

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 Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации и отдельные законодательные акты Российской Федерации» (далее - Кодекс) и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденные приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020, регистрационный № 59454, опубликованными на официальном интернет-портале правовой информации www.pravo.gov.ru, 26.08.2020, № 0001202008260011, дата вступления в силу 06.09.2020 (далее – Правила ППС), рассмотрела поступившее 15.03.2021 возражение от компании КРКА, д.д., Ново Место, Словения (далее – лицо, подавшее возражение), против выдачи патента Российской Федерации на изобретение № 2483716, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2483716 на группу изобретений "Новый состав" с конвенционным приоритетом от 29.09.2005, установленным по дате подачи заявки US 60/722,624, выдан gj pfzdr # 2008116316/15 на имя компании Новартис АГ (CH) (далее - патентообладатель).

Патент выдан со следующей формулой изобретения:

«1. Фармацевтическая композиция, которая в качестве активных ингредиентов включает:

1) от 1,5 до 20% вилдаглиптина или его фармацевтически приемлемой соли, или

2) от 80 до 98,5% метформина или его фармацевтически приемлемой соли,

при этом активные ингредиенты соответствуют от 60 до 98% композиции, и в которой метформин находится в форме гранул, содержащих от 1 до 20 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента, выбранного из целлюлозы и ее производных.

2. Фармацевтическая композиция по п. 1, представляющая собой таблетку.

3. Фармацевтическая композиция по п. 1, представляющая собой таблетку, полученную прямым прессованием.

4. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой гранулы содержат от 3 до 13 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

5. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой гранулы содержат от 4,9 до 12 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

6. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой гранулы содержат от 7,5 до 10,5 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

7. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой гранулы содержат от 7,5 до 17,5 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

8. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой гранулы содержат от 12,5 до 17,5 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

9. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой связующий агент выбирают из группы, включающей микрокристаллическую целлюлозу, гидроксипропилцеллюлозу, гидроксипропилметилцеллюлозу и гидроксипропилметилцеллюлозу.

10. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которую добавляют по крайней мере один стандартный фармацевтический приемлемый эксципиент.

11. Фармацевтическая композиция по п. 9, в которую добавляют по крайней мере один стандартный фармацевтический приемлемый эксципиент.

12. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой фармацевтический приемлемый эксципиент выбирают из группы, включающей связующие агенты, разбавители, дезинтегрирующие агенты, замасливатели, твердые наполнители и носители.

13. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в форме таблетки, полученная прямым прессованием гранул метформина в комбинации с вилдаглиптином и необязательно по крайней мере одним фармацевтически приемлемым эксципиентом.

14. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, содержащая не более 25 или 20 мас.% фармацевтически приемлемого эксципиента, включая связующий агент в расчете на массу сухого эксципиента.

15. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, содержащая не более 15 мас.% фармацевтически приемлемого эксципиента, включая связующий агент в расчете на массу сухого эксципиента.

16. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, включающая:

1) от 1 до 12 мас.% фармацевтически приемлемого связующего агента в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента и необязательно от 0,1 до 10 мас.% дополнительного фармацевтически приемлемого эксципиента, или

2) от 7,5 до 17,5 мас.% или от 12,5 до 17,5 мас.% фармацевтически приемлемого связующего агента в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента и необязательно от 0,1 до 10 мас.% дополнительного фармацевтически приемлемого эксципиента в расчете на массу сухого дополнительного фармацевтического эксципиента.

17. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, включающая от 7,5 до 17,5 мас.% фармацевтически приемлемого связующего агента в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента и необязательно от 0,1 до 10 мас.% дополнительного фармацевтически приемлемого эксципиента в расчете на массу сухого дополнительного фармацевтического эксципиента.

18. Фармацевтическая композиция по п. 11 в форме таблетки, в которой другим фармацевтически приемлемым эксципиентом является замасливатель.

19. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3 в форме таблетки, включающая от 0,1 мас.% до 5 мас.% фармацевтически приемлемого замасливателя в расчете на массу композиции.

20. Фармацевтическая композиция по п. 18, включающая от 0,5 мас.% до 1,5 мас.% фармацевтически приемлемого замасливателя в расчете на массу композиции.

21. Фармацевтическая композиция по п. 19, в которой замасливателем является стеарат магния.

22. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой гранулы метформина получают влажной грануляцией или грануляцией из расплава в смеси со связующим агентом.

23. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой гранулы метформина получают влажной грануляцией из воды или растворителя, который выбирают из группы, включающей этанол, изопропанол, этилацетат, гликофуrol или пропиленгликоль.

24. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой вилдаглиптин присутствует в форме частиц.

25. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой вилдаглиптин присутствует в форме частиц, в которой по крайней мере 40% вилдаглиптина присутствует в форме частиц, распределение которых по размеру составляет менее 250 мкм.

26. Фармацевтическая композиция по п. 25, в которой по крайней мере 40% вилдаглиптина присутствует в форме частиц, распределение которых по размеру составляет от 10 до 250 мкм.

27. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой заполняют капсулу или которую получают в форме таблетки, прессованной таблетки или таблетки, полученной прямым прессованием.

28. Фармацевтический состав по п. 1, 2 или 3 в форме таблетки, полученной прямым прессованием гранул метформина в смеси с вилдаглиптином и необязательно по крайней мере одним фармацевтически приемлемым эксципиентом.

29. Фармацевтическая композиция по п. 1, где состав входит в один из слоев двухслойной или трехслойной таблетки.

30. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, включающая:

1) от 25 до 100 мг вилдаглиптина или его фармацевтически приемлемой соли, или

2) 25 мг, 50 мг или 100 мг вилдаглиптина или его фармацевтически приемлемой соли.

31. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, включающая:

1) от 50 до 2000 мг метформина или его фармацевтически приемлемой соли.

32. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, включающая:

1) 25 мг вилдаглиптина и 250 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей,

2) 25 мг вилдаглиптина и 500 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей,

3) 25 мг вилдаглиптина и 850 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей,

4) 25 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей,

5) 50 мг вилдаглиптина и 500 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей,

6) 50 мг вилдаглиптина и 850 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей, или

7) 50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей.

33. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, включающая дополнительный активный ингредиент, которым являются сульфонилмочевины или глитазон, такой как пиоглитазон или розиглитазон.

34. Способ получения фармацевтической композиции, содержащей ингибитор DPP-IV, которым является вилдаглиптин или его фармацевтически приемлемая соль и метформин или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей по любому из пп. 1-3, включающий:

1) грануляцию метформина и связующего агента,

2) высушивание гранул, содержащих метформин и связующий агент,

3) смешивание лекарственной субстанции ингибитора DPP-IV с гранулами, содержащими метформин и связующий агент,

4) необязательно смешивание замасливателя, например стеарата магния со смесью, полученной на стадии 3).

35. Способ по п. 34 получения фармацевтической таблетки, содержащей ингибитор DPP-IV и метформин или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей, включающий:

1) грануляцию метформина и связующего агента,

- 2) высушивание гранул, содержащих метформин и связующий агент,
- 3) смешивание лекарственной субстанции ингибитора DPP-IV с гранулами, содержащими метформин и связующий агент,
- 4) необязательное смешивание замасливателя, например стеарата магния со смесью, полученной на стадии 3),
- 5) прессование полученной смеси в таблетку с получением стандартной дозированной лекарственной формы.

36. Способ по п. 34, при осуществлении которого на стадии 2) гранулы высушивают до величины потерь воды при высушивании (LOD) 0,5-3,5%, предпочтительно 1,5-2,4%.

37. Способ по п. 35, где в перемешиваемую смесь на стадии 1) или стадии 3) добавляют по крайней мере один дополнительный фармацевтически приемлемый эксципиент.

38. Способ по п. 37, где дополнительным фармацевтически приемлемым эксципиентом является разбавитель или дезинтегрирующий агент.

39. Способ по п. 35, где проводят дополнительную стадию нанесения покрытия на таблетку, полученную на стадии 5).

40. Способ по п. 35, при осуществлении которого стадией грануляции 1) является грануляция из расплава или влажная грануляция.

41. Способ по п. 35, который включает стадию грануляции 1), в процессе которой смешивают метформин и связующий агент и смесь пропускают через экструдер для грануляции из расплава.

42. Способ по п. 41, при осуществлении которого температура в экструдере в зоне смешения составляет от 140°C до 220°C или от 155°C до 205°C или от 170°C до 190°C.

43. Способ по п. 35, при осуществлении которого в качестве связующего агента используют целлюлозу или ее производное, выбранные из группы, включающей микрокристаллическую целлюлозу,

гидроксипропилцеллюлозу, гидроксиэтилцеллюлозу и гидроксипропилметилцеллюлозу.

44. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-3, в которой в качестве метформина используют гидрохлорид метформина, а в качестве ингибитора DPP-IV используют вилдаглиптин или его фармацевтически приемлемую соль.

45. Фармацевтический состав по любому из пп. 1-3 в форме таблетки, который характеризуется следующими параметрами:

- твердость составляет от 60 до 340 Н,
- ломкость составляет менее 0,8%, и
- толщина таблетки составляет от 4,5 до 8,3 мм.

46. Таблетка по п. 45, которая характеризуется следующими параметрами:

- твердость составляет от 60 до 340 Н,
- ломкость составляет менее 0,8%, и
- толщина таблетки составляет от 4,5 до 8,3 мм, и
- по крайней мере 70% вилдаглиптина растворяется в течение 30 мин по данным лопастного метода анализа, и
- по крайней мере 80% гидрохлорида метформина растворяется в течение 45 мин по данным лопастного метода анализа».

Против выдачи данного патента, в соответствии с пунктом 2 статьи 1398 Кодекса, поступило возражение, мотивированное несоответствием группы изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость», «изобретательский уровень».

К возражению приложены следующие источники информации:

- международная публикация WO 2001/52825, опубл. 26.07.2001, с переводом на русский язык (далее – [1]);

- публикация заявки на изобретение US 2001/0024659, опубл. 27.09.200, с переводом на русский язык (далее – [2]);
- публикация патента на изобретение US 6117451, опубл. 12.09.2000, с переводом на русский язык (далее – [3]);
- публикация заявки на изобретение US 2003/104049, опубл. 5.06.2003, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [4]);
- статья B. Ahren et al. Improved meal-related beta-cell function and insulin sensitivity by the dipeptidyl peptidase-IV inhibitor vildagliptin in metformin-treated patients with type 2 diabetes over 1 year // Diabetes Care, August 2005, vol. 28, No. 8, pp. 1936-1940, с переводом на русский язык (далее – [5]);
- публикация патента на изобретение US 5955106, опубл. 21.09.1999, с переводом на русский язык (далее – [6]);
- международная публикация WO 2005/067976, опубл. 28.07.2005, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [7]);
- публикация патента на изобретение GB 2399015, опубл. 8.09.2004, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [8]);
- международная публикация WO 2002/028181, опубл. 11.04.2002, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [9]);
- статья M.C. Gohel, P.D. Jogani. Exploration of melt granulation technique for the development of coprocessed directly compressible adjuvant containing lactose and microcrystalline cellulose // Pharm Dev Technol., 2003, vol. 8, No. 2, pp. 175-185, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [10]);
- публикация патента на изобретение US 6660300 опубл. 09.12.2003, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [11]);
- публикация заявки на изобретение US 2005/0053661 опубл. 10.03.2005, с переводом на русский язык релевантных частей (далее – [12]).

