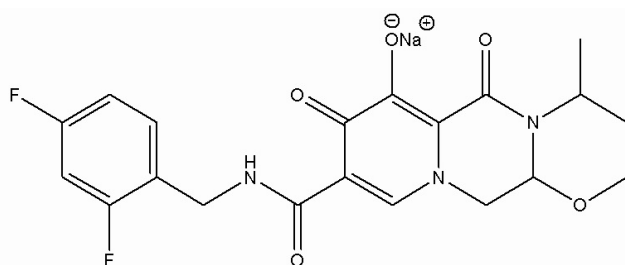


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам рассмотрения ☒ возражения

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, поступившее 26.02.2025 от компании «ВАЙВ ХЕЛТКЕР КОМПАНИ» (US), США (далее – лицо, подавшее возражение), против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2826748, выданного по заявке №2024121191, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации №2826748 (далее – оспариваемый патент) на изобретение «СПОСОБ ПОЛУЧЕНИЯ (4R,12aS)-N-(2,4-ДИФТОРБЕНЗИЛ)-7-ГИДРОКСИ-4-МЕТИЛ-6,8-ДИОКСО-3,4,6,8,12,12a-ГЕКСАГИДРО-2Н-ПИРИДО[1',2':4,5]ПИРАЗИНО[2,1-b][1,3]ОКСАЗИН-9-КАРБОКСАМИДА НАТРИЯ» с приоритетом от 25.07.2024, установленным по дате подачи (25.07.2024) заявки № 2024121191, выдан на имя АКЦИОНЕРНОГО ОБЩЕСТВА «БИОХИМИК» (далее – патентообладатель), со следующей формулой изобретения:

1. Способ получения (4R,12aS)-N-(2,4-дифторбензил)-7-гидрокси-4-метил-6,8-диоксо-3,4,6,8,12,12а-гексагидро-2Н-пиридо[1',2':4,5]пиразино[2,1-Ь][1,3]оксазин-9-карбоксамида натрия (соединения формулы (II)), включающий взаимодействие (4R,12aS)-N-(2,4-дифторбензил)-7-гидрокси-4-метил-6,8-диоксо-3,4,6,8,12,12а-гексагидро-2Н-пиридо[1',2':4,5]пиразино[2,1-Ь][1,3]оксазин-9-карбоксамида с гидроксидом натрия в смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно



соединение формулы (II)

2. Способ по п. 1, характеризующийся тем, что спирт представляет собой одноатомный спирт.

3. Способ по п. 1, характеризующийся тем, что смесь растворителей состоит из метиленхлорида и спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:3,00, соответственно.

4. Способ по п. 2, характеризующийся тем, что одноатомный спирт выбран из группы, включающей метанол, этанол, 1-пропанол, 2-пропанол, 1-бутанол, 2-бутанол и изобутанол.

5. Способ по п. 1, характеризующийся тем, что дополнительно включают следующие стадии:

- а) выделение продукта и/или;
- б) промывка выделенного продукта и/или;
- с) сушка продукта.

6. Способ по п. 5, характеризующийся тем, что стадию б) проводят

при помощи органического растворителя.

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса было подано возражение, мотивированное несоответствием изобретения, охарактеризованного в вышеприведенной формуле, условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень».

К возражению, приложены копии следующих источников информации:

- патентный документ CN 115385931 А, дата публикации 25.11.2022, с переводом релевантных частей на 48 л. (далее – [1];
- INA 20/2024 (заявка 202241065264), дата публикации 17.05.2024 с переводом релевантных частей на 39 л. (далее – [2];
- патентный документ EP 3045461 А1, дата публикации 20.07.2016, с переводом релевантных частей на 67 л. (далее – [3];
- патентный документ WO 2016125192 А2, дата публикации 11.08.2016, с переводом релевантных частей на 53 л. (далее – [4];
- патентный документ WO 2017/029642 А2, дата публикации 23.02.2017, с переводом релевантных частей на 64 л. (далее – [5];
- патентный документ WO 2015/118460 А1, дата публикации 13.08.2015; с переводом релевантных частей на 24 л. (далее – [6].

В возражении отмечено, что предложенный в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента способ получения долутегравира натрия не соответствует условию патентоспособности «новизна», поскольку совокупность признаков, характеризующих предложенный способ получения долутегравира натрия известна из уровня техники.

