

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 1 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 231-ФЗ, в редакции, действующей на дату подачи возражения 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 г. № 644/261, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020 № 59454, с изменениями, внесенными приказом Минобрнауки России и Минэкономразвития России от 23.11.2022 № 1140/646 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение Общества с ограниченной ответственностью «ГЕРОФАРМ» (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее 28.01.2025, против действия на территории Российской Федерации евразийского патента на изобретение ЕА № 015287, при этом установлено следующее.

Евразийский патент ЕА № 015287 на группу изобретений «1-[2-(2,4-ДИМЕТИЛФЕНИЛСУЛЬФАНИЛ)ФЕНИЛ]ПИПЕРАЗИН В КАЧЕСТВЕ СОЕДИНЕНИЯ С СОЧЕТАНИЕМ АКТИВНОСТИ В ОТНОШЕНИИ ПОВТОРНОГО ЗАХВАТА СЕРОТОНИНА, 5-НТЗ И 5-НТ1А ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ КОГНИТИВНОГО НАРУШЕНИЯ», выдан по заявке ЕА № 200970018 на имя Х. ЛУНДБЕКК А/С (ДК) (далее – патентообладатель) с приоритетами от 16.06.2006, 22.09.2006, 25.10.2006, 20.03.2007,

установленными по заявкам № РА 2006 00824, РА 2006 01223, РА 2006 01384, РА 2007 00427, поданным в Патентное ведомство Дании.

Дата подачи установлена по дате подачи международной заявки РСТ/DK2007/050075 от 15.06.2007.

Патент действует со следующей формулой:

1. 1-[2-(2,4-Диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазин и его фармацевтически приемлемые соли, причем соединение является кристаллическим.

2. Соединение по п.1, представляющее собой соль бромистоводородной кислоты, хлористоводородной кислоты, мезилатную соль, соль фумаровой кислоты, малеиновой кислоты, мезовиннокаменной кислоты, L-(+)-винно-каменной кислоты, D-(-)-винно-каменной кислоты, сульфат, фосфат или нитрат.

3. Соединение по п.2, имеющее порошковую рентгенограмму (XRPD), как показано на любой из фиг. 1-17.

4. Соединение по п.1, которое представляет собой соль 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазина с бромистоводородной кислотой в кристаллической форме.

5. Соединение по п.4, имеющее отражения XRPD приблизительно при 6,89, 9,73, 13,78 и 14,64 (°2θ).

6. Соединение по п.4, имеющее XRPD, как показано на фиг. 3.

7. Соединение по п.5, имеющее распределение размера частиц, соответствующее:

D98%: 650-680 мкм; D50%: 230-250 мкм; D5%: 40-60 мкм;

D98%: 370-390 мкм; D50%: 100-120 мкм; D5%: 5-15 мкм;

D98%: 100-125 мкм; D50%: 15-25 мкм; D5%: 1-3 мкм или

D98%: 50-70 мкм; D50%: 3-7 мкм; D5%: 0,5-2 мкм.

8. Применение соединения по любому из пп.1-7 в терапии.

9. Фармацевтическая композиция для лечения когнитивного нарушения, содержащая соединение по любому из пп.1-7 совместно с фармацевтически приемлемым эксципиентом.

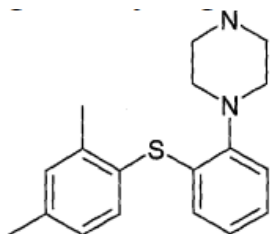
10. Композиция по п.9, содержащая соединение по п.4 или 5.

11. Способ лечения заболевания, выбранного из аффективных нарушений, депрессии, общего депрессивного нарушения, послеродовой депрессии, депрессии, ассоциированной с биполярным нарушением, болезни Альцгеймера, психоза, злокачественной опухоли, связанного со старением заболевания или болезни Паркинсона, тревожности, общего тревожного нарушения, социального тревожного нарушения, обсессивно-компульсивного нарушения, панического нарушения, панических атак, фобии, социальной фобии, агорафобии, недержания мочи при напряжении, рвоты, IBS, нарушений питания, хронической боли, частичного ответа, лечения устойчивой депрессии, когнитивного нарушения, ADHD, меланхолии, PTSD, приливов, апноэ во сне, пристрастия к алкоголю, никотину или углеводам, злоупотребления психоактивными веществами и алкоголем или зависимости от алкоголя или лекарственных средств, включающий введение терапевтически эффективного количества соединения по любому из пп.1-7 пациенту, нуждающемуся в этом.

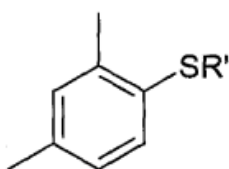
12. Применение соединения по любому из пп.1-7 для получения лекарственного средства для лечения аффективных нарушений, депрессии, общего депрессивного нарушения, послеродовой депрессии, депрессии, ассоциированной с биполярным нарушением, болезни Альцгеймера, психоза, злокачественной опухоли, связанного со старением заболевания или болезни Паркинсона, тревожности, общего тревожного нарушения, социального тревожного нарушения, обсессивно-компульсивного нарушения, панического нарушения, панических атак, фобии, социальной фобии, агорафобии, недержания мочи при напряжении, рвоты, IBS, нарушений питания, хронической боли, частичного ответа, лечения устойчивой

депрессии, когнитивного нарушения, ADHD, меланхолии, PTSD, приливов, апноэ во сне, пристрастия к алкоголю, никотину или углеводам, злоупотребления психоактивными веществами и алкоголем или зависимости от алкоголя или лекарственных средств.

13. Способ получения 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазина

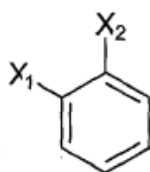


включающий реакцию соединения II



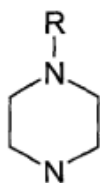
[II]

где R' представляет собой водород или одновалентный ион металла, с соединением формулы III



[III]

где X1 и X2 независимо представляют собой галоген, и с соединением формулы IV

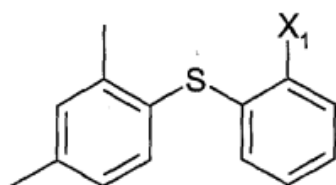


[IV]

где R представляет собой водород или защитную группу,

в присутствии растворителя, основания и палладиевого катализатора, состоящего из соединения палладия и фосфинового лиганда при температуре между 60 и 130°C.

14. Способ по п.13, где соединение II и соединение III подвергают реакции с образованием соединения формулы



которое необязательно выделяют и очищают, с последующей его реакцией с соединением IV.

15. Способ по п.13, где соединение II, соединение III и соединение IV смешивают вместе в начале процесса.