Суть содержащихся в возражении доводов в отношении условия патентоспособности «промышленная применимость» сводится к следующему.

Формулировка признаков независимого пункта 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту «Фармацевтическая композиция, которая в качестве активных ингредиентов содержит вилдаглиптин или метформин, или его фармацевтически приемлемую соль», указывает на наличие альтернативного выбора между вилдаглиптином и метформином. Однако, такое изложение признаков находится в противоречии с пунктами формулы 13, 28, 32, 34, 35, 44, в которых говорится исключительно об их совместном применении в одной композиции. В связи с этим, выбор какого-либо одного вещества в качестве активного ингредиента не позволяет изобретению по оспариваемому патенту учитывать совместное их использование, как в общем виде, так и с определенным их процентным соотношением и приводит к промышленной неприменимости, вследствие невозможного использования этих веществ одновременно в одной композиции.

Согласно пункту 35 формулы изобретения по оспариваемому патенту лекарственным средством в таблетке являются ингибитор DPP-IV и метформин. При этом в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента говорится, что их суммарное содержание составляет от 60% до 98 % в композиции, а содержание вилдаглиптина в лекарственном средстве составляет от 1,5 до 20%. Однако, приведенное содержание 25 % вилдаглиптина не совпадает ни с суммарным содержанием активных ингредиентов в композиции, ни с содержанием вилдаглиптина в композиции качестве единственного «лекарственного средства».

В описании оспариваемого патента не приведено сведений о получении таблетки из фармацевтической композиции с использованием сухого и влажного гранулирования, так как гранулирование применяют только при изготовлении одного из компонентов таблетки, а именно, метформина, а саму таблетку из композиции вилдаглиптина и гранул метформина изготавливают методом прямого прессования.

В описании изобретения по оспариваемому патенту отсутствуют доказательства преимуществ использования вилдаглиптина и метформина в виде «фиксированной композиции» (т.е. объединенных в одной лекарственной форме, например, таблетке) по сравнению с их использованием в «нефиксированной композиции» (т.е. объединенных в отдельных лекарственных формах, например, в разных таблетках), использования метформина в виде гранул при заполнении капсул, а также возможности применения способов сухого гранулирования, прямого прессования и влажного гранулирования в качестве альтернативных вариантов для изготовления таблеток, обеспечивающих получение одинакового технического результата для всех заявленных диапазонов содержания активных ингредиентов и эксципиентов в композиции.

В описании группы изобретений по оспариваемому патенту отсутствуют соответствующее экспериментальное подтверждение возможности и целесообразности реализации назначения частных форм реализации признаков, приведенных в ряде зависимых пунктов формулы, в частности, в пунктах 23 - 25 формулы изобретения по оспариваемому патенту.

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

В публикации [1] раскрыта фармацевтическая композиция, содержащая вилдаглиптин и метформин, с указанием диапазона содержания активных элементов в композиции и возможных соотношений между вилдаглиптином и метформином, которые практически полностью совпадают с диапазонами соотношений, приведенными в независимом пункте 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту, и с использованием дополнительного противодиабетического соединения в виде гранул и выполнением лекарственных форм в виде таблетки или капсул.

Кроме того, из публикации [1] известно, что фармацевтические препараты получают таким же способом, который охарактеризован в формуле оспариваемого патента, а именно с помощью обычных процессов смешения, грануляции, нанесения сахарного покрытия, растворения или лиофилизации.

По мнению лица, подавшего возражение, из приведенных в публикации [1] сведений, известно: фармацевтическая композиция, содержащая ингибитор дипептидилпептидазы-IV (DPP-IV - вилдаглиптин) и, по меньшей мере, одно дополнительное противодиабетическое соединение; изготовление заявленной фармацевтической композиции в виде стандартной лекарственной формы, представляющей собой фиксированную комбинацию в виде одной таблетки или капсулы; использование в фармацевтической композиции и таблетке в качестве ингибитора DPP-IV - вилдаглиптина, а в качестве дополнительного противодиабетического соединения - метформина или натеглинида; использование для получения заявленных фармацевтических препаратов известных способов, например, обычных процессов смешения, грануляции, путем объединения активного ингредиента с твердыми носителями, при желании грануляции полученной смеси и обработки смеси или гранул, если желательно или необходимо, после добавления подходящих наполнителей с получением таблеток или покрытых сахаром ядра таблетки; изготовление дополнительного противодиабетического соединения композиции в виде гранул, получаемых влажным гранулированием; пример изготовления таблеток, содержащих гранулы натеглинида, полученные методом влажного гранулирования с последующим добавлением и смешением стеарита магния с гранулами и прессование полученной смеси в таблетку; возможность добавления дополнительных ингредиентов в композицию после грануляции натеглинида, но до осуществления прессования смеси.

Следовательно, из публикации [1] известен способ изготовления фармацевтической композиции, предназначенной для профилактики и лечения состояний, опосредованных DPP-IV, в частности, сахарного диабета 2 типа, содержащей вилдаглиптин и в качестве дополнительного активного ингредиента метформин.

По мнению лица, подавшего возражение, отличием способа, известного из публикации [1], от способа, предложенного в пунктах 34, 35 формулы оспариваемого патента, является то, что в примере реализации известного из публикации [1] способа, в качестве дополнительного активного ингредиента использовался натеглинид, а в оспариваемом патенте – метформин. Однако, поскольку натеглинид проявляет такие же свойства, как и метформин, то для специалиста очевидно использование в композиции метформина в качестве дополнительного активного ингредиента, исходя из совокупности сведений, представленных в источниках информации [2], [6], [8]-[11].

В возражении дается обзор сведений, содержащихся в источниках информации [2]-[11], и делается вывод о том, что на дату приоритета изобретения по оспариваемому патенту уже было известно о получении положительного эффекта при объединении в комбинированном противодиабетическом препарате как вилдаглиптина с метформином, так и метформина с вилдаглиптином, о способах гранулирования метформина с использованием методов влажного и сухого гранулирования, а также грануляции из расплава, известны способы изготовления таблеток из гранул метформина и таблеток из порошка вилдаглиптина методом прямого прессования, известны способы изготовления таблеток с комбинированным составом, включающим два противодиабетических ингредиента, методом прямого прессования порошка вилдаглиптина с гранулами добавляемого противодиабетического ингредиента, получаемых известными методами, известны эксципиенты, добавляемые в фармацевтические композиции для улучшения прессуемости и физических характеристик таблеток.

По мнению лица, подавшего возражение, все признаки, приведенные в независимых пунктах 1, 34, а также в зависимых от них пунктах формулы, известны из предшествующего уровня техники, в связи с чем, группа изобретений по оспариваемому патенту известна и/или с очевидностью для специалиста следует из источников информации [1]-[12].

Материалы возражения в установленном порядке были направлены в адрес патентообладателя, который представил 28.05.2021 отзыв по мотивам возражения.

К отзыву приложены следующие материалы:

- уточненная формула изобретения (приложение 1);
- запрос Роспатента по заявке №2008116316 от 5 октября 2010 (приложение 2);
- Чуешов В.И. Промышленная технология лекарств. Том 2. - Х: МТК-Книга; Издательство НФАУ, 2002. с.716 (приложение 3);
- Решение Суда по интеллектуальным правам от 25.01.2021 по делу № СИП-628/2017 (приложение 4).

Патентообладатель обращает внимание на то, что ключевая техническая особенность фармацевтической композиции по оспариваемому патенту, включающей комбинацию вилдаглиптина и метформина с высоким содержанием активных ингредиентов, состоит в гранулировании метформина вместе со связующим агентом и с последующим смешиванием гранул с вилдаглиптином. При этом было “неожиданно обнаружено, что для получения таблеток по изобретению может быть использована технология грануляции из расплава”.

Техническим результатом изобретения по оспариваемому патенту является получение таблеток с улучшенными свойствами, например, ломкостью и устойчивостью активных компонентов, меньшим содержанием влаги в составе, пригодным временем распада и высокими дисперсионными свойствами. Наличие данных технических результатов для оспариваемого

изобретения было установлено в запросе Роспатента от 5 октября 2010 г. (Приложение 2).

При этом патентообладатель отмечает, что объем правовой охраны независимого пункта 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту касается фармацевтической композиции, включающей в качестве активных ингредиентов комбинацию от 1,5 до 20% вилдаглиптина и от 80 до 98,5% метформина или их фармацевтически приемлемых солей, но не указанных активных ингредиентов по отдельности.

В отзыве отмечено, что изобретению по оспариваемому патенту предоставлена правовая охрана в рамках пунктов 1-46 формулы изобретения, пункты 1 и 34 которой являются независимыми.

По мнению патентообладателя, изобретение по оспариваемому патенту соответствует условию патентоспособности “промышленная применимость”, поскольку отвечает всем требованиям, предъявляемым действующим законодательством.

При этом патентообладатель обращает внимание на то, что фармакологическая активность таблеток обусловлена следующими действующими веществами: вилдаглиптином (LAF237), который раскрыт в уровне техники в качестве ингибитора ДПП-IV, пригодного для лечения состояний, опосредуемых ингибированием ДПП-IV (например, релевантные источники приведены на с.9, строки 6-11, с. 11, строки 22-29 описания к оспариваемому патенту), и метформином, известным из уровня техники для снижения уровня глюкозы в крови пациентов, страдающих инсулиннезависимым сахарным диабетом (релевантные источники приведены на с.4, строки 4-34 описания к оспариваемому патенту).

По мнению патентообладателя, в возражении отсутствуют сведения, свидетельствующие, что при каком-либо из соотношений LAF237/метформин необходимая прессуемость не достигается.

В отзыве отмечено, что довод лица, подавшего возражение, о необходимости приведения данных, подтверждающих допустимость использования вилдаглиптина и метформина в составе одной фармацевтической композиции, не подтвержден требованиями действующего законодательства и сведениями из уровня техники о невозможности использования вилдаглиптина и метформина в составе одной фармацевтической композиции, в то время как в описании изобретения по оспариваемому патенту приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения, и сведения об известности из уровня техники методик получения таблеток (см. с. 13-15 описания).

Для подтверждения своей позиции патентообладатель приводит постановление президиума Суда по интеллектуальным правам от 25.01.2021 по делу № СИП-628/2017 (Приложение 4), в котором суд установил, что «критерий «промышленная применимость» предполагает лишь принципиальную пригодность изобретения для использования в какой-либо из отраслей промышленности. При этом требованию промышленной применимости могут соответствовать изобретения, которые реализуемы лишь однократно в специфических, неповторимых условиях» (см. приложение 4, стр.33).

Доводы патентообладателя в защиту соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» сводятся к тому, что «все примеры известных из публикации [1] композиций содержат в качестве единственного активного вещества нагелинид и не содержат ни метформина, ни вилдаглиптина», а известная из публикации [1] комбинация предназначена лишь для одновременного, раздельного или последовательного использования (с.3 перевода) «и не обязательно представляет собой единую фармацевтическую композицию».

При этом в отзыве патентообладатель обращается с ходатайством об изменении предоставленного оспариваемым патентом объема правовой охраны и представляет уточненную формулу изобретения (Приложение 1), которую он просит принять к рассмотрению для частичного сохранения правовой охраны группы изобретений по оспариваемому патенту.