При этом отмечено, что в патентном документе [1] (параграфы [0003]-[0006], [0021]-[0023], [0075]-[0087], [0090]-[0094], [0117]) описывается способ получения долутегравира натрия путем взаимодействия долутегравира (основания) с гидроксидом натрия в среде смеси растворителей, включающих среди прочих метанол, этанол, н-пропанол,

циклогексанол, изопропиловый спирт, трет-бутиловый спирт, н-бутиловый спирт, втор-бутиловый спирт, дихлорметан (другое название метиленхлорид).

При этом, лицо, подавшее возражение, отмечает, что в патентном документе [1] получение долутегавира натрия может быть проведено в смеси растворителей метиленхлорид и метанол, причем объемное соотношение метиленхлорида к метанолу составляет 1-5 : 1-5 (параграф [0120]). Объемное соотношение метиленхлорида к спирту по пункту 1 формулы оспариваемого патента в части 1:2-5 подпадает под раскрытый в патентном документе [1] диапазон объемного соотношения растворителей.

Вместе с тем, в возражении отмечено, что признаки зависимых пунктов 2, 3, 4 формулы оспариваемого патента известны из патентного документа [1] (параграфы [0003]-[0006], [0021]-[0023], [0075]-[0087], [0090]-[0094], [0117], [0120]).

Признаки зависимого пункта 5 формулы известны из патентного документа [1] (параграф [0108], [0016], примеры 1 и 2 в параграфах [0273] и [0279]).

По мнению лица, подавшего возражение, изобретение по оспариваемому патенту не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», в части новых альтернатив объемного соотношения метиленхлорида к спирту 1,00:6,00 - 1,00:10, поскольку он явным образом следует для специалиста из уровня техники ввиду следующего.

Наиболее близким аналогом к способу получения долутегавира натрия по оспариваемому патенту является способ получения долутегавира натрия, описанный в патентном документе [2].

Лицо, подавшее возражение, отмечает, что в патентном документе [2] (примеры 3, 6, 8, 11) описан способ получения долутегавира натрия путем взаимодействия долутегавира основания с гидроксидом натрия в

метанольном растворе в присутствии дихлорметана (также известный как метиленхлорид) и метанола в качестве растворителя.

При этом, лицо подавшее возражение, отмечает, что объемное соотношение дихлорметана к метанолу составило 1:1.

Выход целевого долутегравира натрия составил примерно 94,5%, и его чистота составила более 99,5%.

По мнению лица, подавшего возражение, изобретение по оспариваемому патенту отличается от известного из патентного документа [2] способа тем, что объемное соотношение метиленхлорида к спирту составляет от 1,00:6,00 - 1,00:10,00, соответственно.

Однако, специалисту в данной области техники, например из патентного документа [3] (с. 37 строки 26-27) известно, что долутеграбир натрия плохо растворим в спиртах и выпадает в осадок, что позволяет напрямую и легко выделить целевой продукт из реакционной смеси.

Имеющиеся в уровне техники данные подтверждают увеличение выхода при сохранении высокой чистоты целевого долутегравира натрия из спиртовой реакционной среды.

Так, в патентном документе [4] (пример 18) описан способ получения долутегравира натрия, заключающийся во взаимодействии долутегравира основания с гидроксидом натрия в виде спиртового раствора (в метаноле) в смеси растворителей н-бутанола и метанола. Выход целевого долутегравира натрия составил 99,1%.

Также, в патентном документе [5] (с. 17-19) приведены примеры получения долутегравира натрия путем взаимодействия долутегравира основания с раствором гидроксида натрия в изобутаноле, пентаноле или изопентаноле. Известный способ обеспечивал высокий выход целевого долутегравира натрия (100%, примеры 3-6) и чистоту долутегравира натрия выше 99,7% (пример 12).

В патентном документе [6] (с. 4 строки 1-11, 17-27, с.6 строки 4-5,

табл.1, пример 2 -6) описаны примеры получения долутегравира натрия с чистотой более 99,7% путем взаимодействия долутегравира основания с гидроксидом натрия в бутаноле или смеси метанола и бутанола.

При этом лицо, подавшее возражение, делает вывод о том, что из уровня техники известно, что использование большего количества спирта в способе получения долутегравира натрия влияет на технический результат, а именно на достижение высокого выхода реакции при сохранении высокой чистоты продукта.