16. Способ по любому из пп.13-15, где X_1 и X_2 независимо представляют собой Br или I.

17. Способ по любому из пп.13-16, где соединение палладия выбрано из $Pd(PPh_3)_4$, $Pd(OAc)_2$ и Pd_2dba_3 .

18. Способ по любому из пп.13-17, где указанный фосфиновый лиганд выбран из

2,2'-бис-дифенилфосфанил-[1,1']бинафталенила (rac-BINAP);

1,1'-бис-(дифенилфосфино)ферроцена (DPPF);

бис-(2-дифенилфосфинофенил)эфира (DPEphos);

три-трет-бутилфосфина (соли Fu);

бифенил-2-ил-ди-трет-бутилфосфина;

бифенил-2-ил-дициклогексилфосфина;

(2'-дициклогексилфосфанилбифенил-2-ил)диметиламина;

[2'-(ди-трет-бутилфосфанил)бифенил-2-ил]диметиламина и

дициклогексил-(2',4',6'-трипропилбифенил-2-ил)фосфана.

19. Способ по любому из пп.13-18, где указанное основание выбрано из NaO(t-Bu), KO(t-Bu), Cs₂CO₃, DBU и DABCO.

20. Способ по любому из пп.13-19, где R представляет собой водород.

21. Способ по любому из пп.13-20, где R' представляет собой водород.

22. Способ по п.15, где 2-5 экв. NaO(t-Bu), 2-5 экв. пиперазина, 0,2-0,6 мол.% Pd(dba)₂ и 0,6-1 мол.% гас-BINAP диспергируют в толуоле с получением смеси A', к этой смеси добавляют приблизительно 1 экв. 2-бромйодбензола с получением смеси B', затем добавляют 1 экв. 2,4-диметилтиофенола и полученную смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 3-7 ч с получением 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазина.

23. Способ по п.22, где указанную полученную смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 4-6 ч, затем полученный продукт подвергают реакции с водной HBr с получением соответствующей аддитивной соли бромисто-водородной кислоты.

24. Способ получения аддитивной соли 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазина с бромисто-водородной кислотой, при котором 2-5 экв. NaO(t-Bu), 2-5 экв. пиперазина, 0,2-0,6 мол.% Pd(dba)₂ и 0,6-1 мол.% гас-BINAP диспергируют в толуоле с получением смеси A', к этой смеси добавляют приблизительно 1 экв. 2-бромйодбензола с получением смеси B', затем к этой смеси добавляют 1 экв. 2,4-диметилтиофенола и полученную смесь нагревают до температуры кипения с обратным холодильником в течение 4-6 ч с получением 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазина, который далее подвергают реакции с водной бромисто-водородной кислотой.

Против действия на территории Российской Федерации евразийского патента ЕА № 015287 в соответствии с пунктом 1 статьи 13 Евразийской Патентной Конвенции от 09.09.1994, ратифицированной Российской Федерацией Федеральным законом от 01.06.1995 № 85-ФЗ и вступившей в

силу для Российской Федерации с 27.09.1995 (далее – Конвенция), и пункта 1 Правила 54 Патентной инструкции к Евразийской патентной конвенции, утверждённой Административным советом Евразийской патентной организации на втором (первом очередном) заседании 01.12.1995 с изменениями и дополнениями, утвержденными на девятнадцатом (четырнадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 13-15 ноября 2007 г., двадцать первом (шестом внеочередном) заседании Административного совета ЕАПО 30-31 марта 2009 г., двадцать третьем (семнадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 8-10 ноября 2010 г., двадцать шестом (девятнадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 20-22 ноября 2012 г., двадцать седьмом (двадцатом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 6-8 ноября 2013 г., двадцать восьмом (двадцать первом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 11-13 ноября 2014 г., тридцать вторым (двадцать третьем очередном) заседании Административного совета ЕАПО 1-3 ноября 2016 г., тридцать третьем (двадцать четвертом очередном) заседании 6-7 сентября 2017 г., тридцать четвертом (двадцать пятом очередном) заседании 22 – 23 октября 2018 г., тридцать шестом (двадцать седьмом очередном) заседании 10 – 11 сентября 2020 г. (далее – действующая Патентная инструкция), тридцать шестом (двадцать седьмом очередном) заседании 10 – 11 сентября 2020 г., тридцать седьмом (десятым внеочередном) заседании 12 апреля 2021 г., сороковым (двенадцатым внеочередном) заседании 11 – 12 апреля 2022 г., сорок первым (двадцать девятым очередном) заседании 20 – 21 сентября 2022 г., сорок третьем (тридцатым очередном) заседании 5 – 7 декабря 2023 г., сорок пятым (тридцать первым очередном) заседании 9 - 10 сентября 2024 г. поступило возражение, мотивированное несоответствием группы изобретений по независимым пунктам 1-12 формулы условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень».

Группа изобретений по пунктам 13-24 формулы не оспаривается.

К возражению, кроме копии оспариваемого патента, приложены копии следующих материалов:

- евразийская заявка ЕА200400498, дата публикации 26.08.2004 (далее – [1]);

- документ Elena Boldyreva, Vladimir Boldyrev. Reactivity of Molecular Solids. John Wiley & Sons Ltd, 1999, Chapter 7, Pages 241-242 (далее – [2]);

- документ M. Bavin. Chemistry & Industry, 1989, 21, 527-529 (далее – [3]);

- документ S. Byrn et al., Pharmaceutical Research, 1995, 12(7), 945-954 (далее – [4]);

- документ B.C. Hancock et al., Pharmaceutical Research 1995, 12(6), 799-805 (далее – [5]);

- документ R. Brent, EYP 2006 conference presentation, Session 5 (14 May 2006) (далее – [6]);

- URL:

<https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compound/Vortioxetine#section=IUPAC>

- Name&fullscreen=true (далее – [7]);

- документ ICH Harmonized Tripartite Guideline dated 6 October 1999 (далее – [8]);

- документ G.S. Banker, C.T. Rhodes; Modern Pharmaceutics; Fourth Edition, 2002, Pages 172-174 (далее – [9]);

- документ L. Huang et al, Advanced Drug Delivery Reviews, 2004, 56, 321-334 (далее – [10]).

Суть доводов возражения в отношении несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» сводится к следующему.

По мнению лица, подавшего возражение, изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента не соответствует

условию патентоспособности «новизна», поскольку соединение «вортиоксетин» раскрыто в описании заявки [1] (с.6 строки 3-5 и 10).

Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, признак «соединение является кристаллическим», характеризующий вортиоксетин в формуле оспариваемого патента, а также признак «его фармацевтически приемлемые соли» также известны из заявки [1] (с.9 , строки 8-13): «Дополнительно, соединения изобретения могут существовать как в несольватированных, так и в сольватированных формах с фармацевтически приемлемыми растворителями, такими как вода, этанол и подобные. Как правило, сольватированные формы рассматриваются эквивалентными несольватированным формам для целей данного изобретения».

По мнению лица, подавшего возражение, сольватная форма - это всего лишь одна из кристаллических форм соответствующего соединения, что, по мнению лица, подавшего возражение, общеизвестно, и описано, например, в документе [2] (с.2 строки 15-18). Также на фигуре 7.1 «Твердотельные формы фармацевтических агентов» в документе [2] (с. 3) однозначно изображено, что сольваты - кристаллические формы фармацевтических субстанций.

При этом в возражении отмечено, что в описании к оспариваемому патенту (с.3 строки 8-12 и 14-15) приведено аналогичное определение термина «сольваты».

Также аналогичная информация содержится в фармакопейных статьях РФ и ЕАЭС (ОФС.1.1.0017 и ЕАЭС, 2.3.4.0).

Вместе с тем в примерах 4g и 4h описания к оспариваемому патенту приведен пример сольватной формы вортиоксетина с фармацевтически приемлемым растворителем водой (т.е. гидрат).

Кроме того, в отношении признака «соединение является кристаллическим», в возражении отмечено, что в заявке [1] также раскрыт процесс производства вортиоксетина (см. пример 1, соединение 1e), который

включает очистку соединения 1e методом препаративной ЖХ/МС и последующей ионообменной хроматографией.

Вместе с тем, в возражении отмечено, что в примерах 4g и 4h описания к оспариваемому патенту приведен пример сольватной формы вортиоксетина с фармацевтически приемлемым растворителем водой (т.е. гидрат), который охарактеризован как гемигидрат гидробромида вортиоксетина.

Также в возражении отмечено, что в заявке [1] (пример 1e с. 22 строки 16-18) уже был раскрыт способ получения кристаллического вортиоксетина.

Так, в возражении раскрыто, что согласно строкам 5-6 на с. 22 описания заявки [1] вортиоксетин (т.е. соединение 1e на с. 22, строка 16) получали аналогично соединению 1a (1-[2-(2-трифторметилфенилсульфанил)-фенил]пиперазин). Способ получения соединения 1a, описанный в примере 1 описания заявки [1], раскрыт в достаточной мере для адаптирования его специалистом к способу получения соединения 1e (вортиоксетина). Далее в возражении на основании примеров приведены доводы о том, как может быть получен кристаллический вортиоксетин согласно заявке [1].

Кроме того, отмечено, что в заявке [1] описаны соединения, которые являются ингибиторами обратного захвата серотонина, предназначенные для лечения аффективных расстройств, таких как депрессия, тревожные расстройства, включая общее тревожное расстройство, паническое расстройство и обсессивно-компульсивное расстройство (с.2 строки 27-31 D1), а также фармацевтические композиции, содержащие указанные соединения или их фармацевтически приемлемые аддитивные соли с кислотами и по меньшей мере один фармацевтически приемлемый носитель или разбавитель (с.5, строки 10-14).

В возражении сделан вывод о том, что изобретения по независимым пунктам 8, 9 и 11 формулы оспариваемого патента также не являются новыми с учетом отсутствия новизны у изобретения по пункту 1.

Доводы в отношении независимого пункта 12 в возражении не приведены.

Суть доводов возражения в отношении несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» сводится к следующему.

В возражении указано, что техническое решение, раскрытое в заявке [1] является ближайшим аналогом к изобретениям по оспариваемому патенту, поскольку относится к той же технической области техники и раскрывает соединение вортиоксетин и его фармацевтически приемлемые кислотно-аддитивные соли (например, на с.6, строки 3-5 и 10).

Кроме того, в заявке [1] описаны сольватированные формы вортиоксетина в целом и дополнительно описано получение вортиоксетина (см. пример 1, соединение 1e).

По мнению лица, подавшего возражение, единственная разница между изобретением по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента и изобретением, раскрытым в заявке [1] заключается в кристалличности заявленных соединений (см. строки 4-7 с.3 описания оспариваемого патента).

При этом по мнению лица, подавшего возражение, единственный предположительный технический результат довольно общего технического признака «кристаллический» может заключаться в том, что кристаллические формы вортиоксетина и его фармацевтически приемлемых солей пригодны для фармацевтических целей и, в частности, для пероральных лекарственных форм.

Вместе с тем в возражении также определяется техническая задача, решаемая изобретением, которая, по мнению лица, подавшего возражение,

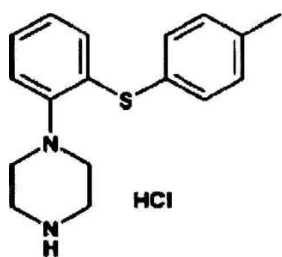
может быть сформулирована как «идентификация альтернативной формы вортиоксетина, которая может быть полезна для фармацевтических целей».

При этом в возражении отмечено, что решение технической задачи, предлагаемое в оспариваемом патенте, заключается в создании множества кристаллических форм вортиоксетина. Эти кристаллические формы были получены стандартными методами, известными в данной области техники.

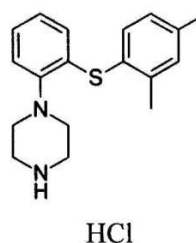
Однако, по мнению лица, подавшего возражение, в оспариваемом патенте не показано преимущество или неожиданный эффект (технический результат) какой-либо из раскрытых кристаллических форм по сравнению с тем, что уже было известно в данной области техники. При этом отмечено, что сочетание фармакологических свойств, указанных в описании к оспариваемому патенту, представляет собой неотъемлемое и, следовательно, непатентоспособное свойство самого соединения вортиоксетина независимо от его кристаллической формы.

В возражении сделан вывод о том, что квалифицированный специалист в области разработки фармацевтических лекарственных средств должен знать общие знания, отраженные в документах [3]-[6] и [8]-[10].

В возражении приводятся цитаты из упомянутых документов общего уровня техники. Кроме того, анализируя сведения, раскрытые в заявке [1], лицо, подавшее возражение, отмечает, что соединение примера 2 заявки [1] (соединение А) и соединение примера 5 по оспариваемому патенту, представляющее собой гидрохлоридную соль вортиоксетина (соединение В), имеют очень схожие химические структуры.



Соединение А



Соединение В

Принимая во внимание раскрытое в заявке [1] соединение А, для специалиста в данной области техники очевидно, что вортиоксетин может существовать в кристаллических формах, поскольку его химическая структура практически одинакова с упомянутым соединением из заявки [1].