По мнению патентообладателя, представленные в формуле изобретения уточнения, выполнены с соблюдением требований, установленных действующим законодательством, и не расширяют объем правовой охраны.

Так, независимый пункт 1 скорректирован путем указания на таблетку, а признаки, характеризующие активные ингредиенты, ограничены тремя конкретными альтернативами, на основании пунктов 2 и 32 формулы патента. Независимый пункт 34 формулы по оспариваемому патенту (соответствует уточненному пункту 27 формулы) скорректирован путем указания на таблетку и включения признаков, характеризующих стадию «прессования», а также указания на то, что грануляция представляет собой грануляцию из расплава, на основании пунктов 35 и 40 формулы оспариваемого патента. Пункты 2, 23, 27, 28, 30-32, 35, 40 формулы оспариваемого патента исключены. Пункт 22 (соответствует уточненному пункту 21 формулы) скорректирован путем исключения признака «влажная грануляция». Из пункта 44 (соответствует уточненному пункту 35 формулы) исключены признаки, характеризующие вилдаглиптин.

По мнению патентообладателя, уточненная формула изобретения (см. ниже) отвечает всем условиям патентоспособности.

В отзыве приведены доводы в отношении условия патентоспособности “изобретательский уровень” группы изобретений по уточненной формуле. Доводы патентообладателя сводятся к следующему.

Известная из публикации [1] комбинация «не обязательно представляет собой единую фармацевтическую композицию», поскольку

“предназначена для одновременного, отдельного или последовательного использования (с.3 перевода)”.

В публикации [1] приведен широкий перечень как ингибиторов DPP-IV (с.3-10 перевода), так и классов противодиабетических соединений (ингибиторы протеинтирозинфосфатаз, ингибиторы глутамин-фруктозо-6-фосфатамидотрансферазы, ингибиторы глюкозо-6-фосфатазы и др. (с.2 перевода), однако все примеры известных из публикации [1] композиций, содержат в качестве единственного активного вещества натеглинид и не содержат ни метформина, ни вилдаглиптина.

В публикации [1] отсутствуют сведения о том, что комбинация, в которой содержание вилдаглиптина и метформина составляет 60-98 мас% согласно независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента, будет образовывать стабильную таблетку с превосходными физическими свойствами.

Способ получения известной из публикации [1] композиции раскрыт лишь в общих чертах - «фармацевтические препараты для перорального применения могут быть получены путем объединения активного ингредиента с твердыми носителями, при желании грануляции полученной смеси и обработки смеси или гранул, если желательно или необходимо, после добавления подходящих наполнителей с получением таблеток или покрытых сахаром ядра таблетки».

По мнению патентообладателя, отличительными признаками изобретения по независимому пункту 1 уточненной им формулы оспариваемого патента по отношению к публикации [1] являются: «1) 50 мг вилдаглиптина и 500 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей, 2) 50 мг вилдаглиптина и 850 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей, или 3) 50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей» в качестве активных ингредиентов

таблетки; «активные ингредиенты соответствуют от 60 до 98% композиции», и «в которой метформин находится в форме гранул, содержащих от 1 до 20 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента, выбранного из целлюлозы и ее производных».

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

С учетом даты (25.09.2006) международной подачи заявки, по которой был выдан оспариваемый патент, правовая база для оценки соответствия изобретения по оспариваемому патенту условиям патентоспособности включает Патентный закон Российской Федерации № 3517-1 от 23 сентября 1992 года, в редакции Федеральных законов от 07.02.2003 N 22-ФЗ, от 02.02.2006 N 19-ФЗ, с изменениями, внесенными Федеральными законами от 27.12.2000 N 150-ФЗ, от 30.12.2001 N 194-ФЗ, от 24.12.2002 N 176-ФЗ от 07.02.2003 № 22-ФЗ (далее - Патентный закон), а также Правила составления, подачи и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 06.06.2003 №82, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 30.06.2003 № 4852, с изменениями от 11.12.2003 (далее – Правила ИЗ).

Согласно пункту 1 статьи 4 Патентного закона, изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо. Изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники. Изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники. Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5 Правил ИЗ в том случае, когда в предложенной заявителем формуле содержится признак, выраженный альтернативными понятиями, проверка патентоспособности проводится в

отношении каждой совокупности признаков, включающей одно из таких понятий.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.1 Правил ИЗ изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других отраслях деятельности проверяется, указано ли назначение изобретения в описании, содержащемся в заявке на дату подачи (если на эту дату заявка содержала формулу изобретения - то в описании или формуле изобретения), а в случае испрашивания приоритета, более раннего, чем дата подачи - также в документах, послуживших основанием для испрашивания такого приоритета.

Кроме того, проверяется, приведены ли в описании, содержащемся в заявке, и в указанных документах средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в каждом из пунктов формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в указанных документах допустимо, чтобы упомянутые средства и методы были описаны в источнике, ставшем общедоступным до даты приоритета изобретения.

Кроме того, следует убедиться в том, что в случае осуществления изобретения по любому из пунктов формулы действительно возможна реализация указанного заявителем назначения.

Если о возможности осуществления изобретения и реализации им указанного назначения могут свидетельствовать лишь экспериментальные данные, проверяется наличие в описании изобретения примеров его осуществления с приведением соответствующих данных (пункт 3.2.4.5 настоящих Правил), а также устанавливается, являются ли приведенные примеры достаточными, чтобы вывод о соблюдении указанного требования распространялся на разные частные формы реализации признака, охватываемые понятием, приведенным заявителем в формуле изобретения.

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.1 Правил ИЗ если установлено, что соблюдены все указанные требования, изобретение признается соответствующим условию промышленной применимости. При несоблюдении хотя бы одного из указанных требований делается вывод о несоответствии изобретения условию промышленной применимости.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.2 Правил ИЗ изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники. Проверка новизны изобретения проводится в отношении всей совокупности признаков, содержащихся в независимом пункте формулы изобретения.

Согласно подпункту 4 пункта 19.5.2 Правил ИЗ изобретение признается известным из уровня техники и не соответствующим условию новизны, если в уровне техники выявлено средство, которому присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в предложенной заявителем формуле изобретения, включая характеристику назначения.

Если заявленное изобретение охарактеризовано в виде применения по определенному назначению, то оно не признается соответствующим условию новизны при обнаружении источника информации, из которого известно применение того же продукта или способа по такому же назначению.

Согласно подпункту 9 пункта 19.5.2 Правил ИЗ в отношении изобретения, для которого установлено несоответствие условию новизны, проверка изобретательского уровня не проводится.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники.

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.3 Правил ИЗ изобретение признается не следующим для специалиста явным образом из уровня техники, когда не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не установлена известность

влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Проверка соблюдения указанных условий включает: определение наиболее близкого аналога в соответствии с пунктом 3.2.4.2 настоящих Правил ИЗ; 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 рассматриваемого изобретения; анализ уровня техники с целью установления известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 3.2.4.2. Правил ИЗ, в качестве аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений, ставших общедоступными до даты приоритета изобретения. В качестве наиболее близкого к изобретению указывается тот, которому присуща совокупность признаков, наиболее близкая к совокупности существенных признаков изобретения.

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.3 Правил ИЗ не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные, в частности: на дополнении известного средства какой-либо известной частью, присоединяемой к нему по известным правилам, для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно таких дополнений; на замене какой-либо части известного средства другой известной частью для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно такой замены; на исключении какой-либо части средства (элемента, действия) с одновременным исключением обусловленной ее наличием функции и достижением при этом обычного для такого исключения результата (упрощение конструкции, уменьшение массы, габаритов, материалоемкости, повышение надежности,

сокращение продолжительности процесса и пр.); на увеличении количества однотипных элементов, действий для усиления технического результата, обусловленного наличием в средстве именно таких элементов, действий; на выполнении известного средства или его части из известного материала для достижения технического результата, обусловленного известными свойствами этого материала; на создании средства, состоящего из известных частей, выбор которых и связь между которыми осуществлены на основании известных правил, рекомендаций и достигаемый при этом технический результат обусловлен только известными свойствами частей этого средства и связей между ними; на применении известного продукта или способа по определенному назначению, если возможность реализации этого назначения обусловлена его известными свойствами, структурой, выполнением и известно, что именно такие свойства, структура, выполнение необходимы для реализации этого назначения.

Не могут быть признаны соответствующими изобретательскому уровню также изобретения, основанные на изменении количественного признака (признаков), представлении таких признаков во взаимосвязи либо изменении ее вида, если известен факт влияния каждого из них на технический результат и новые значения этих признаков или их взаимосвязь могли быть получены исходя из известных зависимостей, закономерностей.

Согласно подпункту 7 пункта 19.5.3 Правил ИЗ подтверждения известности влияния отличительных признаков на технический результат не требуется, если в отношении этих признаков такой результат не определен заявителем или в случае, когда установлено, что указанный им технический результат не достигается. В случае наличия в числе отличительных наряду с признаками, влияющими на возможность достижения технического результата, также признаков, которые необходимы лишь для получения результата, не являющегося техническим, или результата, который не может быть признан относящимся к средству, воплощающему изобретение, с учетом положений

подпункта (1.1) пункта 3.2.4.3 настоящих Правил, последние не принимаются во внимание при проверке изобретательского уровня.

Анализ доводов сторон показал следующее.

На дату подачи возражения группе изобретений по оспариваемому патенту была представлена правовая охрана в объеме формулы изобретения, содержащей 46 пунктов, независимыми из которых, на что также обратил внимание в своем отзыве патентообладатель, являются пункты 1 («Фармацевтическая композиция...») и 34 («Способ получения фармацевтической композиции, содержащей ингибитор DPP-IV, которым является вилдаглиптин или его фармацевтически приемлемая соль и метформин...») формулы, приведенной выше.

Что касается оценки изобретения по оспариваемому патенту на соответствие его условию патентоспособности “промышленная применимость”, то можно согласиться с патентообладателем в том, что описание изобретения по оспариваемому патенту содержит сведения о возможности использования композиции с вилдаглиптином и метформином в здравоохранении, а именно, для лечения состояний, таких как инсулиннезависимый сахарный диабет. В описании изобретения по оспариваемому патенту содержится также указание на назначение изобретения, заключающееся в применении композиции для лечения патологических состояний, таких как инсулиннезависимый сахарный диабет (с.33, строка 39 - с.34, строка 4).

В описании к оспариваемому патенту указано, что средствами, с помощью которых возможно осуществление изобретения, являются: активные ингредиенты - вилдаглиптин и метформин или их фармацевтически приемлемые соли (с. 30, строки 2-4 и с.4, строки 4-34 описания, соответственно), в качестве вспомогательных инертных веществ - стандартные фармацевтически приемлемые эксципиенты, такие как стандартные связующие агенты, разбавители, дезинтегрирующие агенты, глиданты, красители и др. (с.21, строка 32 - с.22, строка 14 описания). Композицию получают, в частности,

в форме таблеток, с использованием стандартных методов таблетирования или аналогичных машин (с.29, строки 40-41 описания). В частности, на стр. 13-15 описания к оспариваемому патенту изложены основные методы, которые известны специалисту в данной области для получения композиций в форме таблеток.

В описании к оспариваемому патенту также указано, что используемый в композиции метформин присутствует в виде гранул, а в таблетках гранулы метформина спрессованы в смеси с вилдаглиптином и необязательно с одним фармацевтически приемлемым эксципиентом (стр. 19, 20, строки 12-14).