Таким образом, получение долутегравира натрия с высокой чистотой является уже решенной в уровне техники задачей, и получение долутегравира натрия с чистотой от 99,8% при высоком выходе реакции, согласно методике, приведенной в оспариваемом патенте, не обеспечивает неожиданного технического результата, а является процессом оптимизации рабочих параметров и явным образом следует из уровня техники.

Следовательно, по мнению лица, подавшего возражение, способ получения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента в части новых альтернатив объемного соотношения метиленхлорида к спирту 1,00:6,00 - 1,00:10,00 явным образом следует из документов уровня техники [2]-[6].

Также в возражении отмечено, что признаки зависимых пунктов 2-5 формулы оспариваемого патента известны из патентного документа [1] (параграфы [0003]-[0006], [0021]-[0023], [0075]-[0087], [0090]-[0094], [0117], [0120], примеры 1 и 2). Признаки зависимого пункта 5 формулы также известны из источников информации [2] (примеры 3, 6, 8, 11).

Патентообладателем, ознакомленным в установленном порядке с материалами возражения, на заседании коллегии, состоявшемся 12.05.2025 (см. приложение №2 протоколу заседания коллегии), представлен отзыв по мотивам возражения.

К отзыву приложены копии следующих материалов:

- общая фармакопейная статья ОФС.1.1.0006 «СУБСТАНЦИИ ДЛЯ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОГО ПРИМЕНЕНИЯ» (далее – [7]);

- инструкция по применению лекарственного препарата для медицинского применения «Тивикай®» ЛП 002536 от 14.08.2015, с. 1, 11, 12 (далее – [8]);

- патентный документ RU 2235130 С2, дата публикации 27.08.2004 (далее – [9]).

В отношении соответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «новизна» патентообладатель отмечает, что в абзацах, на которые ссылается лицо, подавшее возражение, ([0117]- [0120]), речь идет о способе получения кристаллической формы ХМ-1 долутегравира натрия, который включает процесс взаимодействия долутегравира с гидроксидом натрия в системе метанол, дихлорметан (метиленхлорид) и этанол (данный процесс показан и в экспериментальной части).

При этом патентообладатель отмечает, что согласно параграфу [0120] объемное соотношение метанола и дихлорметана (метиленхлорида) может составлять 1~5:1~5, однако кроме метанола и дихлорметана (метиленхлорида), в способе получения кристаллической формы ХМ-1 в обязательном порядке присутствует еще один спирт, а именно этанол (см. также абзац [0095]).

Таким образом, по мнению патентообладателя, отличием изобретения по пункту 1 формулы оспариваемого патента от известного из патентного документа [1] является использование смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и единственного спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно. Данное утверждение подтверждается также всем объемом материалов оспариваемого патента, в которых нет ни одного упоминания об использовании смеси спиртов.

Так, в описании изобретения к оспариваемому патенту указано (с. 50), что способ осуществляется таким образом, что к соединению (I) добавляют

метиленхлорид и перемешивают, а затем к полученной смеси добавляют метанольный раствор гидроксида натрия, либо к полученному раствору долутегравира в метиленхлориде добавляли этиловый спирт и гидроксид натрия. Что иллюстрирует, что согласно способу по оспариваемому патенту долутегравир растворяют только в метиленхлориде, а гидроксид натрия в одном спирте.

В отношении соответствия изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» патентообладатель указывает, что техническим результатом изобретения согласно оспариваемому патенту является достижение высокого выхода и чистоты, в том числе солей долутегравира с повышенным профилем безопасности при проведении экологически безвредных, безопасных способов их получения.

По мнению патентообладателя, отличие изобретения по оспариваемому патенту от указанного в возражении способа получения, известного из патентного документа [2], указанного наиболее близким аналогом в возражении, заключается в использовании смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и спирта в определенных объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно.

При этом патентообладатель считает необходимым отметить, что чистота и выход долутегравира натрия, полученного в соответствии со способом, охарактеризованным в оспариваемом патенте, существенно выше, чем в способе по патентному документу [2] (а именно, чистота более 99,8% и количественный выход), что особенно важно для производства фармацевтических субстанций, где необходимо минимизировать присутствие примесей в конечном продукте, поскольку они оказывают негативное влияние как на процесс изготовления, так и на качество конечного продукта. Безопасность лекарственного средства во многом зависит от количества и характера примесей, содержащихся в лекарственном

средстве (с. 5 описания изобретения к оспариваемому патенту).