Также в возражении отмечено, что в заявке [1] (с. 6, строки 3-5 и 10) указано, что вортиоксетин является особенно предпочтительным вариантом изобретения. Поэтому квалифицированный специалист был заинтересован в проверке кристаллических форм вортиоксетина. Учитывая стандартные методы, используемые в заявке [1], и тот факт, что в заявке отсутствует информация о каких-либо трудностях при кристаллизации описанных соединений, успешная кристаллизация вортиоксетина была вполне ожидаема и очевидна, а неожиданные характеристики или преимущества кристаллических форм вортиоксетина в оспариваемом патенте отсутствуют.

В возражении приведен анализ признаков, охарактеризованных в зависимых пунктах 2-3, 7 формулы, обосновывая при этом отсутствие изобретательского уровня определенных форм солей присоединения вортиоксетина с кислотами.

В возражении также отмечено, что аргументы, приведенные в отношении отсутствия изобретательского уровня у изобретений по пунктам 1-7 формулы, применимы и к изобретениям по пунктам 8-11 формулы группы изобретений.

Патентообладателем, ознакомленным с материалами возражения в установленном порядке, на заседании коллегии, состоявшемся 25.06.2025 (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии), представлен отзыв по мотивам возражения.

К отзыву приложены копии следующих материалов:

- Решение Роспатента от 19.07.2022 по делу № 2005127356/04(2418802) на 40 л. (далее – [А1]);

- постановление Президиума СИП от 19.12.2024 по делу № СИП-936/2022 на 15 л. (далее – [A2]).

В отношении соответствия условию патентоспособности «новизна» изобретений по оспариваемому патенту, патентообладатель отмечает следующее.

В заявке [1] описана группа соединений общей структурной формулы I, которая охватывает соединение 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазин, раскрытое в заявке [1] как специально полученное и исследованное. При этом патентообладатель отмечает, что в заявке [1] отсутствует информация о том, что данное соединение является кристаллическим или даже в принципе способно к полиморфизму. В примере 1 не содержится указание на то, что полученные соединения, включая соединение 1e, являются кристаллическими. Кроме того, пример 1 не касается получения сольватов, в заявке [1] говорится лишь о теоретической возможности использования всех заявленных соединений в виде сольватов. При этом кристаллические соединения в заявке [1] получают в примере 2, где используют иной способ.

Вместе с тем патентообладатель упоминает решение [A1] в качестве устоявшейся практики рассмотрения возражений, относящихся к новым кристаллическим формам известных соединений.

Законность решения [A1] была подтверждена решением Суда по интеллектуальным правам от 05.08.2024 по делу № СИП-936/2022, оставленным без изменения постановлением Президиума Суда по интеллектуальным правам [A2].

В отношении соответствия условию патентоспособности «изобретательский уровень» изобретений по оспариваемому патенту, патентообладатель отмечает следующее.

В заявке [1] отсутствуют какие-либо сведения о том, что соединение находится или может находиться в виде кристаллической формы.

Документы [2]-[6] и [8]-[10] не раскрывают соединение 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазин и его кристаллические формы, а представляют собой ссылки общего характера, относящиеся к явлению полиморфизма.

В отзыве приведен анализ сведений, раскрытых в упомянутых документах общего уровня техники.

Патентообладатель в отзыве делает вывод о том, что научные знания в данной области техники свидетельствуют о непредсказуемости возможности получения кристаллической формы у известного вещества, не говоря о возможности предсказания свойств у такой новой кристаллической формы. По мнению патентообладателя не существует методик, которые позволили бы предсказать возможность получения кристаллической формы конкретного химического вещества, и есть еще большая неопределенность в том, будет ли она обладать улучшенными характеристиками или нет.

Также, патентообладатель отмечает, что технический результат изобретения по оспариваемому патенту, заключающийся в реализации назначения, а именно в получении кристаллических форм 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазина, и его солей, обладающих высокой стабильностью и низкой гигроскопичностью, подтвержден в примерах описания к оспариваемому патенту (с. 15-18), где раскрыто получение кристаллических форм 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазина, как в виде свободного основания, так и в виде его фармацевтически приемлемых солей и показано, что полученные кристаллические формы обладают высокой стабильностью и низкой гигроскопичностью.

Кроме того, патентообладатель отмечает, что поскольку изобретение по пункту 1 формулы оспариваемого патента отвечает условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень», изобретение

по независимым пунктам 8, 9, 11, 12 и зависимым пунктам 2-7, 10 также отвечает этим условиям.

В корреспонденции, поступившей 05.08.2025, лицом, подавшим возражение, представлен ответ на отзыв патентообладателя.

В отзыве лицо, подавшее возражение, настаивает на том, что сольватная форма относится к кристаллическим форме соответствующего соединения, что общеизвестно, и описано, например, в документе [2] (см. фиг. 7.1, с. 3).

При этом подчеркнуто, что в заявке [1] даже не выделяются отдельно аморфные формы, поскольку несольватированная форма может быть не только аморфной, но и кристаллической или аморфно-кристаллической.

Также в отзыве обращается внимание на то, что в заявке [1] (см. с. 21 последняя строка, с.22, строки 1-3) пример 1 уже описывает сбор фильтратов, которые затем очищают с помощью препаративной ЖХ-МС и ионообменной хроматографии с получением выделенного продукта.

Доводы ответа в отношении сведений раскрытых в примере 1 заявки [1], в частности сведения раскрытые в примере 1e, по существу повторяют доводы возражения.

В отношении несоответствия изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в ответе отмечено, что изобретение по пункту 1 формулы оспариваемого патента относится к кристаллическому основанию 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил пиперазина и к любым его кристаллическим фармацевтическим солям неустановленной химической структуры, поскольку в пункте 1 формулы не указана природа солевого остатка, однако примерами реализации изобретения 3a-14a показан способ получения, подтверждение химической структуры и изучение физических свойств только некоторых фармацевтически приемлемых солей, перечисленных в пункте 2 формулы.

При этом в ответе отмечено, что изобретение по пункту 2 формулы оспариваемого патента относится к определенному списку некоторых кристаллических фармацевтических солей с установленной химической структурой (в связи с известностью солевого остатка) в любой кристаллической форме. Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, неправомерно обобщение существенного признака, охарактеризованного в пункте 1 формулы как любые «фармацевтически приемлемые соли».

Также в ответе приводится анализ пункта формулы относящегося к фармацевтической композиции и делается вывод о том, что в оспариваемом патенте не подтвержден технический результат «реализация назначения» или «расширение арсенала средств определенного назначения» для всех заявленных кристаллических соединений по пунктам 1-4 оспариваемого патента, т.е. в материалах заявки отсутствует указание на средства и методы, использование которых позволяет осуществить изобретение с возможностью достижения указанного патентообладателем технического результата, в связи с чем изобретение по оспариваемому патенту не соответствует требованию достаточности раскрытия сущности изобретения и условию патентоспособности «промышленная применимость».