Однако, что касается средств и методов, с помощью которых возможно осуществление изобретения, в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения по оспариваемому патенту, то в описании к оспариваемому патенту не приведены сведения о создании такой композиции, которая содержит только одну из альтернативных совокупностей признаков – с вилдаглиптином или с метформином.

В описании изобретения по оспариваемому патенту речь идет о совместном и одновременном использовании в композиции упомянутых веществ. Так, например, в описании к оспариваемому патенту указано, что «Предпочтительный состав по настоящему изобретению включает активные ингредиенты, а именно ингибитор DPP-IV и метформин, и связующий агент»; «Еще одним объектом настоящего изобретения является способ получения состава или таблетки, содержащих ингибитор DPP-IV и метформин, или их соли».

В результате рассмотрения довода возражения о неправомерности изложения признаков «вилдаглиптин или метформин» в независимом пункте 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту установлено, что такая совокупность признаков некорректна и приводит к невозможности создания в одной композиции этих двух веществ одновременно, ввиду их фактического

указания в альтернативных вариантах исполнения в приведенной выше формуле изобретения.

Таким образом, приведенные в возражении доводы в отношении некорректного использования в формуле изобретения по оспариваемому патенту активных веществ в их альтернативных вариантах (вилдаглиптин или иметформин), следует признать убедительными.

В связи с этим, патентообладателем было подано ходатайство об уточнении независимого пункта 1 в приведенной выше формуле, с целью устранения некорректного изложения признаков «вилдаглиптин или метформин».

Ходатайство об уточнении упомянутых признаков было подано патентообладателем также в Федеральный институт промышленной собственности, в связи с чем, в Государственном реестре состоялась новая публикация патента с уточненным независимым пунктом 1 формулы, а именно: «Фармацевтическая композиция, которая в качестве активных ингредиентов включает: 1) от 1,5 до 20% вилдаглиптина или его фармацевтически приемлемой соли, и 2) от 80 до 98,5% метформина или его фармацевтически приемлемой соли...» (см. бюллетень № 22 от 10.08.2021). Таким образом, формула изобретения по оспариваемому патенту в части признаков, касающихся включения в композицию вилдаглиптина и метформина, приведена в соответствие с описанием и возможностью реализации указанного назначения «Фармацевтическая композиция», в которой, согласно описанию два упомянутых вещества необходимо использовать совместно в одной композиции.

Кроме того, на заседании коллегии от 28.05.2021 от патентообладателя поступило в устной форме ходатайство об исключении из пункта 22 формулы изобретения по оспариваемому патенту (см. формулу выше) альтернативного признака, касающегося влажной грануляции, как несоответствующего условию патентоспособности «промышленная применимость».

Оценка соответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» на основании доводов сторон, показала следующее.

Изобретение по оспариваемому патенту относится к фармацевтической композиции, включающей вилдаглиптин и метформин в свободной форме или в форме их фармацевтически приемлемых солей, и к способу получения этой композиции.

Независимый пункт 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту относится к композиции, содержащей в качестве активных ингредиентов вилдаглиптин (от 1,5 до 20%) и метформин (от 80 до 98,5%), которые составляют от 60 до 98% от всей композиции. При этом метформин находится в форме гранул, содержащих от 1 до 20 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента, выбранного из целлюлозы и ее производных.

Согласно описанию и формуле изобретения по оспариваемому патенту в композиции содержится “ингибитор DPP-IV, которым является вилдаглиптин или его фармацевтически приемлемая соль” (см., например пункт 34 формулы оспариваемого патента, приведена выше), “предпочтительным ингибитором DPP-IV является продукт LAF237”, “в настоящем изобретении предлагается фармацевтическая композиция или прессованная таблетка, включающая ингибитор DPP-IV, предпочтительно продукт LAF237” (см. например стр. 17, 18 описания к оспариваемому патенту), “наиболее предпочтительным ингибитором DPP-IV является LAF237 или вилдаглиптин или его фармацевтически приемлемые соли” (стр. 21 описания оспариваемого патента). Таким образом, согласно описанию и формуле изобретения к оспариваемому патенту ингибитор DPP-IV и продукт LAF237 относятся к вилдаглиптину.

Согласно законодательству, действующему на дату подачи заявки, по которой выдан оспариваемый патент, в качестве ближайшего аналога рассматривается известное из уровня техники средство того же назначения,

которому присуща совокупность признаков, наиболее близкая к совокупности существенных признаков изобретения (см. пункт 3.2.4.2. Правил ИЗ, правовая база выше).

Исходя из сведений, представленных в возражении и фигурируемых в нем источников информации [1]-[12], ближайшим аналогом является композиция, раскрытая в публикации [1], содержащая в качестве активных ингредиентов ингибитор DPP-IV в свободной форме или в форме его фармацевтически приемлемой соли (перевод, стр. 2, строки 18, 19; англ. стр. 2, строки 13-16) и “по меньшей мере, одно дополнительное противодиабетическое соединение или фармацевтически приемлемую соль такого соединения и необязательно по меньшей мере один фармацевтически приемлемый носитель – для одновременного, раздельного или последовательного использования “ (см., например, стр. 2 перевода), и “необязательно, один или несколько фармацевтически приемлемый носитель”, в частности, микрокристаллическую целлюлозу, являющуюся фармацевтически связующим агентом (например, стр. 22, 39 перевода).

В публикации [1] раскрыты фармацевтические комбинации, содержащие ингибитор DPP-IV и, по меньшей мере, одно дополнительное противодиабетическое соединение. Известная из публикации [1] комбинация предназначена для одновременного, раздельного или последовательного использования (с.3 перевода).

В публикации [1] вилдаглиптин (LAF237 или DPP728) указан в числе предпочтительных ингибиторов DPP-IV (с.6 перевода), а метформин упоминается в качестве одного из вариантов дополнительного противодиабетического соединения (с. 12 перевода) и приведен широкий перечень как ингибиторов DPP-IV (с.3-10 перевода), так и классов противодиабетических соединений - ингибиторы протеинтирозинфосфатаз, ингибиторы глутамин-фруктозо-6-фосфатамидотрансферазы, ингибиторы

глюкозо-6-фосфатазы и др. (с.2 перевода), используемых в изобретении по оспариваемому патенту.

Известная из публикации [1] композиция может включать примерно от 10% до 100%, например, 80% или 90%, или, примерно от 20% до 60% активного ингредиента (см. перевод, стр.29, строки 29-31; англ. стр. 30, строки 14-16). То есть, в известной из публикации [1] композиции количество активных ингредиентов может варьироваться от 1,5 до 20 % и от 80 до 98,5 и соответствовать от 60 до 98% композиции так же, как и в композиции по оспариваемому патенту.

Таким образом, если взять известный из публикации [1] интервал содержания в композиции активных ингредиентов, например, от 10 до 100%, то известной из публикации [1] композиции является вариант ее исполнения с содержанием в ней связующего агента от 1 до 20% мас.% в различных вариациях исполнения по количественному содержанию тех или иных ингредиентов.

Согласно публикации [1] предпочтительными ингибиторами являются DPP-IV и могут использоваться N-(N'-замещенный глицил)-2-цианопирролидины (перевод, стр. 4, строки 19-20; англ. стр. 4, строки 14-15), в частности, (8)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино]ацетил-2-цианопирролидин (LAF237) (перевод, стр. 6, строки 11-14; англ. стр. 6, строки 9-11), который представляет собой вилдаглиптин (согласно описанию оспариваемого патента). В качестве дополнительного противодиабетического соединения известная из публикации [1] композиция может включать метформин (перевод, стр. 12, строки 4, 5, стр. 20, строки, 20-24; англ. стр. 12, стр. 7-9, стр. 21, строки 12-15) или фармацевтически приемлемую соль такого соединения (п. 10 формулы)

Так, в публикации [1] сказано, что в качестве ингибитора DPP-IV может быть выбран DPP 728, а в качестве партнера комбинации выбирают одно из лекарственных средств, в частности метформин (стр. 25 перевода), «в более предпочтительном варианте осуществления изобретения следующие весовые

соотношения DPP 728 или LAF237 или его фармацевтически приемлемой соли к одному из указанных дополнительных партнеров комбинации по настоящему изобретению должны быть введены для получения синергетического эффекта» (стр. 34 перевода).

При этом в таблице 7 публикации [1] в качестве дополнительного фармацевтически активного соединения указан «метформин от 4:1 до 1:60, предпочтительно от 1:1 до 1:10, например 1:6» (см. стр. 34, 35).

В сопровождении к таблице 8 в публикации [1] приведены сведения о том, что «если теплокровным животным является человек с массой тела около 70 кг, предпочтительно, чтобы дозировки, по меньшей мере одного дополнительного фармацевтического активного соединения были следующими: DPP 728 от 25 до 1000 мг/сутки, наиболее предпочтительная дозировка от 150 до 300 мг/сутки (перевод, стр. 35), а метформина – от 250 до 1500 мг/сутки, предпочтительно от 500 до 1250, например, 1000 мг/сутки (см. перевод, стр. 36).

Также из публикации [1] известно, что дополнительное противодиабетическое соединение в композиции может быть выполнено в виде гранул, получаемых с использованием влажного гранулирования (см. перевод, стр. 31, строки 4-10; англ. стр. 31, строки 21 - 27).

При этом в публикации [1] отмечено, что фармацевтические препараты согласно изобретению для энтерального или парентерального введения представляют собой, например, препараты в виде стандартных доз, таких как покрытые сахаром таблетки, таблетки, капсулы или суппозитории, а также ампулы (см. перевод, рус. стр. 29, строки 31- 34; англ. стр. 30, строки 16 -18).

Таким образом, в публикации [1] раскрыта фармацевтическая композиция, охарактеризованная всеми признаками независимого пункта 1 формулы изобретения по оспариваемому патенту. Поскольку в композиции, охарактеризованной в независимом пункте 1 формулы оспариваемого патента, отсутствуют признаки, отличающие ее от известной из публикации [1] композиции, то данный факт не позволяет признать изобретение по

независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента соответствующим условию патентоспособности “новизна”, в свете наличия информации, представленной в приложенной к возражению публикации [1].

Анализ доводов сторон в отношении оценки патентоспособности изобретения по независимому пункту 34 формулы оспариваемого патента показал следующее.

Независимым пунктом 34 приведенной выше формулы оспариваемого патента охраняется “Способ получения фармацевтической композиции, содержащей ингибитор DPP-IV, которым является вилдаглиптин или его фармацевтически приемлемая соль и метформин...”, который включает следующие приемы: 1-грануляцию метформина и связующего агента; 2-высушивание гранул, содержащих метформин и связующий агент; 3-смешивание лекарственной субстанции ингибитора DPP-IV с гранулами, содержащими метформин и связующий агент; необязательно смешивание замасливателя, например стеарата магния со смесью, полученной на стадии смешивания с ингибитором DPP-IV. То есть, способ по оспариваемому патенту характеризуется гранулированием одного из активных веществ, высушиванием полученных гранул и их смешиванием с субстанцией другого активного вещества. При этом стадия смешивания активных ингредиентов с замасливателем является необязательной (см. формулу выше).