В то же время, патентообладатель отмечает, что долутегравир относится к препаратам длительного, иногда пожизненного приема, и повышение чистоты даже на сотые доли процента при долгосрочном приеме препарата имеет прямое влияние на профиль безопасности, переносимость пациентом и как следствие приверженность терапии.

Согласно ОФС [7] установлены четкие пределы контроля родственных примесей в зависимости от максимальной суточной дозы лекарственного препарата. При этом максимальная суточная доза долутегравира согласно инструкции [8] составляет 100 мг в сутки.

Таким образом, по мнению патентообладателя, наличие хотя бы одной родственной примеси в субстанции в количестве всего лишь от 0,05 % уже негативно влияет на качество лекарственного средства. Следовательно, не во всех случаях высокая чистота субстанции (например, 99,5%) означает ее фармацевтическую пригодность и безопасность.

Данная проблема была рассмотрена и в патентном документе [9], где известные ранее способы получения субстанции позволяли получить конечный продукт хоть и высокой (до 99,6%), но недостаточной для фармацевтического применения чистоты.

Вместе с тем в отзыве отмечено, что в патентных документах [2]-[6] не раскрыты признаки, характеризующие использование смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно, в процессе получения долутегравира натрия с одновременно высоким выходом реакции и чистотой продукта.

Кроме того, по мнению патентообладателя, признаки, охарактеризованные в зависимых пунктах 2-6 формулы изобретения согласно оспариваемому патенту не раскрываются и не предполагаются ни в одном из источников [1]-[6], ни в какой-либо их комбинации.

На заседании коллегии, состоявшемся 20.06.2025 (см. приложение №2

к протоколу заседания коллегии), лицом, подавшим возражение, к материалам возражения был приобщен более полный перевод источника информации [4].

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

С учетом даты подачи заявки (25.07.2024), правовая база для оценки патентоспособности заявленного изобретения включает Кодекс в редакции, действующей на дату подачи заявки, а также Правила составления, подачи и рассмотрения документов, являющихся основанием для совершения юридически значимых действий по государственной регистрации изобретений (далее – Правила ИЗ) утвержденные приказом Министерства экономического развития Российской Федерации от 21.02.2023 № 107, зарегистрированном в Минюсте РФ 17.04.2023, регистрационный № 73064, дата начала действия 29.04.2023, с изменениями, внесенными приказом Минэкономразвития России от 15 марта 2024 года № 148 «О внесении изменений в некоторые приказы Минэкономразвития России по вопросам государственной регистрации изобретения и полезной модели, а также проведения предварительного информационного поиска изобретения и полезной модели», зарегистрированным 13.05.2024 № 78120, опубликованным 15.05.2024, вступившим в силу с 25.05.2024 (далее - Правила ИЗ) и Требования к документам заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Минэкономразвития Российской Федерации от 21.02.2023 № 107, зарегистрированным в Минюсте РФ 17.04.2023 г., регистрационный №73064, с изменениями внесенными приказом Минэкономразвития России от 15.03.2024 года № 148 (далее – Требования ИЗ).

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 является новым, если оно не известно из уровня техники.

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

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

Согласно пункту 73 Правил ИЗ при проверке новизны изобретение признается новым, если установлено, что совокупность признаков изобретения, представленных в независимом пункте формулы изобретения, не известна из уровня техники, включающего сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения,

Согласно пункту 76 Правил ИЗ если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, соответствует условию новизны, осуществляется проверка изобретательского уровня изобретения. Проверка новизны зависимых пунктов не проводится.

Согласно пункту 79 Правил ИЗ, при проверке изобретательского уровня изобретение признается имеющим изобретательский уровень, если установлено, что оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

Проверка изобретательского уровня изобретения проводится без использования признаков, относящихся к объектам, не являющимся изобретениями в соответствии с пунктом 5 статьи 1350 Кодекса, если они не влияют на достижение технического результата.

Согласно пункту 80 Правил ИЗ, изобретение явным образом следует из уровня техники, если оно может быть признано созданным путем объединения, изменения или совместного использования сведений, содержащихся в уровне техники, и (или) общих знаний специалиста.

