

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

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 Гражданского кодекса Российской Федерации (далее – Кодекс) и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение компании ЭВОНИК РЕМ ГМБХ КИРШЕНАЛЛЕЕ, ФРГ (далее – заявитель), поступившее 17.07.2015 на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее – Роспатент) от 20.01.2015 об отказе в выдаче патента на изобретение по заявке № 2012140651/15, при этом установлено следующее.

Заявлена группа изобретений «Фармацевтический или нутрицевтический состав», совокупность признаков которой изложена в уточненной формуле, представленной в корреспонденции от 04.12.2014, поступившей 05.12.2014, в следующей редакции:

«1. Фармацевтический состав, который содержит ядро, содержащее активный фармацевтический ингредиент, промотор проникновения и агент, промотирующий биодоступность, и полимерное покрытие для нацеленного высвобождения активного ингредиента в желудочно-кишечном тракте, отличающийся тем, что агент, промотирующий биодоступность, является фармацевтически приемлемым ингибитором протеолитических ферментов, который повышает биодоступность активного ингредиента по меньшей мере в 5 раз по сравнению с аналогичным составом без агента, промотирующего биодоступность и что ингибитором протеолитических ферментов является

ингибитор Баумана-Бирка или его производное и что активный ингредиент представляет собой белок или пептид, полисахарид или природное или синтетическое производное этих веществ и что промотор проникновения представляет собой сополимер, состоящий на 30%-80% масс.% из C_1 - C_4 -алкильных эфиров акриловой или метакриловой кислоты и на 70-20 мас.% из алкил(мет)акриловых мономеров, имеющих четвертичную аминогруппу в алкильном радикале и что ядро содержит синхронизирующий слой.

2. Состав по п. 1, отличающийся тем, что активный ингредиент является биологического происхождения и добавлен ингибитор, который предотвращает или снижает ферментативное разложение активного ингредиента.

3. Состав по п. 1, отличающийся тем, что активный ингредиент представляет собой десмопрессин или его производное либо гепарин или его производное.

4. Состав по п. 1, отличающийся тем, что состоящий из множества частиц фармацевтический состав содержит множество частиц в одной дозированной единице.

5. Состав по п. 1, отличающийся тем, что количество агента, промотирующего биодоступность, в готовом составе находится в диапазоне от 0,1 до 10 мас.%.

6. Состав по п. 1, отличающийся тем, что синхронизирующий слой содержит вплоть до 90 мас.% полного количества агента, промотирующего биодоступность.

7. Состав по п. 1, отличающийся тем, что полимерное покрытие для нацеленного высвобождения активного ингредиента в желудочно-кишечном тракте содержит анионный целлюлозный полимер или анионный (мет)акриловый сополимер.

8. Состав по одному или более из пп. 1-7, отличающийся тем, что активный ингредиент является анионным и что ионных взаимодействий между активным ингредиентом и промотором проникновения удастся избежать за счет

- либо избыточного количества промотора проникновения в смеси обоих компонентов в одном и том же отделе состава;
- либо местного разделения обоих компонентов по разным отделам состава;
- либо добавления солей, амфифильных полимеров или связывающих водород неионных полимеров к смеси обоих компонентов в одном и том же отделе состава.

9. Применение агента, промотирующего биодоступность, который является фармацевтически приемлемым ингибитором протеолитических ферментов, в качестве наполнителя, который увеличивает пероральную биодоступность активного ингредиента в составе согласно одному или более из пп. 1-8».

Данная формула изобретения была принята к рассмотрению при экспертизе заявки по существу.

По результатам рассмотрения Роспатент принял решение об отказе в выдаче патента, мотивированное несоответствием заявленной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень» в свете известности из уровня техники следующих источников информации:

- заявка США № 2008026051 A1, 31.01.2008 (далее –[1]);
- заявка США № 20080274945 A1, 06.11.2008 (далее –[2]);
- международная заявка WO 2010007515 A1, 21.01.2010 (далее –[3]);
- заявка США № 2007026082 A1, 01.02.2007 (далее –[4]).

В решении отмечено, что с учетом ближайшего аналога, раскрытого в заявке [1] отличительный признак, касающийся возможности совместного использования промотора проникновения и ингибитора ферментов в составе ядра, известен из заявки [4].

В возражении, поданном в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса, заявитель просит принять к рассмотрению скорректированную формулу изобретения, с учетом приведенных в решении аргументов и ее уточнения путем «сужения широких признаков» независимого пункта 1 формулы – «белок или пептид, полисахарид или природное или синтетическое производное этих веществ» и «синхронизирующий слой».