Однако, в публикации [1] уже содержатся сведения о получении фармацевтических композиций, содержащих упомянутые активные вещества, например, с помощью обычных процессов грануляции, последующего смешения, нанесения покрытия, растворения или лиофилизации. Таким образом, фармацевтические препараты для перорального применения могут быть получены путем объединения активного ингредиента с твердыми носителями, при желании грануляции полученной смеси и обработки смеси или гранул, если желательно или необходимо, после добавления подходящих

наполнителей с получением таблеток (см. перевод, рус. стр.29, строки 34-35; стр.30, строки 1- 5; англ. стр.30, строки 16 - 23).

Согласно публикации [1] для использования в композиции качестве дополнительного противодиабетического средства к ингибитору DPP-IV, наряду с метформином, в том числе, рекомендуется натеглинид (см. перевод, стр. 20, строки 23-24, Таблица 7, п. 10 формулы; англ. стр. 21, строки 14 -15, Таблица 7, п. 10 формулы).

Также указано, что, если комбинация включает натеглинид, то фармацевтическая композиция, содержащая только натеглинид, может быть получена способом, который включает грануляцию в присутствии воды с образованием гранул, высушивание гранул и, необязательно, просеивание гранул, например, посредством экрана из проволочной сетки. При этом все ингредиенты композиции могут быть добавлены до или во время грануляции. В качестве альтернативы, все, или часть одного, добавлены до или во время грануляции. В качестве альтернативы, все или часть, или несколько ингредиентов могут быть добавлены после завершения стадии грануляции. Например, весь антиадгезив (в частности, диоксид кремния) или его часть, весь замасливатель (в частности, стеарат магния) или его часть, и/или весь дезинтегрирующий агент (в частности, кроскармеллоза или любая ее соль) или его часть могут добавляться после грануляции. Как отмечено в описании изобретения по публикации [1], “в одном аспекте изобретения все ингредиенты, за исключением стеарата магния и коллоидного диоксида кремния, загружаются в гранулятор, а затем их добавляют позже. Процесс получения этой композиции, в частности фармацевтической композиции, можно проводить без стадии измельчения. В контексте настоящего описания термины «измельчение» и «измельчать» относятся к любому процессу, который включает измельчение или дробление частиц для уменьшения их размера. Композиция, в частности фармацевтическая композиция, может быть получена без измельчения гранул между стадией грануляции и стадией высушивания

и/или прессования, используемой для формования гранул в таблетку (см. перевод, стр. 31, строки 19-22; англ. стр. 32, строки 4 - 7).

Таким образом, из сведений, приведенных в публикации [1], известно: использование для получения заявленных фармацевтических препаратов например, обычных способов - процессов смешения, грануляции, путем объединения активного ингредиента с твердыми носителями, при желании грануляции полученной смеси и обработки смеси или гранул, если желательно или необходимо, после добавления подходящих наполнителей с получением таблеток или покрытое сахаром ядро таблетки; изготовление дополнительного противодиабетического соединения композиции в виде гранул, получаемых влажным гранулированием; пример изготовления таблеток, содержащих гранулы натеглинида, полученные методом влажного гранулирования с последующим добавлением и смешением стеарита магния с гранулами и прессование полученной смеси в таблетку; возможность добавления дополнительных ингредиентов в композицию после грануляции натеглинида, но до осуществления прессования смеси.

Таким образом, из публикации [1] известен способ получения фармацевтической композиции, содержащей ингибитор DPP-IV, которым является вилдаглиптин или его фармацевтически приемлемая соль и метформин или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей, включающий грануляцию метформина и связующего агента, высушивание гранул, содержащих метформин и связующий агент, смешивание лекарственной субстанции ингибитора DPP-IV с гранулами, содержащими метформин и связующий агент, и известно включение дополнительного ингредиента в композицию в виде гранул, использование стандартных операций для осуществления влажного гранулирования указанного ингредиента, и возможность добавления ингредиентов в композицию, как во время грануляции, так и после завершения стадии грануляции.

Отличием способа, известного из публикации [1], от способа, предложенного в пункте 34 формулы оспариваемого патента, является то, что в оспариваемом патенте используется метформин, а в примере реализации известного из публикации [1] способа, в качестве дополнительного активного ингредиента использовался натеглинид. Однако, на основании источников [1]-[3] для специалиста в данной области техники явным образом следует использование в способе по публикации [1] метформина, поскольку в публикации [1] (см. стр. 25 перевода) указано, что метформин может быть выбран в качестве ингибитора DPP-IV наряду с натеглинидом.

Кроме того, в пунктах 22, 40 формулы оспариваемого патента говорится о возможности получения гранул метформина грануляцией из расплава. При этом оба указанных способа получения гранул метформина известны из источников информации [2], [6], [8]-[11].

При этом в публикации заявки [2] раскрыта фармацевтическая композиция, содержащая гранулу, ядро которой включает метформин или его фармацевтически приемлемую соль в количестве от 50 до 98%, предпочтительно от 75 до 95%, вместе со связующим агентом, который может быть производным целлюлозы в количестве от 0 до 40%, предпочтительно от 3 до 15%. Также указано, что ядро получают, предпочтительно, путем влажной грануляции ингредиентов ядра и прессованием гранул с добавлением замасливателя в таблетку на ротационном прессе. Также сказано, что ядро может быть сформировано путем сухой грануляции ингредиентов ядра и прессованием гранул с добавлением замасливателя в таблетки или прямым прессованием (параграфы 0002, 0030, 0031, 0033, 0034, 0043 и 0049). Зная эти сведения, для специалиста будет очевидной замена одной известной части (натеглинид) на другую известную часть (метформин), для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно такой замены, что позволяет признать несоответствие способа по

оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. пункт 19.5.3 Правил ИЗ).

Кроме того, возможность использования для метформина таких приемов способа, которыми охарактеризовано изобретение по оспариваемому патенту, широко известна из уровня техники. Так, в публикации [3] говорится о разработке состава, содержащего гидрохлорид метформина в форме когезионного порошка для таблетирования с достаточно высокой текучестью, который можно подвергнуть прямому прессованию в таблетки, и о получении таблетки из указанного состава с соответствующей твердостью, быстрым временем дезинтеграции и пригодным профилем растворения (см. столбец 4, строка 65 - 57; столбец 5, строки 5, 10-59; столбец 8, строки 21-29, 59-61; столбец 9, строки 60-66). Отмечается также о необходимости наличия связующего агента для скрепления частиц порошка из-за плохих когезионных свойств большинства порошков (столбец 2, строки 64-67).

При этом в публикации [3] содержатся сведения о том, что микрокристаллическая целлюлоза особенно хорошо прессуется и позволяет получать твердые, прочные таблетки при низком машинном давлении, что предотвращает расслаивание и скол выпуклой части таблеток метформина, а также обладает способностью к связыванию и превосходными свойствами текучести при таблетировании (столбец 9, строки 17-23). Причем в данной публикации [3] указано, что для прямого прессования можно использовать порошок метформина, у которого от 70 до 79 % частиц имеют размеры от 400 до 600 мкм (столбец 5, строки 18 -20).

Из описания оспариваемого патента следует, что даже наличие в композиции 0,59% вилдаглиптина с размером частиц менее 250 мкм способно улучшить условия прессования. Однако, в описании изобретения по оспариваемому патенту отсутствуют какие-либо сведения о влиянии на прессуемость размеров частиц метформина, содержание которого в композиции по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента, может более чем

на порядок превышать содержание вилдаглиптина, в связи с чем ожидаемое влияние на прессуемость заявленных в оспариваемом патенте размеров частиц вилдаглиптина является неподтвержденным.

При этом в публикации [4] приведен пример сухого гранулирования гидрохлорида метформина с использованием в качестве связующего метилцеллюлозы или микрокристаллической целлюлозы с последующим изготовлением таблеток методом прямого прессования указанных гранул (параграфы 0017, 0020, 0021, 0027, 0028, 0032, столбец 9, строки 17-23). Данные сведения, наряду со сведениями, известными из публикаций [1], [2] приводят к очевидности изобретения по оспариваемому патенту.

Кроме того, в статье [5] (стр. 1939) говорится об улучшении гликемического контроля и функции Р – клеток при добавлении вилдаглиптина к метформину у пациентов с диабетом 2 типа в сочетании с благоприятной переносимостью, что подтверждает известность указанного в описании изобретения по оспариваемому патенту положительного эффекта при лечении диабета 2 типа до даты приоритета изобретения по оспариваемому патенту.

Из статьи [6] известно получение гранулята, содержащего смесь гидрохлорида метформина и метилгидроксиэтилцеллюлозы, путем влажной грануляции с водным раствором связующего агента поливидона с последующим высушиванием и смешиванием со стеаритом магния в качестве замасливателя, а в примере 4 данной статьи [6] описывается тот же процесс, в котором метилгидроксиэтилцеллюлоза служит связующим агентом (пример 1, столбец 4, строки 36-37; столбец 6, строки 15-31; столбец 7, строки 64 - 67). Также, в данной статье [6] говорится о прессовании полученной смеси в стандартную дозированную лекарственную форму в виде таблетки (столбец 6, строки 25 -27).

В международной публикации заявки [7] раскрыто получение посредством прямого прессования таблетки на основе фармацевтической композиции, содержащей вилдаглиптин (LAF237) и связующее в виде

микrokристаллической целлюлозы или иных производных целлюлозы, а также которая может включать разбавители, дезинтегрирующие агенты, твердые наполнители и т.д. (примеры 1, 2; строки 10, 11, 28). Также в данной публикации [7] говорится о том, что для улучшения свойств прессуемости таблетка должна содержать, по меньшей мере 60 % частиц, размер которых менее 250 мкм, при этом масса ингибитора DPP-IV в таблетке составляет от 6 % до 60 % (пункты 15, 29 формулы).

Из публикации патента на изобретение [8] известен способ изготовления двухслойной таблетки, содержащей комбинированный препарат, в виде гранулята метформина и другого противодиабетического лекарственного средства (глибурида) (параграфы 0009, 0016).

В публикации заявки [9] и в статье[10] приведены способы грануляции метформина и связующего из расплава.

В публикации патента [11] содержатся сведения о влажной грануляции метформина из раствора этанола или изопропанола (столбец 20, строки 38 - 46).

Из публикации заявки [12] известны трехслойные таблетки, содержащие метформин (параграфы 0035 - 0041).

Таким образом, на дату приоритета изобретения по оспариваемому патенту уже было известно (см. источники информации [1]-[12]) о получении положительного эффекта при объединении в комбинированном противодиабетическом препарате вилдаглиптина с метформином, о способах гранулирования метформина с использованием методов влажного и сухого гранулирования и грануляции из расплава, а также известны способы изготовления таблеток из гранул метформина и таблеток из порошка вилдаглиптина методом прямого прессования, известны способы изготовления таблеток с комбинированным составом, включающим два противодиабетических ингредиента, методом прямого прессования порошка вилдаглиптина с гранулами добавляемого противодиабетического ингредиента, получаемых известными методами, известны эксципиенты, добавляемые в

фармацевтические композиции для улучшения прессуемости и физических характеристик таблеток. То есть, известны все признаки, приведенные в независимых пунктах 1, 34 формулы, а также в зависимых от них пунктах формулы изобретения по оспариваемому патенту.

При этом важно обратить внимание на то, что в зависимых пунктах 23, 35 формулы оспариваемого патента речь идет только о влажной грануляции метформина и связующего агента, а не о грануляции всей фармацевтической композиции при изготовлении таблеток, получаемых прямым прессованием смеси вилдаглиптина с гранулами метформина.