В частности, изобретение явным образом следует из уровня техники в том случае, когда выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с признаками, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы изобретения, отличается от наиболее близкого аналога (отличительными признаками), и подтверждена известность влияния этих отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 81 Правил ИЗ, проверка соблюдения условий, указанных в абзаце втором пункта 80 настоящих Правил, включает:

определение наиболее близкого аналога изобретения в соответствии с пунктом 41 Требований к документам заявки;

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 82 Правил ИЗ, изобретение признается для специалиста не следующим явным образом из уровня техники, если в ходе проверки не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния этих отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 83 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 84 Правил ИЗ условию изобретательского уровня соответствуют, в частности:

способы получения известных химических соединений (класса, группы) с установленной структурой, если они основаны на новой для данного класса или группы соединений реакции или на известной для данного класса или группы соединений реакции, условия проведения которой не известны, и они приводят к получению неожиданного технического результата при осуществлении способа;

Согласно пункту 86 Правил ИЗ, известность влияния отличительных признаков заявленного изобретения на технический результат может быть подтверждена как одним, так и несколькими источниками информации. Допускается использование аргументов, основанных на общих знаниях в конкретной области техники, без указания каких-либо источников информации.

Согласно пункту 88 Правил ИЗ если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, соответствует условию изобретательского уровня, проверка изобретательского уровня в отношении зависимых пунктов формулы не проводится.

Согласно пункту 41 Требований ИЗ в разделе описания изобретения "Уровень техники" приводятся сведения из предшествующего уровня техники, в том числе описываются известные заявителю аналоги - решения, имеющие назначение, совпадающее с назначением изобретения, с выделением аналога, которому присуща совокупность признаков, наиболее близкая к совокупности существенных признаков изобретения (прототип).

При описании каждого из аналогов изобретения непосредственно в тексте приводятся библиографические данные источника информации, в котором он раскрыт.

Приводится критика аналогов и прототипа, а именно указываются те недостатки аналогов и прототипа, над устранением которых работал изобретатель при решении технической проблемы (задачи).

В качестве недостатков прототипа могут быть указаны, в частности, конкретные неудовлетворительные значения параметров объекта-прототипа или неудовлетворительные характеристики объекта-прототипа, проявляющиеся при его использовании, ограниченная функциональность объекта-прототипа.

Указываются известные заявителю причины, препятствующие решению этой технической проблемы (задачи) и получению технического результата, обеспечиваемого изобретением, в аналогах и прототипе изобретения.

В разделе описания изобретения "Уровень техники" не должны приводиться пренебрежительные высказывания по отношению к решениям, разработанным другими лицами, заявкам или патентам других лиц.

Анализ доводов сторон, показал следующее.

Сведения, раскрытые в источниках информации [7], [8] не могут быть включены в уровень техники и привлечены к оценке патентоспособности изобретения по оспариваемому патенту поскольку данные источники информации не содержат данных, в том числе даты, свидетельствующих об общедоступности приведенной в них информации, до даты приоритета изобретения по оспариваемому патенту.

Изобретению по оспариваемому патенту предоставлена правовая охрана в объеме совокупности признаков, содержащихся в приведенной выше формуле.

В оспариваемом патенте описан способ получения (4R,12aS)-N-(2,4-дифторбензил)-7-гидрокси-4-метил-6,8-диоксо-3,4,6,8,12,12a-гексагидро-2H-пиридо[1',2':4,5]пиразино[2,1-b][1,3]оксазин-9-карбоксамида натрия (соединения формулы (II)) (далее – долутегравир натрия).

Способ осуществляется путем взаимодействия (4R,12aS)-N-(2,4-дифторбензил)-7-гидрокси-4-метил-6,8-диоксо-3,4,6,8,12,12a-гексагидро-2H-пиридо[1',2':4,5]пиразино[2,1-b][1,3]оксазин-9-карбоксамида (далее долутегравир) с гидроксидом натрия в смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно.

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

Патентный документ [1] относится к получению нового полиморфа долутегравира натрия, в частности полиморф типа ХМ-1, обладающего хорошей стабильностью.

В патентном документе [1], способ получения кристаллической формы ХМ-1 долутегравира натрия осуществляется путем взаимодействия долутегравира (основания) с гидроксидом натрия в системе растворителей метанол, дихлорметан (метиленхлорид) и этанол (см. экспериментальную часть).

При этом согласно параграфу [0120] объемное соотношение метанола и дихлорметана (метиленхлорида) может составлять 1~5:1~5, однако кроме метанола и дихлорметана (метиленхлорида), в способе получения кристаллической формы ХМ-1 в обязательном порядке присутствует еще один спирт, а именно этанол (см. также абзац [0095])

Так, в описании изобретения к патентному документу [1] (абзац [0095]), указано, что объемное соотношение спиртового растворителя и алканового растворителя составляет 1: (1-5), т.е. алканового растворителя в

известном способе всегда используют больше либо в равном количестве со спиртовым растворителем.