Скорректированная формула приложена к возражению

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

С учетом даты международной подачи заявки (25.02.2010), переведенной на национальную фазу 25.09.2012, правовая база для оценки патентоспособности заявленного предложения включает Кодекс, Административный регламент исполнения Федеральной службой по интеллектуальной собственности, патентам и товарным знакам государственной функции по организации приема заявок на изобретение и их рассмотрения, экспертизы и выдачи в установленном порядке патентов Российской Федерации на изобретение, утвержденного приказом Министерства образования и науки РФ от 29 октября 2008 № 327, зарегистрированного в Минюсте РФ 20 февраля 2009, рег. № 13413 (далее – Регламент 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 имеет изобретательский уровень, если для специалиста оно явным образом не следует из уровня техники. Уровень техники включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

В соответствии с подпунктом 1 пункта 10.8 Регламента ИЗ формула изобретения предназначается для определения объема правовой охраны, предоставляемой патентом.

Согласно подпункту 1 пункта 24.5.3 Регламента, 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.

Согласно подпункту 7 пункта 24.5.3 Регламента, в случае, когда установлено, что указанный заявителем технический результат не достигается,

подтверждения известности влияния отличительных признаков на технический результат не требуется.

Согласно пункту 4.9 Правил ППС при рассмотрении возражения коллегия палаты по патентным спорам вправе предложить лицу, подавшему заявку на выдачу патента на изобретение, внести изменения в формулу изобретения, если эти изменения устраняют причины, послужившие единственным основанием для вывода о несоответствии рассматриваемого объекта условиям патентоспособности.

Согласно пункту 5.1 Правил ППС в случае отмены оспариваемого решения при рассмотрении возражения, принятого без проведения информационного поиска или по результатам поиска, проведенного не в полном объеме, а также в случае, если патентообладателем по предложению палаты по патентным спорам внесены изменения в формулу изобретения, решение Палаты по патентным спорам должно быть принято с учетом результатов дополнительного информационного поиска, проведенного в полном объеме.

Сущность изобретения выражена в приведенной выше формуле.

Анализ доводов, содержащихся в решении Роспатента и доводов возражения, касающихся оценки соответствия заявленного изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Согласно формуле, заявлена группа из двух изобретений: по независимому пункту 1 формулы предложен фармацевтический состав; по независимому пункту 9 формулы предложено применение агента по пункту 1, промотирующего биодоступность в качестве наполнителя.

В качестве ближайшего аналога по отношению к независимым пунктам 1, 9 формулы рассматривается известный из заявки [1] фармацевтический состав, включающий ядро с активным веществом (агент). Данное вещество или агент используется в качестве наполнителя. Ядро покрыто кишечнорастворимым метакрилатным сополимером, где между ядром и покрытием из кишечнорастворимого полимера находится разделительный слой, включающий водорастворимый пленкообразующий полимер (пункт 1 формулы). При этом,

помимо активного агента (белок, нуклеиновая кислота и др., в частности, десмопрессин или гепарин) ядро может содержать промотор проникновения и ингибитор Баумана-Бирка (пункты 19, 20, 21 формулы; параграфы 0051, 0207). В качестве промотора проникновения в известной из заявки [1] композиции может быть взят Eudragit E PO (параграф 0049), который согласно настоящему изобретению, является катионным полимером и образован на 25 мас.% из метил метакрилата, на 25 мас.% из бутил метакрилата и на 50 мас.% из диметиламиноэтил метакрилата (стр. 24 описания). В качестве кишечнорастворимого полимера в ближайшем аналоге используется анионный метакрилатный сополимер Eudragit L 30 D-55 (параграфы 0059, 0066). При этом агент

Отличием изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1 и 9 формулы от ближайшего аналога является использование промотора проникновения и ингибитора ферментов совместно в составе ядра.

Технический результат заключается в повышении пероральной биодоступности активного ингредиента. Однако, в связи с тем, что эффект *in vivo* выше по сравнению с результатами *in vitro*, то эффект повышения пероральной биодоступности активного ингредиента не может быть объяснен только простым защитным эффектом ингибитора протеолитических ферментов по отношению к панкреатическим ферментам. Заявитель не демонстрирует примеров, подтверждающих достижение технического результата для всего состава. То есть, заявителем не доказано достижение технического результата для группы изобретений по пунктам 1, 9 в той степени обобщения, в которой они заявлены. В данном случае подтверждения известности влияния отличительных признаков на технический результат не требуется (подпункт 7 пункта 24.5.3 Регламента).

Целесообразно отметить, что, согласно материалам заявки технический результат доказан заявителем только для композиции с десмопрессином. Так, например, для такой композиции проведено исследование *in vivo* и показано увеличение ее биодоступности в 7 раз (см. пример 16, табл. 8).

При этом отличительный признак (прием использования промотора проникновения и ингибитора ферментов совместно в составе ядра) известен из заявки [4]. Так, в примере 3 данной заявки [4] раскрыты покрытые оболочкой пеллеты, при изготовлении которых готовят липофильную фазу, включающую активный агент и промотор проникновения токоферол (параграф 0034), которую затем гранулируют с помощью раствора, содержащего соевый ингибитор трипсина. После этого полученные влажные ядра сушат и наносят на них покрытие (пример 3).

Таким образом, для специалиста в данной области является очевидным одновременное использование в составе ядра промотора проникновения и ингибитора ферментов.