В отношении указанного патентообладателем дополнительного технического результата «высокой стабильности и низкой гигроскопичности полученных кристаллических форм» лицо, подавшее возражение, отмечает, что примерами воплощения изобретения 3a-14a не показана высокая стабильность кристаллических форм, поскольку в упомянутых примерах проведено исследование полученных целевых продуктов сочетанием данных методов дифференциальной сканирующей калориметрии (DSC), определяющей температуру фазового перехода (температуру плавления) предложенных соединений и методов рентгеновской дифракции (XRD, фиг. 1-17), подтверждающих их кристалличность только в момент получения, но

не стабильность кристаллической формы во времени и условиях, требуемыми регуляторными органами при разработке фармацевтических субстанций и готовых лекарственных форм (см. документ [8], с. 14, пункт с, Дерево решений № 4).

В примере 5, относящемся к изготовлению таблеток, не приведено исследование физической стабильности активной фармацевтической субстанции (определение кристаллической формы) методом рентгеновской дифракции и химической стабильности в технологических условиях, имитирующих процесс гранулирования активной субстанции.

В корреспонденции, поступившей 06.10.2025 от патентообладателя поступили пояснения, в которых отмечено, что в примере 1e заявки [1] не получают 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазин в кристаллической форме так как в примере 3b согласно оспариваемому патенту используют иной способ, который как раз и приводит к получению кристаллической формы согласно оспариваемому патенту.

В отношении соответствия изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость» в пояснениях отмечено, что лицом, подавшим возражение приведены неверные нормы евразийского патентного права, при этом приведены верные, по мнению патентообладателя, нормы права, причем отмечено, что данный подход при оценке промышленной применимости также соответствует установившейся судебной практике, которая подтверждена решением от 05 декабря 2019 г. по делу № СИП-151/2019, которое было оставлено без изменения постановлением президиума Суда по интеллектуальным правам от 28.05.2020.

Таким образом, по мнению патентообладателя, для соответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость», в описании изобретения должны быть раскрыты назначение изобретения, а

также средства и методы, использование которых позволяет осуществить изобретение.

При этом отмечено, что в описании к оспариваемому патенту раскрыто назначение изобретения, а также раскрыты средства и методы, использование которых позволяет осуществить изобретение, относящееся к новой кристаллической форме вещества, а также описание к оспариваемому патенту содержит исчерпывающие сведения о средствах и методах, позволяющих получить фармацевтические композиции, содержащие кристаллическую форму 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазина, как в виде свободного основания, так и в виде его фармацевтически приемлемых солей.

От лица, подавшего возражение, в корреспонденции от 25.11.2025 поступил ответ на пояснения, к которому приложены копии следующих документов:

- документ «Об утверждении правил проведения исследований биоэквивалентности лекарственных препаратов в рамках Евразийского экономического союза» (в ред. Решений Совета Евразийской экономической комиссии от 04.09.2020 N 67, от 15.02.2023 N 22, от 12.04.2024 N30) с. 1-6 (далее – [11]);

- документ Ниязов Р. Р., Рождественский Д. А. и др. Регуляторные аспекты регистрации воспроизведенных и гибридных лекарственных препаратов в Евразийском экономическом союзе. Ремедиум. Журнал о российском рынке лекарств и медицинской технике. 2018; 7-8: 6-17 (далее – [12]).

В пояснениях лицом, подавшим возражение, приводится анализ способа получения примера 1е заявки [1] и получения продукта согласно оспариваемому патенту. Также обсуждаются методы очистки и выделения продукта.

В отношении изобретательского уровня в ответе на пояснения приведены доводы в отношении достижения технического результата, которые по существу повторяют ранее представленные доводы.

При этом также приведены доводы в отношении достоверности и достаточности сведений, приведенных в экспериментальных примерах «*in vivo*» и «*in vitro*» с учетом требований, раскрытых в документах [11] и [12].

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

С учетом даты подачи (15.06.2007) заявки, на основании которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки патентоспособности группы изобретений по указанному патенту включает упомянутую Конвенцию и Патентную инструкцию к Евразийской патентной конвенции, утвержденную Административным советом Евразийской патентной организации на втором (первом очередном) заседании 1 декабря 1995 г. с изменениями и дополнениями, утвержденными на шестом (четвертом очередном) заседании Административного совета ЕАПО 25-26 ноября 1997 года, одиннадцатом (восьмом очередном) заседании 15-19 октября 2001 года, четырнадцатом (десятом очередном) заседании 17-21 ноября 2003 года, семнадцатом (двенадцатом очередном) заседании 14-18 ноября 2005 года (далее – Патентная инструкция).

В соответствии со статьей 6 Конвенции Евразийское ведомство выдает евразийский патент на изобретение, которое является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно статье 10 Конвенции объем правовой охраны, предоставляемой евразийским патентом, определяется формулой изобретения.

Согласно статье 13 пункта 1 Конвенции любой спор, касающийся действительности евразийского патента в конкретном Договаривающемся государстве разрешается национальными судами или другими

компетентными органами этого государства на основании настоящей Конвенции и Патентной инструкции. Решение имеет силу лишь на территории Договаривающегося государства.

Согласно правилу 54 Патентной инструкции, евразийский патент в соответствии со статьей 13 Конвенции с учетом правила 52 Инструкции может быть признан недействительным на территории Договаривающегося государства полностью или частично в течение всего срока его действия, в случаях:

неправомерной выдачи евразийского патента вследствие несоответствия охраняемого им изобретения условиям патентоспособности, установленным Конвенцией и Инструкцией;

наличия в формуле изобретения признаков, отсутствовавших в первоначальных материалах евразийской заявки;

неправильного указания в евразийском патенте изобретателя или патентовладельца.

Согласно правилу 3 (1) Патентной инструкции в соответствии со статьей 6 Конвенции евразийский патент выдается на изобретение, которое является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Изобретение признается новым, если оно не является частью предшествующего уровня техники.

Объекты, являющиеся частью предшествующего уровня техники, для определения новизны изобретения могут учитываться лишь отдельно.

Предшествующий уровень техники включает все сведения, ставшие общедоступными в мире до даты подачи евразийской заявки, а если испрашен приоритет, - до даты ее приоритета.

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

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

Согласно правиле 47 (2) Инструкции, при проверке соответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость» устанавливаются:

наличие в материалах евразийской заявки указания на назначение заявленного изобретения;

наличие в материалах евразийской заявки или источниках информации, относящихся к предшествующему уровню техники, сведений о средствах и методах, использование которых позволяет осуществить изобретение в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения.

