выборе оптимальных или рабочих значений параметров, если подтверждена известность влияния этих параметров на технический результат, а выбор может быть осуществлен обычным методом проб и ошибок или применением обычных технологических методов или методов конструирования.

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

Согласно подпункту 2 пункта 53 Требований ИЗ формула изобретения

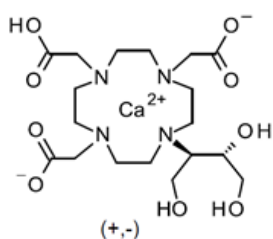
должна быть полностью основана на описании изобретения, то есть определяемый формулой изобретения объем правовой охраны изобретения должен быть подтвержден описанием изобретения.

Согласно пункту 39 Правил ППС в рамках рассмотрения возражения лицо, подавшее возражение, вправе ходатайствовать об изменении испрашиваемого объема правовой охраны изобретения, при условии, если испрашиваемые изменения могут устранить причины, препятствующие предоставлению правовой охраны заявленному объекту, либо в случае, если без внесения соответствующих изменений в предоставлении правовой охраны должно быть отказано в полном объеме, а при их внесении – частично.

Существо заявленного изобретения выражено в приведенной выше формуле.

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

Действительно, как отмечено в решении Роспатента, из уровня техники, в частности, из патентного документа [1] (3 абзац с.8, пример 2, формула изобретения) известна полиморфная форма калькобутрола, т.е. соединения формулы



, полученная кристаллизацией из этанола, используемая в качестве добавки в композициях контрастного вещества гадобутрола.

При этом предложенная кристаллическая модификация А соединения формулы (I) (калькобутрола) по независимым пунктам 1 и 6 вышеприведенной формулы отличается от известной из патентного документа

[1] характеристическими пиками порошковой рентгенограммы (см. пункт 1 формулы, фиг. 6 описания предложенного изобретения).

Вместе с тем известно, что большинство веществ при исследовании выявляет более одного полиморфа, т.е. имеет несколько кристаллических модификаций, отличающихся друг от друга характеристическими пиками порошковой рентгенограммы (см. например, статью [2] с. 165-166). Кроме того, методы скрининга полиморфов хорошо известны в данной области (см. статью [2] Section 3.1).

Технический результат предложенного изобретения заключается в получении новой кристаллической формы соединения формулы (I), обладающей улучшенной гигроскопичностью (см. с. 5 описания).

Однако из статей [2] (с. 164, 165 последний абзац, 177-179) и [3] (section 1, с. 277) известно, что получение кристаллической формы вещества ведется именно по причине модифицирования его физико-химических характеристик, т.е. такие формы соединений как кристаллы получают именно с целью улучшить, в том числе, такое свойство как гигроскопичность.

При этом общеизвестно, что получение кристаллических форм соединения является обычным методом проб и ошибок (см. статью [2] с. 164, 177-179).

Таким образом, для специалиста в данной области техники создание предложенной кристаллической формы соединения (I) (калькобутрола) модификации А с улучшенной гигроскопичностью с целью использования по указанному назначению явным образом следует из уровня техники [1]-[3].

Поэтому имеющиеся в материалах заявки данные не могут быть признаны неожиданным техническим результатом для кристаллической формы А соединения по независимым пунктам 1 и 6 формулы группы изобретений.

Таким образом, специалисту в данной области очевидны возможности изменения тех или иных физических или физико-химических свойств соединения для их улучшения, а также известны общие методики,

применяемые для создания тех или иных необходимых физических свойств у известного вещества. Соответственно, на основании общих знаний в области органической кристаллохимии путем рутинных процедур по подбору параметров (условий, режимов) получения кристаллической формы можно подобрать такие условия, при которых будут получены кристаллические формы с улучшенными свойствами.

Исходя из вышеизложенного, следует согласиться с мнением, изложенным в решении Роспатента, о том, что изобретения по независимым пунктам 1 и 6 формулы группы изобретений не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку для специалиста явным образом следуют из уровня техники [1]-[3] (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

Также следует согласиться с доводом, изложенным в решении Роспатента о том, что пункт 7 не может являться зависимым от пункта 6 формулы, поскольку характеризует чистоту продукта, в котором содержится калькобутрол, при том, что независимый пункт 6 описывает не продукт содержащий калькобутрол, а соединение формулы (I).

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

Что касается изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 2 и 3 формулы (зависимые пункты 4-5), то в отношении них в решении Роспатента указано, что данные изобретения соответствуют условиям патентоспособности «промышленная применимость» (пункт 4 статьи 1350 Кодекса) и условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень» (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

Вместе с тем в соответствии с пунктом 39 Правил ППС в рамках рассмотрения данного возражения заявителем вместе с материалами возражения представлено ходатайство об изменении испрашиваемого объема правовой охраны изобретения, путем исключения независимых пунктов 1 и 6, а также пункта 7 из формулы группы изобретений.