В частности, в описании изобретения к патентному документу [1] (абзацы [0117] и [0120]) долутегравир натрия растворяют в смеси метанола/дихлорметана, для которой и приведено соотношение, а гидроксид натрия присутствует в отдельном этанольном растворе. При этом согласно примерам (абзацы [0275] и [0279]), в каждом случае используют два разных спирта, а именно метанол и этанол.

Следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что ни в одном экспериментальном примере в патентном документе [1] в процессе солеобразования долутегравира натрия не используется система растворителей, состоящая из метиленхлорида и одного спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно.

В описании изобретения к оспариваемому патенту нет ни одного упоминания об использовании смеси спиртов. В изобретении по оспариваемому патенту долутегравир растворяют только в метиленхлориде, а гидроксид натрия в одном спирте (см. например с.50 описания).

Таким образом, изобретение по оспариваемому патенту отличается от способа, известного из патентного документа [1] использованием смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и единственного спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно.

Целесообразно отметить, что на стадии рассмотрения заявки на изобретение на этапе проведения экспертизы по существу патентный документ [1] также был выявлен в ходе патентного поиска, о чем говорит список источников информации, указанный на титульном листе патента.

При этом на заседании коллегии, состоявшемся 20.06.2025, представитель экспертного отдела пояснил, что при пересчете соотношений растворителей в способе, раскрытом в патентном документе [1], было

выявлено, что спирта в системе действительно используется больше и соотношение составляет порядка 1:11.

В соответствии с изложенным, следует констатировать, что изобретение по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности «новизна» (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

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

Согласно сведениям, приведенным на с.12 публикации описания изобретения к оспариваемому патенту: «Задачей настоящего изобретения является разработка новых улучшенных, экологически безвредных, безопасных способов очистки долутегравира, его интермедиатов и солей, а также способов получения интермедиатов долутегравира, долутегравира и его солей, с высоким выходом и чистотой целевого продукта, в том числе, стереоизомерной (энантиомерной и диастереомерной), в которых используются легко доступные реактивы и условия реакции, при помощи которых можно воспроизвести синтез в промышленном масштабе. При этом перед Авторами настоящего изобретения стояли задачи сократить этапы синтеза долутегравира, уменьшить временные и экономические затраты на его осуществление».

Таким образом, следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что техническим результатом изобретения по оспариваемому патенту является достижение высокого выхода и чистоты, в том числе солей долутегравира с повышенным профилем безопасности при проведении экологически безвредных, безопасных способов их получения.

При этом в описании изобретения к оспариваемому патенту (с.50-51, таблица 4) показано, что использование в данной реакции гидроксида натрия и смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и спирта в объемных

соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно, позволяет достичь чистоты более 99,8% при количественном выходе реакции (100%).

Таким образом, достижение указанного заявителем технического результата, в описании изобретения к оспариваемому патенту подтверждено.

Вместе с тем, следует согласиться с доводом лица, подавшего возражение, о том, что ближайшим аналогом изобретения по оспариваемому патенту является способ получения долутегравира натрия, известный из патентного документа [2].

В патентном документе [2] (примеры 3, 6, 8, 11) раскрыт способ получения долутегравира натрия, который осуществляется путем взаимодействия долутегравира основания с гидроксидом натрия в метанольном растворе в присутствии дихлорметана (метиленхлорид) и метанола в качестве растворителя.

При этом объемное соотношение дихлорметана к метанолу составило 1:1. Выход целевого долутегравира натрия составил примерно 94,5%, и его чистота составила 99,5%.

При этом следует обратить внимание на то, что согласно примерам, приведенным в описании изобретения к патентному документу [2], исходный долутеграбир подвергался дополнительной очистке перед началом синтеза.

Таким образом, признаками отличающими способ по оспариваемому патенту от технического решения, раскрытого в патентном документе [2], являются признаки, характеризующие использования смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00.

При этом, что касается сведений, раскрытых в источниках информации [3]-[6], представленных в возражении, то необходимо отметить следующее.

В патентном документе [3] описан пример (пример 22) синтеза натриевой соли долутегравира из долутегравира, в котором долутегравир взаимодействует с метоксидом натрия в метаноле.

Выход долутегравира натрия (согласно примеру 22) составляет 82,8% при чистоте 99,84%.