Согласно правиле 47 (2) Инструкции, при проверке соответствия заявленного изобретения условию патентоспособности "новизна" устанавливается, является ли заявленное изобретение частью предшествующего уровня техники. Изобретение не признается соответствующим условиям новизны, если в предшествующем уровне техники выявлены сведения об объекте, который имеет технические признаки, идентичные всем техническим признакам изобретения, содержащимся в независимом пункте формулы изобретения.

Согласно правилу 47 (2) Патентной инструкции при проверке соответствия изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» определяется, является ли заявленное изобретение очевидным для специалиста, исходя из предшествующего уровня техники.

С целью толкования положений Конвенции и Патентной инструкции используются Правила составления, подачи и рассмотрения заявок на выдачу евразийских патентов на изобретения, утверждены приказом ЕАПВ от 03 июня 2002 г . № 12, с изменениями, утвержденными приказом ЕАПВ от 11 апреля 2003 г . № 3 (далее – Правила ЕАПВ).

Группе изобретений по оспариваемому патенту представлена правовая охрана в объеме совокупности признаков, содержащихся в приведенной выше формуле.

Прежде всего, необходимо также отметить, что в соответствии с пояснениями представителя Евразийского патентного ведомства, данными в ходе рассмотрения спора, в соответствии с пунктом 1 правила 54 Инструкции в редакции, действовавшей на дату подачи заявки, по которой выдан оспариваемый патент, не предусмотрена возможность признания евразийского патента недействительным на территории договаривающегося государства в силу недостаточно ясного и полного раскрытия изобретения в материалах заявки.

Таким образом, в рамках данного возражения соответствующие доводы не могут быть рассмотрены.

Анализ доводов сторон, касающихся соответствия группы изобретений по независимым пунктам 1, 8, 9, 11, 12 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость» показал следующее.

В соответствии с пояснениями представителя Евразийского патентного ведомства, данными в ходе рассмотрения спора, ни Инструкция, ни Правила ЕАПВ не требуют, чтобы в материалах заявки были приведены примеры, подтверждающие получение всех и каждого возможных альтернативных вариантов, охваченных независимым пунктом формулы изобретения. Кроме того, представителем ЕАПВ было отмечено, что на дату подачи заявки ни в ЕАПВ, ни в Роспатенте еще не сложилась единообразная практика, согласно которой в независимом пункте формулы кристаллическую форму характеризовали бы строго определенными физико-химическими характеристиками, подтверждающими наличие кристалличности. Соответственно, если в заявке было описано несколько кристаллических форм, обобщение до определения «кристаллический» было

допустимо в независимом пункте с раскрытием конкретных форм в зависимых пунктах, что имело место в оспариваемом патенте.

Вместе с тем, согласно пункту 5.5. Правил ЕАПВ при проверке соответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость» устанавливаются:

наличие в материалах заявки указания на назначение изобретения (для химических соединений — возможное их применение), то есть возможности выполнения им функции, характеризующей определенную общественную потребность;

наличие в материалах евразийской заявки или источниках информации, относящихся к предшествующему уровню техники, сведений о средствах и методах, использование которых позволяет осуществить изобретение в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения.

Сведения об этих средствах должны либо содержаться в описании изобретения, либо, если они не раскрыты в описании, то в нем должны содержаться указание на их известность и известность их использования во взаимодействии с другими средствами, характеризующими изобретение, а также ссылка на источник информации, общедоступный на дату приоритета изобретения, в котором эти средства описаны достаточно подробно для их осуществления специалистом.

При анализе изобретения с точки зрения возможности достижения заявленного технического результата устанавливается наличие в формуле изобретения всех признаков, необходимых для обеспечения этого технического результата.

Если у экспертизы возникают сомнения в возможности достижения заявленного технического результата предложенными средствами, заявителю направляется запрос с соответствующими аргументами. Эти аргументы должны быть подкреплены либо ссылками на известные знания (сведения), либо обоснованы экспертизой с помощью приводимых доказательств.

При этом технический результат не должен указывать на какую-то абсолютную значимость изобретения. Ухудшение одних свойств объекта при улучшении других его свойств (или без улучшения) не может служить основанием для вывода о несоответствии изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость».

Экспертиза не может требовать от заявителя представления дополнительных материалов, подтверждающих достижение технического результата, без приведения обоснований их необходимости.

Невозможность достижения одного или нескольких результатов, перечисленных в описании, не означает несоответствия изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость», если какой-либо технический результат из числа перечисленных в описании изобретения может быть достигнут.

При рассмотрении заявок на вещества следует иметь в виду, что если в заявке не описан способ получения вещества и этот способ нельзя представить на основании сведений о самом веществе, то изобретение нельзя признать осуществимым, а следовательно, промышленно применимым.

В описании к оспариваемому патенту (см., например, с. 2) указано, что изобретения относятся к соединениям, которые проявляют активность в отношении ингибирования повторного захвата серотонина в сочетании с активностью в отношении рецептора серотонина 1A (5-HT_{1A}) и рецептора серотонина 3 (5-HT₃) и пригодны для лечения связанных с ЦНС заболеваний.

Также в описании к оспариваемому патенту имеется достаточное количество примеров, подтверждающих получение различных кристаллических форм вортиоксетина и его солей с приведением рентгенограмм и сведений о стабильности, растворимости и гигроскопичности (примеры 3-14 на с. 15-19, фигуры 1-17). Кроме того, приведены сведения об использовании кристаллического вортиоксетина для

получения готовых лекарственных препаратов в форме таблеток (с. 9-10, 19-2 (пример 15 описания).

Возможность реализации назначения подтверждается данными испытаний в условиях *in vitro* и *in vivo* в примерах 1 (*in vitro*), 16, 26-27 (*in vivo*) на с. 15, 20-21, 25-27 описания к оспариваемому патенту и фиг. 18-22).

Использования в биологических испытаниях одной конкретной соли (гидробромида), не является причиной для отрицания активности других солей и свободного основания вортиоксетина. Общеизвестно, что соли являются ионными соединениями и в растворе находятся в диссоциированной форме в виде ионов. Специалисту в данной области техники известно, что за биологическую активность отвечает именно соединение (вортиоксетин), которое взаимодействует с соответствующими рецепторами, а не ионы солеобразующей кислоты (например, бромид или хлорид).

При этом на дату приоритета изобретений по оспариваемому патенту ингибиторы ацетилхолинэстеразы (донепезил, ривастигмин и галантамин) прочно заняли место стандартной симптоматической терапии болезни Альцгеймера, и их механизм действия через повышение уровня ацетилхолина в коре и гиппокампе считался основным объяснением их клинической эффективности в улучшении памяти, внимания и повседневной активности.