Кроме того, в зависимых пунктах 22, 40 формулы оспариваемого патента говорится о возможности получения гранул метформина грануляцией из расплава. При этом оба указанных способа получения гранул метформина известны из источников информации [2], [6], [8]-[11].

На основании изложенного можно констатировать, что в возражении содержатся доводы, позволяющие сделать вывод о несоответствии изобретений, охарактеризованных в независимых пунктах 1, 34 формулы оспариваемого патента, условию патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень» соответственно (см. пункт 1 статьи 4 Патентного закона).

Патентообладатель представил ходатайство о принятии к рассмотрению приложенной к отзыву формулы изобретения, скорректированной следующим образом:

«1. Фармацевтическая композиция, представляющая собой таблетку, которая в качестве активных ингредиентов включает: 1) 50 мг вилдаглиптина и 500 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей, 2) 50 мг вилдаглиптина и 850 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей, или 3) 50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина или в каждом случае их фармацевтически приемлемых солей, при этом активные ингредиенты соответствуют от 60 до 98% композиции, и в

которой метформин находится в форме гранул, содержащих от 1 до 20 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента, выбранного из целлюлозы и ее производных.

2. Фармацевтическая композиция по п.1, представляющая собой таблетку, полученную прямым прессованием.

3. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой гранулы содержат от 3 до 13 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

4. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой гранулы содержат от 4,9 до 12 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

5. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой гранулы содержат от 7,5 до 10,5 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

6. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой гранулы содержат от 7,5 до 17,5 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

7. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой гранулы содержат от 12,5 до 17,5 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента.

8. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой связующий агент выбирают из группы, включающей микрокристаллическую целлюлозу, гидроксипропилцеллюлозу, гидроксипропилметилцеллюлозу и гидроксипропилметилцеллюлозу.

9. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которую добавляют по крайней мере один стандартный фармацевтический приемлемый эксципиент.

10. Фармацевтическая композиция по п.8, в которую добавляют по крайней мере один стандартный фармацевтический приемлемый эксципиент.

11. Фармацевтическая композиция по любому из пп.9-10, в которой фармацевтический приемлемый эксципиент выбирают из группы, включающей связующие агенты, разбавители, дезинтегрирующие агенты, замасливатели, твердые наполнители и носители.

12. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в форме таблетки, полученная прямым прессованием гранул метформина в комбинации с вилдаглиптином и необязательно по крайней мере одним фармацевтически приемлемым эксципиентом.

13. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, содержащая не более 25 или 20 мас.% фармацевтически приемлемого эксципиента, включая связующий агент в расчете на массу сухого эксципиента.

14. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, содержащая не более 15 мас.% фармацевтически приемлемого эксципиента, включая связующий агент в расчете на массу сухого эксципиента.

15. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, включающая: 1) от 1 до 12 мас.% фармацевтически приемлемого связующего агента в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента и необязательно от 0,1 до 10 мас.% дополнительного фармацевтически приемлемого эксципиента, или 2) от 7,5 до 17,5 мас.% или от 12,5 до 17,5 мас.% фармацевтически приемлемого связующего агента в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента и необязательно от 0,1 до 10 мас.% дополнительного фармацевтически приемлемого эксципиента в расчете на массу сухого дополнительного фармацевтического эксципиента.

16. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, включающая от 7,5 до 17,5 мас.% фармацевтически приемлемого связующего агента в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента и необязательно от 0,1 до 10 мас.% дополнительного фармацевтически приемлемого эксципиента в расчете на массу сухого дополнительного фармацевтического эксципиента.

17. Фармацевтическая композиция по п. 10 в форме таблетки, в которой другим фармацевтически приемлемым эксципиентом является замасливатель.

18. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2 в форме таблетки, включающая от 0,1 мас.% до 5 мас.% фармацевтически приемлемого замасливателя в расчете на массу композиции.

19. Фармацевтическая композиция по п.17, включающая от 0,5 мас.% до 1,5 мас.% фармацевтически приемлемого замасливателя в расчете на массу композиции.

20. Фармацевтическая композиция по п. 18, в которой замасливателем является стеарат магния.

21. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой гранулы метформина получают грануляцией из расплава в смеси со связующим агентом.

22. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой вилдаглиптин присутствует в форме частиц.

23. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой вилдаглиптин присутствует в форме частиц, в которой по крайней мере 40% вилдаглиптина присутствует в форме частиц, распределение которых по размеру составляет менее 250 мкм.

24. Фармацевтическая композиция по п.22, в которой по крайней мере 40% вилдаглиптина присутствует в форме частиц, распределение которых по размеру составляет от 10 до 250 мкм.

25. Фармацевтическая композиция по п.1, где состав входит в один из слоев двухслойной или трехслойной таблетки.

26. Фармацевтическая композиция по любому из пп. 1-2, включающая дополнительный активный ингредиент, которым являются сульфонилмочевины или глитазон, такой как пиоглитазон или розиглитазон.

27. Способ получения фармацевтической композиции, представляющей собой таблетку, содержащей ингибитор DPP-IV, которым является

вилдаглиптин, и метформин или в каждом случае их фармацевтически приемлемые соли, по любому из пп.1-2, включающий: 1) грануляцию метформина и связующего агента, причем грануляция представляет собой грануляцию из расплава, 2) высушивание гранул, содержащих метформин и связующий агент, 3) смешивание лекарственной субстанции ингибитора DPP-IV с гранулами, содержащими метформин и связующий агент, 4) необязательно смешивание замасливателя, например стеарата магния со смесью, полученной на стадии 3), 5) прессование полученной смеси в таблетку с получением стандартной дозированной лекарственной формы.

28. Способ по п.27, при осуществлении которого на стадии 2) гранулы высушивают до величины потерь воды при высушивании (LOD) 0,5-3,5%, предпочтительно 1,5-2,4%.

29. Способ по п.27, где в перемешиваемую смесь на стадии 1) или стадии 3) добавляют по крайней мере один дополнительный фармацевтически приемлемый эксципиент.

30. Способ по п.29, где дополнительным фармацевтически приемлемым эксципиентом является разбавитель или дезинтегрирующий агент.

31. Способ по п.27, где проводят дополнительную стадию нанесения покрытия на таблетку, полученную на стадии 5).

32. Способ по п.27, который включает стадию грануляции 1), в процессе которой смешивают метформин и связующий агент и смесь пропускают через экструдер для грануляции из расплава.

33. Способ по п.32, при осуществлении которого температура в экструдере в зоне смешения составляет от 140°C до 220°C или от 155°C до 205°C или от 170°C до 190°C.

34. Способ по п.27, при осуществлении которого в качестве связующего агента используют целлюлозу или ее производное, выбранные из группы, включающей микрокристаллическую целлюлозу, гидроксипропилцеллюлозу, гидроксипропилметилцеллюлозу и гидроксипропилцеллюлозу.

35. Фармацевтическая композиция по любому из пп.1-2, в которой в качестве метформина используют гидрохлорид метформина.

36. Фармацевтический состав по любому из пп.1-2 в форме таблетки, который характеризуется следующими параметрами: твердость составляет от 60 до 340 Н; ломкость составляет менее 0,8%; и толщина таблетки составляет от 4,5 до 8,3 мм. 37.

37. Таблетка по п.36, которая характеризуется следующими параметрами: - твердость составляет от 60 до 340 Н, - ломкость составляет менее 0,8%, и - толщина таблетки составляет от 4,5 до 8,3 мм, и - по крайней мере 70% вилдаглиптина растворяется в течение 30 мин по данным лопастного метода анализа, и, по крайней мере 80% гидрохлорида метформина растворяется в течение 45 мин по данным лопастного метода анализа».

Данная формула проанализирована коллегией на соответствие охарактеризованной в ней группы изобретений условию патентоспособности «промышленная применимость» и было установлено следующее.

Промышленная применимость подтверждается сведениями из описания к оспариваемому патенту о том, что изобретение, охарактеризованное в уточненной формуле, может быть использовано в здравоохранении, а фармацевтическая композиция, представляющая собой таблетку, может быть использована для лечения таких состояний, как инсулиннезависимый сахарный диабет.

Так, в описании оспариваемого патента содержится указание на назначение изобретения, заключающееся в применении запатентованной композиции для лечения патологических состояний, таких как инсулиннезависимый сахарный диабет (с.33, строка 39 - с.34, строка 4). Фармакологическая активность таблеток обусловлена действующими веществами - вилдаглиптином и метформинном, активность которых известна из уровня техники (с.4, строки 4-34, с.9, строки 6-11, с. 11, строки 22-29 описания патента).

В описании оспариваемого патента приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в формуле изобретения. Так, в описании оспариваемого патента указано, что средствами, с помощью которых возможно осуществление изобретения, являются: активные ингредиенты вилдаглиптин и метформин или их фармацевтически приемлемые соли (с. 30, строки 2-4 и с.4, строки 4-34 описания, соответственно), в качестве вспомогательных инертных веществ - стандартные фармацевтически приемлемые эксципиенты, такие как стандартные связующие агенты, разбавители, дезинтегрирующие агенты, глиданты, красители и др. (с.21, строка 32 - с.22, строка 14 описания). Композиции в форме таблеток получают с использованием стандартных методов таблетирования (с. 13-15, с.29, строки 40-41 описания), в таблетках метформин присутствует в виде гранул, которые спрессованы в смеси с вилдаглиптином и необязательно одним фармацевтически приемлемым эксципиентом (последняя строка на с. 19 - строка 1 на с.20, строки 12-14 на с.20 описания).

Таким образом, в описании изобретения по оспариваемому патенту приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в измененной формуле изобретения.

В описании изобретения по оспариваемому патенту показана реализация назначения изобретения при его осуществлении, а именно, в примере 1 проиллюстрированы варианты способа получения таблеток, в примере 2 приведены примеры таблеток, включающих в качестве активных ингредиентов 50 мг вилдаглиптина и 500 мг метформина (Таблица 3-2), 50 мг вилдаглиптина и 850 мг метформина (Таблица 3-3), а также 50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина (Таблица 3-4).

Таким образом, описание изобретения по оспариваемому патенту содержит сведения, подтверждающие соответствие группы изобретений по

уточненной формуле условию патентоспособности «промышленная применимость», а именно, указано назначение изобретения, приведены средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения, а также показана возможность реализации назначения изобретения в случае его осуществления.

Таким образом, группу изобретений по независимым пунктам 1 (пп. 2-26 и 35-37 зависимые) и 27 (пп.28-34 зависимые) уточненной формулы оспариваемого патента можно признать соответствующей условию патентоспособности «промышленная применимость».

В связи с тем, что скорректированная формула не приводит к изменению по существу оспариваемого изобретения и отвечает условию патентоспособности «промышленная применимость», она была принята к рассмотрению и направлена для проведения дополнительного информационного поиска.

В результате проведенного дополнительного информационного поиска было представлено 21.07.2021 заключение, в котором приведены источники информации:

1. WO 2001052825 A2, (далее [1]);
2. US 2004175421 A1 , опублик. 09.09.2004 (далее [13]);
3. WO 2005067976 (далее [7]);
4. WO 2002028181 A1 (далее [9]);
5. US 2003187074 A1 , опублик. 02.10.2003 (далее [14]); ;
6. ROYCE A. et al. Alternative granulation technique: melt granulation // Drug development and industrial pharmacy. 1996. Vol. 22. No. 9-10. P. 917-924. [Найдено 19.07.2021], URL: <https://doi.org/10.3109/03639049609065921> (далее [15]);
7. US 6335033 B2, опублик. 01.01.2002 (далее [16]);
8. ЧУЕШОВ В.И. Промышленная технология лекарств. Том 2. - Х.: МТК-Книга; Издательство НФАУ, 2002. - 716 с. (далее [17]).