Таким образом, в патентном документе [3] не раскрыты и не предполагаются признаки, характеризующие использование смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, и, соответственно, влияние этих параметров на достижение указанного технического результата.

В патентном документе [4] описан способ получения долутегравира натрия, заключающийся во взаимодействии долутегравира основания с гидроксидом натрия в виде спиртового раствора (в метаноле) в смеси растворителей н-бутанола и метанола.

При этом сведений о чистоте полученного долутегравира натрия в патентном документе [4] не представлено.

Таким образом, в патентном документе [4] не раскрывается технических решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками изобретения по оспариваемому патенту, а именно использование смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно, в процессе получения долутегравира натрия с одновременно высоким выходом реакции и высокой чистотой конечного продукта.

В патентном документе [5] раскрыты процессы получения полиморфных форм L9, L-10, L-11 и L12 долутегравира натрия путем взаимодействия долутегравира с водным раствором гидроксида натрия, в различных растворителях, отличных от используемых в способе по оспариваемому патенту.

Так, в патентном документе [5] (с. 17-19) приведены примеры получения долутегравира натрия с раствором гидроксида натрия в изобутаноле, пентаноле или изопентаноле.

В примере 12 показаны результаты изучения стабильности полиморфной формы L9 долутегравира натрия, при этом определялась чистота по ВЭЖХ. При этом какую именно полиморфную форму L9, полученную в примере 1 или в примере 2, подвергали испытаниям на стабильность, в патентном документе [5] не раскрывается, как и не раскрывается каким методам обработки подвергалась форма L9 перед упаковкой в полиэтилен низкой плотности.

Таким образом, в патентном документе [5] используется иная система растворителей, которая при этом не позволяет получить конечный продукт, как с высоким выходом, так и с высокой чистотой одновременно.

В патентном документе [6] описаны примеры получения кристаллических форм M2 долутегравира натрия, при этом долутегравир натрия получали взаимодействием долутегравира с гидроксидом натрия в бутаноле или смеси метанола и бутанола (примеры 2 -6).

Между тем в примерах не указан выход и чистота конечного продукта.

В таблице 1 описания к патентному документу [6] показаны результаты изучения стабильности полиморфной формы M2 долутегравира натрия, где в качестве анализируемого образца изначально брали долутегравир натрия чистотой 99,7%. Каким способом была достигнута указанная чистота долутегравира натрия в патентном документе [6] не указано.

Таким образом, патентный документ [6] не раскрывает технических решений, в которых используется смесь растворителей, состоящая из метиленхлорида и спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно, в процессе получения долутегравира натрия с одновременно высоким выходом реакции и чистотой продукта.

Следует констатировать, что в патентных документах [3]-[6] не раскрыты признаки, характеризующие использование смеси растворителей, состоящей из метиленхлорида и спирта в объемных соотношениях 1,00:2,00 - 1,00:10,00, соответственно, в процессе получения долутегравира натрия с одновременно высоким выходом реакции и чистотой продукта.

Источники информации [7]-[9], представленные патентообладателем, носят информационный характер и к способам получения долутегравира натрия не относятся.

В соответствии с изложенным, следует констатировать, что в источниках информации [3]-[6] не раскрыты признаки, отличающие изобретение по оспариваемому патенту от наиболее близкого аналога [2].

Вместе с тем в патентном документе [2] описывающем способы получения полиморфа долутегравира натрия путем взаимодействия долутегравира с гидроксидом натрия в смеси метиленхлорида и метанола не дано какой-либо подсказки или мотивации для выбора оптимальных значений параметров для подбора соотношений растворителей в системе каким-либо методом, тем более не показана известность влияния этих параметров на технический результат, как это предписано в пункте 83 Правил ИЗ. Вместе с тем из источников информации [3]-[6] также не следует для специалиста чем следует руководствоваться и какой стратегии придерживаться для оптимизации процесса получения долутегравира натрия с достижением одновременно высокого выхода и высокой частоты.

Таким образом, изобретение по оспариваемому патенту не следует для специалиста явным образом из уровня техники, в ходе проверки не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, и, соответственно, не подтверждена известность влияния этих отличительных признаков на указанный заявителем технический результат (пункт 82 Правил ИЗ).

Таким образом, можно констатировать, что в возражении не содержится доводов, позволяющих сделать вывод о несоответствии изобретения по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 26.02.2025, патент Российской Федерации на изобретение № 2826748 оставить в силе.