В примере 26 описания к оспариваемому патенту показано, что введение соединения I и его солей приводит к увеличению внеклеточного уровня ацетилхолина в коре и гиппокампе.

В примере 27 описания к оспариваемому патенту представлены данные из признанной клинической когнитивной модели (выработка ситуативного условно-рефлекторного страха), которые так же показывают прокогнитивный эффект вортиоксетина и его солей.

При этом необходимо отметить, что сведения, раскрытые в документах [12] и [11] не относятся к производным вортиоксетина и не относятся к оценке патентоспособности изобретений в области химии и медицины, а являются источниками информации, раскрывающими регуляторные аспекты регистрации воспроизведенных и гибридных лекарственных препаратов в Евразийском экономическом союзе и правила проведения исследований биоэквивалентности лекарственных препаратов в рамках Евразийского экономического союза.

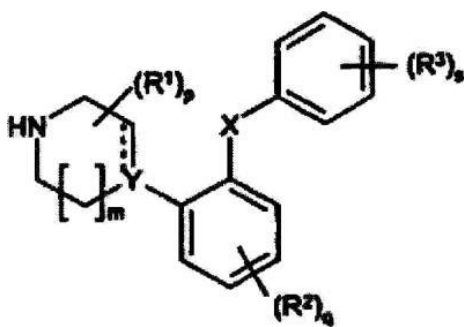
Таким образом, упомянутые доводы лица, подавшего возражение, в отношении сведений, раскрытых в документах [11] и [12] не относятся к оценке соответствия изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость» в соответствии с нормами Евразийского патентного законодательства.

В соответствии с требованиями Евразийского патентного законодательства в описании к оспариваемому патенту приведены сведения необходимые для признания группы изобретений по независимым пунктам 1, 8, 9, 11, 12 формулы оспариваемого патента промышленно применимыми, поскольку они могут быть использованы в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других областях человеческой деятельности (правило 3 (1) Патентной инструкции, правило 47 (2) Патентной инструкции).

Способы по независимым пунктам 13 и 24 формулы не оспариваются.

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия группы изобретений по оспариваемому условию патентоспособности «новизна», показал следующее.

Заявка [1] раскрывает группу соединений общей формулы



с указанными в формуле заявки [1] значениями радикалов.

В объем группы соединений указанной выше общей формулы входит соединение 1-[2-(2,4-диметилфенилсульфанил)фенил]пиперазин (далее - вортиоксетин, см. документ [7]).

Также вортиоксетин упоминается в перечне предпочтительных соединений в описании к оспариваемому патенту (с. 6) и в общем способе его получения в примере 1 описания заявки [1] (с. 21-23), где вортиоксетин упомянут как соединение 1e.

При этом следует констатировать, что в примере 1 (1e) нет никаких сведений о форме получаемого соединения (аморфное, кристаллическое) и нет никаких предположений о его возможном полиморфизме.

Так, из примера следует, что соединение получено в форме свободного основания, при этом не представляется возможным предполагать, что соединение выделено в твердой форме, а не в виде масла.

При этом упомянутый пример не раскрывает условия проведения хроматографии (в частности, растворитель) и операции по выделению продукта (осаждение, упаривание). Таким образом, из приведенных сведений не следует, что «свободное основание будет самопроизвольно осаждаться из очищенного фильтрата в кристаллической форме после стадий очистки», поскольку не известен состав фильтрата.

Вместе с тем, общее упоминание в описании заявки [1] (с. 8-9) различных солей, а также сольватированных и несольватированных форм соединений, не может рассматриваться как раскрытие кристаллической формы конкретного соединения. Тот факт, что некоторые авторы, в

частности, в документе [2], классифицируют сольваты соединений как псевдополиморфные/кристаллические формы, не говорит об известности или возможности получения кристаллического сольвата конкретного соединения.

Таким образом, изобретение по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента соответствует условию патентоспособности «новизна», поскольку в предшествующем уровне техники не выявлены сведения об объекте, который имеет технические признаки, идентичные всем техническим признакам изобретения, содержащимся в независимом пункте формулы изобретения (пункт 1 правила 3 и правило 47 (2) Инструкции).

Изобретения по независимым пунктам 8, 9, 11, 12 формулы оспариваемого патента основаны на соединении по независимому пункту 1 формулы, соответственно, также являются новыми.

Способы по независимым пунктам 13 и 24 формулы не оспариваются.

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

Прежде всего, необходимо отметить, что в Суде по интеллектуальным правам (далее – СИП), в частности, в решении СИП по делу № СИП-877/2022 и постановлении Президиума СИП от 19 января 2024 года по делу № СИП-877/2022 определена методология оценки соответствия изобретения, относящегося к полиморфным модификациям химического вещества, условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. также статью В.А. Корнеева «Об изобретательском уровне новой кристаллической формы известного вещества» в журнале Суда по интеллектуальным правам, март 2024 (10 листов) DOI: 10.58741/23134852_2024_1_2).

При этом методология оценки сформулирована с учетом мировой, в частности, европейской практики оценки соответствия изобретений относящимся к полиморфам известных соединений условию патентоспособности «изобретательский уровень» и может быть без

ограничений применена в оценке соответствия упомянутому условию патентоспособности, полиморфов согласно евразийскому патенту.

При этом в судебных актах приняты во внимание сведения, раскрытые в статье ОФС.1.1.0017.15 «Полиморфизм» Государственной фармакопеи Российской Федерации XIII издания, введенной в действие с 01.01.2016 приказом Министерства здравоохранения Российской Федерации от 29.10.2015 № 771, согласно которым, полиморфизм это способность вещества существовать в различных кристаллических формах при одинаковом химическом составе.

В упомянутых судебных актах СИП отметил специфику полиморфизма веществ, которая исключает возможность применения стандартной методологии оценки изобретательского уровня новых кристаллических форм известного вещества, по сравнению с самим известным веществом. Поскольку перебор различных полиморфных кристаллических форм вещества может быть рутинной задачей для специалиста, при том, что поиск конкретной полиморфной кристаллической формы может быть направлен и на решение конкретной технической задачи.

Руководствуясь технической информацией о свойствах полиморфов, раскрытой в Фармакопее, СИП (Президиум СИП) сделал вывод о том, что поиск кристаллической формы вещества может быть направлен на решение конкретной технической задачи, и такая решающая конкретную задачу новая форма должна признаваться обладающей изобретательским уровнем, если для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

Как изложено в судебных актах СИП, отличия полиморфных кристаллических форм одного вещества (их совокупность) могут быть неожиданными.