В заключении сделаны следующие выводы.

Изобретения по пунктам 1-20, 35 соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость», поскольку в примерах 1 и 3 приведены составы таблеток, включающих гранулы метформина, которые получены влажной грануляцией или грануляцией из расплава. В примере 1Б приведен состав таблетки, включающих гранулы метформина, которые получены грануляцией из расплава, и свойства, проявляемые такими таблетками. При этом, хотя и не отмечено применение высушивания, однако в примере 4 раскрыт метод оценки потерь при высушивании, а из уровня техники, например, из документов [9] и [15], известно получение гранул гидрохлорида метформина путем грануляции из горячего расплава или экструзии с последующей сушкой гранулированного продукта, а также определение потерь при высушивании для гранул лактозы-гидроксипропилметилцеллюлозы: содержание влаги в гранулах, полученных из расплава гидроксипропилметилцеллюлозы, меньше начального значения 0,91%. Таким образом, изобретения по пп. 21, 27, 28, 31-34 соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость» .

Изобретения по пунктам 22-24 соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость», поскольку в примере 7 раскрыты средства и методы получения частиц из вилдаглиптина, а из документа [7] известны частицы соответствующего размера и их количество на массу вилдаглиптина. В примерах не рассмотрено получение таблеток с несколькими слоями, включающими дополнительные активные ингредиенты, однако из уровня техники, например, из документов [13] и [7], известно, что таблетки могут содержать более одного слоя, и из документов [1] и [14] известны композиция, содержащая вилдаглиптин и противодиабетическое средство, такое как пиоглитазон или розиглитазон, в качестве альтернативы метформину, и таблетка, содержащая метформин и розиглитазон или сульфонилмочевину.

Таким образом, изобретения по пп.25 и 26 соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость».

В примерах не рассмотрено получение таблеток с дополнительными эксципиентами, кроме замасливателя, однако из уровня техники, например, из документов [13] и [7], известно, что таблетки могут содержать носители, разбавители. Таким образом, изобретения по пп.29 и 30 соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость».

Изобретения по пп.36 и 37 соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость», поскольку в примере 1Б приведен состав таблетки, включающих гранулы метформина, которые получены грануляцией из расплава. При этом свойства, проявляемые такими таблетками, рассмотрены в примерах 2, 6.

Что касается толщины таблетки, то из источника [7] известно соотношение массы к толщине для таблетки вилдаглиптина, а из источника [17] известен типоразмерный ряд таблеток и соотношение массы и диаметра таблетки (с.315-317, таблицы 14.2 и 14.3).

В качестве ближайшего аналога изобретения по независимому пункту 1 (пп.2-26, 35-37 зависимые) и независимому пункту 27 (пп.28-34 зависимые) уточненной формулы рассматривается публикация [1], в которой раскрыта фармацевтическая композиция, представляющая собой таблетку, которая в качестве активных ингредиентов включает комбинацию (8)-1-[(3-гидрокси-1-адамантил)амино] ацетил-2-цианопирролидина (вилдаглиптина) и метформина или их фармацевтически приемлемые соли, и включает по меньшей мере один фармацевтически приемлемый носитель, при этом фармацевтические препараты содержат, например, от около 10% до около 100%, например, 80% или 90%, предпочтительно от около 20% до около 60% активного ингредиента (с. 30, абз. 4; пункты 1-3, 10, 13 формулы), то есть их сумма при содержании в препарате может составлять от 60 до 98% композиции, а содержание эксципиентов может быть малым. В таблице 7 публикации [1] приведены

массовые соотношения метформина и LAF237 (вилдаглиптина) для их приема в комбинации. Согласно публикации [1] препараты получают известными способами, например, с помощью обычных процессов смешивания, гранулирования, нанесения сахарного покрытия, растворения или лиофилизации, таким образом, фармацевтические препараты для перорального применения могут быть получены путем объединения активного ингредиента с твердыми носителями, гранулирования полученной смеси и обработки смеси или гранул после добавления подходящих наполнителей с получением таблеток или покрытых сахаром ядер таблетки (с.30, абзац 4). В примерах 1 и 4 публикации [1] показано получение таблеток с содержанием микрокристаллической целлюлозы.

Композиция по публикации [1] может содержать вилдаглиптин и противодиабетическое средство, такое как пиоглитазон или розиглитазон, в качестве альтернативы метформину (пункт 10 формулы).

Отличием изобретений по независимому пункту 1 (пп.2-26, 35-37 зависимые) и независимому пункту 27 (пп.28-34 зависимые) уточненной формулы от известных из публикации [1] композиций является то, что согласно уточненной формуле оспариваемого патента, в качестве активных ингредиентов композиция включает 50 мг вилдаглиптина и 500, 850 или 1000 мг метформина, причем метформин находится в форме гранул, содержащих от 1 до 20 мас.% в расчете на массу сухого фармацевтически приемлемого связующего агента, выбранного из целлюлозы и ее производных.

Способ по независимому пункту 27 уточненной формулы дополнительно отличается от известного из публикации [1] способа тем, что он включает 1) грануляцию метформина и связующего агента, причем грануляция представляет собой грануляцию из расплава; 2) высушивание гранул, содержащих метформин и связующий агент; 3) смешивание лекарственной субстанции ингибитора DPP-IV с гранулами, содержащими метформин и связующий агент; 5) прессование полученной смеси в таблетку с получением

стандартной дозированной лекарственной формы. При этом стадия 4), касающаяся смешивания замасливателя, например стеарата магния со смесью, полученной на стадии 3), является необязательной.

Таким образом, изобретения по независимому пункту 1 (пп.2-26, 35-37 зависимые) и независимому пункту 27 (пп.28-34 зависимые) уточненной формулы соответствуют условию патентоспособности «новизна».

В качестве технического результата, получаемого при осуществлении изобретений, на основе сведений из описания изобретения по оспариваемому патенту (с. 16-17 патента) рассматривается получение таблеток, содержащих от 25 до 100 мг вилдаглиптина и до 1000 мг метформина, с пригодным профилем растворения, приемлемыми уровнями твердости, ломкости и устойчивости к расслаиванию, а также пригодным временем дезинтеграции и высокой устойчивостью активных компонентов в таблетке.

Дополнительно отмечено следующее: «Вилдаглиптин является чувствительным к влаге и, следовательно, является нестабильным, т.е. активный компонент разлагается. Для преодоления указанной проблемы в настоящем изобретении разработан состав (содержащий определенные эксципиенты) и способ прямого прессования (исключающий влажную грануляцию) для обеспечения требуемых свойств таблетки, например, твердости, ломкости, устойчивости к расслаиванию и улучшенной стабильности активного компонента. Метформин обычно получают влажной грануляцией с высоким содержанием лекарственного средства, что является весьма затруднительным. Известно также, что ротационное прессование применять нельзя вследствие неудовлетворительной способности к прессованию, а также не рекомендуется использовать прямое прессование для получения составов с высоким содержанием лекарственного средства. Известными проблемами являются низкая способность к прессованию и высокая ломкость таблеток, и поэтому в настоящем изобретении при разработке

особое внимание уделялось этим характеристикам. Другими проблемами являются:

- Большое количество метформина, что приводит к получению больших таблеток с низким содержанием лекарственного средства LAF237;
- Метформин практически не поддается переработке;
- Метформин перерабатывают влажной грануляцией, а влага оказывает отрицательное действие на LAF».

Согласно подпункту 7 пункта 19.5.3 Правил ИЗ подтверждения известности влияния отличительных признаков на технический результат не требуется, если в отношении этих признаков такой результат не определен заявителем или в случае, когда установлено, что указанный им технический результат не достигается.

В заключении отмечено, что по независимому пункту 1 уточненной формулы для альтернативы содержания активных ингредиентов 3) (50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина) рассмотрен состав таблетки в примере 1Б и его свойства в качестве подтверждения получения технического результата. Однако для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) (50 мг вилдаглиптина и 500 мг метформина) и 2) (50 мг вилдаглиптина и 850 мг метформина) не приведены примеры, показывающие получение вышеуказанного технического результата.

Таким образом, для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) и 2) применены положения подпункта 7 пункта 19.5.3 Правил ИЗ.

По независимому пункту 27 уточненной формулы для альтернативы содержания активных ингредиентов 3) (50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина) и альтернативы включения стадии 4) смешивания замасливателя стеарата магния со смесью, полученной на стадии 3), рассмотрен пример 1Б и свойства получаемой таблетки в качестве подтверждения получения технического результата.

Однако для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) (50 мг вилдаглиптина и 500 мг метформина) и 2) (50 мг вилдаглиптина и 850 мг метформина) и для альтернативы отсутствия в способе стадии 4), не приведены примеры, показывающие получение вышеуказанного технического результата. Таким образом, для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) и 2) и альтернативы отсутствия стадии 4), применены положения подпункта 7 пункта 19.5.3 Правил ИЗ.

Что касается включения в состав таблетки, содержащей второй активный ингредиент, метформина в составе гранул, то в документе [13] раскрыт способ получения твердой пероральной дозированной формы, в частности, таблетки, содержащей метформин и глибурид, включающий стадии: а) гомогенизации глибурида в органическом растворе для получения суспензии; б) распыления суспензии на фармацевтический наполнитель; в) смешивания продукта, полученного на стадии б), с гранулами метформина; и г) формирование твердой пероральной дозированной формы метформина и глибурида ([0020]; пункт 1 формулы). В качестве фармацевтического наполнителя можно использовать, в частности, микрокристаллическую целлюлозу, а также поливинилпирролидон (Коллидон-30) и гидроксипропилцеллюлозу, которые могут быть добавлены к гомогенизированной суспензии, полученной на стадии а), для придания гранулам связывающих свойств [0018].

Согласно документу [13] таблетка может содержать 500 мг метформина (примеры 1-6), также таблетки с содержанием метформина могут быть двухслойными [0020]. В документе [13] отмечено, что желательно объединить глибурид и метформин в одну лекарственную форму, такую как таблетка, однако, хотя метформин хорошо растворяется в воде, глибурид является слабой кислотой и плохо растворяется в воде, кроме того, при объединении глибурида и метформина в единую лекарственную форму растворение глибурида дополнительно снижается из-за присутствия метформина в непосредственной близости от глибурида [0004].

Следовательно, желательно достичь комбинированной дозированной формы метформина и глибурида, которая имеет улучшенную растворимость глибурида, демонстрирует растворимость *in vitro* и/или биодоступность *in vivo*, которые сравнимы с растворимостью и/или биодоступностью глибурида, полученными при раздельном введении метформина и глибурида в одинаковых дозах [0004].

Таким образом, из документа [13] известно включение метформина в форме гранул для получения таблетки со вторым активным ингредиентом, который должен быть отделен в способе получения таблетки от взаимодействия с метформином. Однако данный прием применяется для решения другой проблемы - для предотвращения снижения растворимости глибурида в присутствии метформина, следовательно, из [13] не может быть установлена известность влияния отличительных признаков на получение технического результата для альтернативы содержания активных ингредиентов 3) и для альтернативы осуществления способа с включением стадии 4).