На основании изложенного можно сделать вывод о том, что в решении Роспатента содержатся доводы, позволяющие признать группу изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1, 9 формулы несоответствующими условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Заявитель обратился с просьбой предоставить ему возможность скорректировать формулу изобретения с учетом приведенных в решении Роспатента доводов и представленных в описании заявки сведений о том, что «синхронизирующий слой представляет собой слой, расположенный под полимерным покрытием, который синхронизирует растворение активного ингредиента и агента, промотирующего биодоступность, и который содержит вплоть до 90 мас.% от полного количества агента, промотирующего биодоступность».

Заявитель отмечает, что синхронизирующий слой подробно показан в примере 5 описания к заявке, а технический результат при этом доказан для композиций с десмопрессином.

В связи с этим, признак формулы «белок или пептид, полисахарид или природное или синтетическое производное этих веществ» может быть ограничен до «десмопрессина или его производного».

На заседании коллегии (12.04.2016) заявитель в соответствии с пунктом 4.9 Правил ППС воспользовался предоставленным ему правом уточнить свои притязания и представил уточненную формулу изобретения (см. приложение к данному заключению) с учетом тех доводов, которые были представлены в решении Роспатента.

Коллегия приняла к рассмотрению данную формулу.

На основании пункта 5.1 Правил ППС материалы заявки были направлены на дополнительный поиск.

По результатам проведенного поиска 09.02.2016 был представлен отчет и заключение экспертизы, согласно которым изобретение по уточненной заявителем формуле удовлетворяет всем условиям патентоспособности, предусмотренным пунктом 1 статьи 1350 Кодекса.

Таким образом, каких-либо обстоятельств, препятствующих признанию заявленной группы изобретений патентоспособной в объеме упомянутой выше уточненной формулы, не выявлено.

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

удовлетворить возражение, поступившее 17.07.2015, отменить решение Роспатента от 20.01.2015 и выдать патент Российской Федерации на изобретение с уточненной заявителем формулой изобретения по заявке № 2012140651/15 .

(21) 2012140651/15

(51)МПК

A61 K 38/56(2006.01)

A61 K 38/12 (2006.01)

A61 K 9/22 (2006.01)

A61 K 47/30 (2006.01)

(57)

«1.Фармацевтический состав, который содержит ядро, содержащее активный фармацевтический ингредиент, промотор проникновения и агент, промотирующий биодоступность, и полимерное покрытие для нацеленного высвобождения активного ингредиента в желудочно-кишечном тракте, отличающийся тем, что агент, промотирующий биодоступность, является фармацевтически приемлемым ингибитором протеолитических ферментов, который повышает биодоступность активного ингредиента, по меньшей мере, в 5 раз по сравнению с аналогичным составом без агента, промотирующего биодоступность, и что ингибитором протеолитических ферментов является ингибитор Баумана-Бирка или его производное и что активный ингредиент представляет собой десмопрессин или его производное, и что промотор проникновения представляет собой сополимер, состоящий на 30%-80% масс.% из C₁-C₄-алкильных эфиров акриловой или метакриловой кислоты и на 70-20 мас.% из алкил(мет)акриловых мономеров, имеющих четвертичную аминогруппу в алкильном радикале, и что ядро содержит слой, расположенный под полимерным покрытием, который синхронизирует растворение активного ингредиента и агента, промотирующего

биодоступность, и который содержит вплоть до 90 мас.% от полного количества агента, промотирующего биодоступность.

2. Состав по п. 1, отличающийся тем, что добавлен ингибитор, который предотвращает или снижает ферментативное разложение активного ингредиента.

3. Состав по п. 1, отличающийся тем, что состоящий из множества частиц фармацевтический состав содержит множество частиц в одной дозированной единице.

4. Состав по п. 1, отличающийся тем, что количество агента, промотирующего биодоступность, в готовом составе находится в диапазоне от 0,1 до 10 мас.%.

5. Состав по п. 1, отличающийся тем, что полимерное покрытие для нацеленного высвобождения активного ингредиента в желудочно-кишечном тракте содержит анионный целлюлозный полимер или анионный (мет)акриловый сополимер.

6. Состав по одному или более из пп. 1-71, отличающийся тем, что активный ингредиент является анионным и что ионных взаимодействий между активным ингредиентом и промотором проникновения удается избежать за счет

- либо избыточного количества промотора проникновения в смеси обоих компонентов в одном и том же отделе состава;

- либо местного разделения обоих компонентов по разным отделам состава;

- либо добавления солей, амфифильных полимеров или связывающих водород неионных полимеров к смеси обоих компонентов в одном и том же отделе состава.

7. Применение агента, промотирующего биодоступность, который является фармацевтически приемлемым ингибитором протеолитических ферментов, в качестве наполнителя, который увеличивает пероральную

биодоступность активного ингредиента в фармацевтическом составе согласно одному или более из пп. 1-6».

(56) US 2008026051 A1, 31.01.2008;
US 20080274945 A1, 06.11.2008
WO 2010007515 A1, 21.01.2010;
US 2007026082 A 1, 01.02.2007.

Примечание: при публикации сведений о выдаче патента будет использовано описание, представленное на дату подачи заявки.