Таким образом, необходимо констатировать, что не выявлено препятствий для выдачи патента Российской Федерации на изобретение, охарактеризованное в представленной заявителем 26.08.2022, уточненной формуле изобретения.

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

удовлетворить возражение, поступившее 26.08.2022, отменить решение Роспатента от 11.03.2022, выдать патент Российской Федерации с формулой изобретения, представленной 26.08.2022.

(21) 2019111919

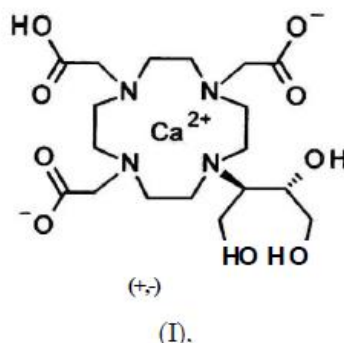
(51) МПК

C07D 257/02 (2006.01)

A61K 49/10 (2006.01)

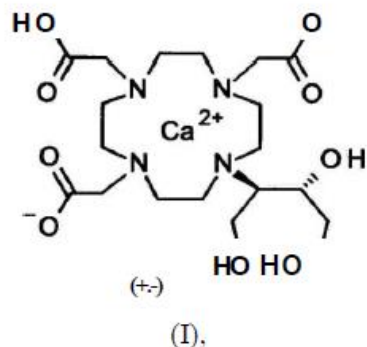
(57)

«1. Способ получения соединения формулы (I) в кристаллической форме модификации А



которое отличается тем, что оно представляет собой моногидрат с 2.0 - 2.2 мас.% этанола и что диаграмма рентгеновской порошковой дифрактометрии соединения показывает максимум пика угла 2θ при 7.6° , 9.1° , 11.1° , 11.3° , 11.9° и 12.3° , который отличается тем, что подвергают разложению гадолиниевый комплекс дигидрокси-гидрокси-метилпропил-тетраазациклододекан-триуксусной кислоты (гадобутрол), осажденную соль гадолиния удаляют, затем раствор с свободными лигандами связывают с кислотной ионообменной смолой, затем элюируют водным основным раствором, затем связывают в комплекс с ионами кальция²⁺, затем стехиометрию Ca:бутрол доводят до 1:1, затем осуществляют кристаллизацию из водного этанола при содержании воды 9-11 мас.% и затем продукт сушат и, таким образом, выделяют соединение формулы (I).

2. Способ получения соединения формулы (I) в кристаллической форме модификации А



которое отличается тем, что оно представляет собой моногидрат с 2.0 - 2.2 мас.% этанола и что диаграмма рентгеновской порошковой дифрактометрии соединения показывает максимум пика угла 2θ при 7.6° , 9.1° , 11.1° , 11.3° , 11.9° и 12.3° , который отличается тем, что гадолиниевый комплекс дигидрокси-гидрокси-метилпропил-тетраазациклододекан-триуксусной кислоты (гадобутрол) подвергают разложению щавелевой кислотой в воде при нагревании, осажденный оксалат гадолиния отфильтровывают, затем свободный лиганд связывают с кислотной ионообменной смолой, затем элюируют водным раствором аммиака, и связывают в комплекс с ионами кальция²⁺ после концентрирования раствора, затем стехиометрию Ca:бутрол доводят до 1:1, затем его нагревают с обратным холодильником из водного этанола при содержании воды 9-11 мас.% воды, затем охлаждают, после его выделения сушат, и таким образом выделяют соединение формулы (I).

3. Способ получения соединения формулы (I) по п. 1 или п. 2, который отличается тем, что для комплексообразования применяют карбонат кальция.

4. Способ получения соединения формулы (I) по п. 1, 2 или 3, который отличается тем, что для комплексообразования применяют карбонат кальция и что комплексообразование проводят в температурном диапазоне $> 20^\circ\text{C}$ и $< 25^\circ\text{C}$.

(56) WO 2011054827 A1, 12.05.2011

RU 2003120513 A, 27.12.2004

Mino R.Caira, Crystalline Polymorphism of Organic Compounds,
1998, p.163-208

Sherry L.Morissette et al. High-throughput crystallization:
polymorphs, salts, co-crystals and solvates of pharmaceutical
solids, Advanced drug Delivery Reviews, 2004, v.56, pp.275-300,
(section 1)

EA 10198 B1, 30.06.2008