Таким образом, СИП исходит из того, что проверка новой кристаллической формы на соответствие условию патентоспособности «изобретательский уровень» включает в себя анализ в числе прочего:

- известности (или очевидности для специалиста) полиморфизма конкретного вещества (а не полиморфизма в целом как явления);

- известности (или очевидности для специалиста), в том числе стандартности, методов получения конкретной кристаллической формы конкретного вещества;

- неожиданности для специалиста конкретного изменения физико-химических свойств, эффекта (неожиданности технического результата) по сравнению с известными формами конкретного вещества.

С учетом выводов, сделанных в правовых актах Суда по интеллектуальным правам, а также привлекая с целью толкования положений Патентной инструкции, указанные в правовой базе Правила ЕАПВ, необходимо уточнить, что согласно пункту 5.8 Правил, проверка изобретения на соответствие условию патентоспособности «изобретательский уровень», как правило, включает:

- выявление наиболее близкого аналога (прототипа);

- выявление признаков, отличающих заявленное изобретение от прототипа;

- определение других решений, характеризуемых этими признаками;

- установление известности этих решений.

В результате анализа независимого пункта формулы изобретения может быть установлено, что:

все содержащиеся в нем признаки изобретения имеют отношение к достижению заявленного технического результата. В этом случае установление соответствия изобретения по этому пункту условию патентоспособности «новизна», как правило, одновременно означает соответствие этого изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень».

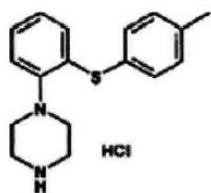
Согласно пункту 2.5.4. Правил ЕАПВ под техническим результатом может также пониматься расширение арсенала средств, актуальных в какой-

либо области деятельности, или получение таких средств впервые, необходимо отметить следующее.

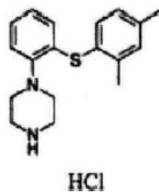
В качестве наиболее близкого аналога следует выбрать заявку [1], которая является единственным, из приведенных в возражении источников информации, имеющих отношение к соединению вортиоксетина.

Однако как изложено выше, при оценке соответствия вортиоксетина и изобретений на нем основанных, условию патентоспособности «новизна», в заявке [1] (см., например, пример 1 (1e)) не раскрывается в явном виде получение вортиоксетина в твердой форме и, тем более, не предполагается получение каких-либо полиморфных/кристаллических форм вортиоксетина или его солей.

При этом следует отметить, что в примере 2 описания заявки [1] (с.23) раскрыто получение гидрохлорида соединения, близкого по структуре к гидрохлориду вортиоксетина



гидрохлорид соединения
согласно примеру 2



гидрохлорид
вортиоксетина

при этом способы получения указанных гидрохлоридов имеют существенные, для получения кристаллических форм, отличия.

Так, в заявке [1] (пример 2) гидрохлорид соединения очищают кристаллизацией из смеси эфир/метанол, тогда как в примере 5 описания к оспариваемому патенту используют смеси этилацетат/эфир (для кристаллизации гидрохлорида вортиоксетина) и этанол/вода (для моногидрата гидрохлорида вортиоксетина).

Соответственно, возможность получения кристаллической формы, и, тем более, множества кристаллических форм вортиоксетина основания и его солей и сольватов, не следует очевидным образом из заявки [1].

При этом кристаллические формы вортиоксетина получены в оспариваемом патенте впервые.

Наиболее предпочтительной формой является бета-форма гидробромида вортиоксетина (примеры 4с, 4d, с. 15 описания к оспариваемому патенту), которая характеризуется сочетанием низкой гигроскопичности и достаточной стабильности и растворимости.

Вместе с тем, большинство полученных в оспариваемом патенте кристаллических форм характеризуются слабой гигроскопичностью (менее 2%) и высокой стабильностью.

Таким образом, достижение технического результата, заключающегося, как в расширении арсенала средств, так и заключающегося в получении средств с улучшенными физико-химическими показателями (гигроскопичности, растворимость, стабильность) подтверждено в описании к оспариваемому патенту.

Вместе с тем необходимо отметить, что общие сведения о полиморфизме соединений и его значении для использования соединений в области фармацевтики, раскрытые в документах [2]-[6], [8]-[10], не делают для специалиста очевидным получение кристаллической формы конкретного вещества. Ни один из указанных документов, взятый отдельно или в сочетании с другими процитированными документами, не раскрывает и не предполагает ни кристаллические формы вортиоксетина и/или его фармацевтически приемлемых соли, ни способы их получения. Также из этих документов не следует, что на дату приоритета оспариваемого патента существовали какие-либо способы предсказания существования полиморфов у конкретного вещества либо способы получения полиморфов с определенными физико-химическими характеристиками.

Так, документ [2] представляет собой статью, в которой в общем виде указано, что биологически активные соединения могут существовать как в аморфной форме, так и в форме полиморфов и псевдополиморфов.

Документ [3] представляет собой статью общего содержания, в которой в общем виде описано наличие кристаллических полиморфов в качестве условия для коммерческой разработки.

Документ [4] раскрывает подход для описания фармацевтических твердых веществ с целью ускоренного одобрения соответствующих нормативных документов. При этом в документе [4] (с.3) указано на неочевидность получения кристаллической формы

Документ [5] описывает измерение подвижности молекул аморфных фармацевтических твердых веществ при температуре ниже температуры стеклования.

В документе [8] описаны аналитические методики и критерии приемлемости для новых лекарственных веществ и новых лекарственных препаратов.

В документе [9] в общем виде описана растворимость нестабильных соединений, в том числе, полиморфов.

Документ [10] описывает влияние свойств твердых веществ на оценку уместности разработки потенциальных лекарственных средств.

Что касается фармакологического профиля кристаллических форм вортиоксетина, то он охватывает анатагонизм 5-НТ₃ и агонизм к 5-НТ_{1A} в дополнение ингибирующему эффекту в отношении транспорта серотонина, что позволяет использовать это соединение для лечения когнитивных нарушений (с. 5 описания к оспариваемому патенту).

Таким образом, не выявлено препятствий для признания изобретений по независимым пунктам 1, 8, 9, 11, 12 формулы оспариваемого патента соответствующими условию патентоспособности «изобретательский

уровень» (правило 47 (2) Патентной инструкции, см. также пункт 5.8 Правил ЕАПВ).

Способы по независимым пунктам 13 и 24 формулы не оспариваются.

Целесообразно отметить, что сделанный выше вывод не противоречит выводам, сделанным в постановлении Президиума Суда по интеллектуальным правам по делу № СИП-877/2022, постановлении Президиума [A2] и решении Роспатента [A1].

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 28.01.2025, действие на территории Российской Федерации евразийского патента на изобретение № 015287 оставить в силе.