В документе [7] раскрыто то, что соединения-ингибиторы DPP-IV, особенно соединения формулы I, IA или IB, включающие LAF237 (вилдаглиптин), гигроскопичны, вызывают проблемы со стабильностью и по своей природе не сжимаются, следовательно, существует потребность в создании сыпучей и когезивной композиции, способной непосредственно прессоваться в прочные таблетки с приемлемым профилем растворения *in vitro* (с.6, абзац 3; с. 11, абзац 1). Таблетку, содержащую LAF237 получают прямым прессованием, и она может содержать от примерно 10% до примерно 40% связующего агента, такого как целлюлозы и их производные, например микрокристаллическая целлюлоза, гидроксипропилцеллюлоза, гидроксипропилметилцеллюлоза (с. 18, абзац 3). Композиция может содержать от 20 до 120 мг LAF237 или его фармацевтически приемлемой кислотно-аддитивной соли (с.19, абзац 1).

Способ получения таблетки прямого прессования по уточненному варианту формулы изобретения оспариваемого патента включает: (а) смешивание в процентах по массе в пересчете на массу в сухом состоянии: (i) 25-35% ингибитора DPP-IV, например LAF237, в пересчете на массу в сухом состоянии; (ii) 40-95% по массе фармацевтически приемлемого разбавителя в пересчете на массу в сухом состоянии; (iii) 0-10% фармацевтически приемлемого разрыхлителя в пересчете на массу в сухом состоянии; и (iv) 0,25-6% фармацевтически приемлемого замасливателя, такого как стеарат магния, в пересчете на массу в сухом состоянии для получения композиции ингибитора DPP-IV в форме порошка для таблетирования, который можно непосредственно прессовать в таблетку; а также (б) прессование композиции, приготовленной на стадии (а), с образованием прессованной таблетки ингибитора DPP-IV (с. 17, абзац 3; пункт 35 формулы).

Таблетки по документу [7], полученные с помощью прямого прессования, имеют низкую хрупкость, хорошую прочность на разрыв, оптимальное соотношение толщины таблетки к массе таблетки, меньшее содержание воды в рецептуре, хорошее время диспергирования, хорошее качество диспергирования (с.24, абзац 7). Согласно документу [7] по меньшей мере 60% частиц вилдаглиптина имеют размер менее 250 мкм, предпочтительно от 10 до 250 мкм (пункты 15, 18 формулы). Таблетка по документу [7] может состоять из слоев (с.77, абзац 3). Отношение толщины таблетки к массе таблетки составляет от 0,002 до 0,06 мм/мг, предпочтительно от 0,01 до 0,03 мм/мг (пункт 16 формулы).

Таким образом, из документа [7] известно, что таблетку, содержащую вилдаглиптин, получают прессованием со связующим агентом, и известны также масса вилдаглиптина, которую можно включить в состав таблетки, используемое количество связующего агента для получения таблетки, и вышеуказанные преимущества составов таблетки.

Однако изобретение по уточненной формуле направлено на решение другой проблемы - на получение композиции вилдаглиптина, способной непосредственно прессоваться в прочные таблетки с приемлемым профилем растворения, и в документе [7] не рассматривается получение композиции, дополнительно содержащей до 1000 мг метформина, следовательно, из документа [7] не может быть установлена известность влияния отличительных признаков на получение технического результата для альтернативы содержания активных ингредиентов 3) и для альтернативы осуществления способа с включением стадии 4).

В документе [9] раскрыт способ получения композиции гидрохлорида метформина, которая может быть спрессована для получения таблетки, включающий гранулирование гидрохлорида метформина и гидрофобного полимера и/или другого гидрофобного материала путем грануляции из горячего расплава или экструзии и сушку гранулированного продукта, причем водный или органический растворитель, используемый на стадии гранулирования, содержит связующий агент, и композиция может содержать от 1 до 15 мас.% связующего агента, такого как гидроксипропилцеллюлоза (с.5, строки 3-11; пункты 1, 6-10 формулы). Композиция может содержать 1000 мг метформина, при этом в документе [9] приведены сведения о композициях, содержащих 850 мг метформина (с. 1, строки 19-26; пункт 2 формулы).

Однако в документе [9] не рассматривается получение композиции, дополнительно содержащей вилдаглиптин, и из [9] не может быть установлена известность влияния отличительных признаков на получение технического результата для альтернативы содержания активных ингредиентов 3) и для альтернативы осуществления способа с включением стадии 4).

В документе [14] раскрыта пероральная система доставки, которая может представлять собой гранулу, содержащая метформин в составе ядра и слой, включающий розиглитазон или сульфонилмочевину, причем система доставки может содержать мелкокристаллическую целлюлозу в качестве связующего

агента и наполнителя в количестве 0-30 мас.% или 3-10 мас.% ([0047, 0048, 0061, 0066]; пункты 17, 30, 31 формулы). Однако в [14] не рассматривается получение композиции, дополнительно содержащей вилдаглиптин, и из [14] не может быть установлена известность влияния отличительных признаков на получение технического результата для альтернативы содержания активных ингредиентов 3) и для альтернативы осуществления способа с включением стадии 4).

При этом в соответствии с вышеприведенными доводами в отношении технического результата отличительные признаки изобретений по независимым пунктам 1 и 27, а также по зависимым пунктам 2, 3, 5, 6, 16 известны из документов [13], [7], [9], [14], и изобретения по независимым пунктам 1 для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) и 2) и по независимым пунктам 27 для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) и 2) и альтернативы отсутствия стадии 4) не соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. пункт 19.5.3 Правил ИЗ).

Признаки изобретений по зависимым пунктам 2-25, 29-32, 34, 35 также известны из документов [1], [13], [7], [9], [14], и их включение в соответствующие независимые пункты для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) и 2) и альтернативы отсутствия стадии 4) не приведет к изменению вывода о несоответствии изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. пункт 19.5.3, подпункты (1) и (7) Правил ИЗ).

Что касается признаков зависимого пункта 26 уточненной формулы, в отношении включения дополнительного активного ингредиента, которым являются сульфонилмочевины или глитазон, такой как пиоглитазон или розиглитазон, то согласно публикации [1] композиция может содержать вилдаглиптин и противодиабетическое средство, такое как пиоглитазон или розиглитазон, в качестве альтернативы метформину (пункт 10 формулы), и из документа [14] известна таблетка, содержащая метформин и розиглитазон или сульфонилмочевину (пункты 17, 31 формулы). Соответственно, вилдаглиптин,

метформин и сульфонилмочевины или глитазон могут быть применены совместно в составе таблетки.

Таким образом, признаки изобретения по зависимым пунктам 26 уточненной формулы изобретения по оспариваемому патенту известны из документов [1] и [14], и их включение в независимый пункт 1 уточненной формулы для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) и 2) не приведет к изменению вывода о несоответствии изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. пункт 19.5.3, подпункты (1) и (7) Правил ИЗ).

Что касается признаков зависимого пункта 28 уточненной формулы, в отношении того, что гранулы высушивают до величины потерь воды при высушивании (LOD) 0,5-3,5%, то из документа [15] известно определение потерь при высушивании для гранул лактозы-гидроксипропилметилцеллюлозы: содержание влаги в гранулах, полученных из расплава гидроксипропилметилцеллюлозы, меньше начального значения 0,91% (с.921, прав, кол., абзац 2; с.922, таблица 3).

Таким образом, признаки изобретения по зависимому пункту 28 уточненной формулы известны из документа [15], и их включение в независимый пункт 2 для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) и 2) и альтернативы отсутствия стадии 4) не приведет к изменению вывода о несоответствии изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. пункт 19.5.3, подпункты (1) и (7) Правил ИЗ).

Что касается признаков зависимого пункта 33 уточненной формулы изобретения по оспариваемому патенту, в отношении температуры в экструдере, то из документа [16] известно нагревание смеси до 200°C перед экструзией (пункты 15, 17 формулы).

Таким образом, признаки изобретения по зависимому пункту 33 уточненной формулы известны из документа [16], и их включение в независимый пункт 2 для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) и

2) и альтернативы отсутствия стадии 4) не приведет к изменению вывода о несоответствии изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см пункт 19.5.3, подпункты (1) и (7) Правил ИЗ).

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.3.(3) Правил ИЗ не могут быть признаны соответствующими изобретательскому уровню изобретения, основанные на изменении количественного признака (признаков), представлении таких признаков во взаимосвязи, либо изменении ее вида, если известен факт влияния каждого из них на технический результат и новые значения этих признаков или их взаимосвязь могли быть получены исходя из известных зависимостей, закономерностей.

Что касается признаков зависимых пунктов 36 и 37 уточненной формулы оспариваемого патента, в отношении твердости, ломкости, толщины таблетки и растворимости вилдаглиптина и гидрохлорида метформина, то согласно документу [13] комбинированная дозированная форма, содержащая метформин, должна демонстрировать растворимость *in vitro* и/или биодоступность *in vivo*, которые сравнимы с таковыми, полученными при введении той же дозировки коммерчески доступных таблеток, содержащих метформин и глибурид [0004].

При этом из документа [7] известно соотношение массы к толщине для таблетки вилдаглиптина (пункт 16 формулы), а таблетки по документу [7], полученные с помощью прямого прессования, имеют низкую хрупкость, хорошую прочность на разрыв, оптимальное соотношение толщины таблетки к массе таблетки, меньшее содержание воды в рецептуре, хорошее время диспергирования, хорошее качество диспергирования (см. с. 24, абзац 7).

Из документа [17] известен типоразмерный ряд таблеток и соотношение массы и диаметра таблетки (с.315-317, таблицы 14.2 и 14.3). При этом количественные признаки твердости, ломкости, толщины таблетки и растворимости обусловлены ингредиентами таблетки и их количественным

содержанием, то есть присущи таблеткам с определенным качественным и количественным составом.

Выше рассмотрена известность признаков, относящихся к составу композиции по пунктам 1-2 на основе сведений документов [1], [13], [7], [9], [14]. При этом документы [13], [7] и [17] показывают взаимосвязь признаков твердости, ломкости, толщины таблетки и растворимости с составом таблеток.

Таким образом, признаки изобретений по зависимым пунктам 36 и 37 уточненной формулы оспариваемого патента находятся во взаимосвязи с составом таблетки, признаки которого рассмотрены на основе сведений из документов [1], [13], [7], [9], [14]. Такая взаимосвязь могла быть получена исходя из сведений, содержащихся в документах [13], [7] и [17], и включение признаков изобретений по зависимым пунктам 36 и 37 в независимый пункт 1 уточненной формулы для альтернатив содержания активных ингредиентов 1) и 2) не приведет к изменению вывода о несоответствии изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. пункт 19.5.3 подпункты (1), (3) и (7) Правил ИЗ).

Кроме того, в заключении говорится о нарушении положений, установленных подпунктом 2 пунктом 3.3.2.5 Правил ИЗ. Так, согласно подпункту 2 пункта 3.3.2.5 Правил ИЗ изложение зависимого пункта начинается с указания родового понятия, изложенного, как правило, сокращенно по сравнению с приведенным в независимом пункте, и ссылки на независимый пункт и/или зависимый пункт, к которому относится данный зависимый пункт, после чего приводятся признаки, характеризующие изобретение в частных случаях его выполнения или использования.

При этом зависимый пункт 36 уточненной формулы изобретения по оспариваемому патенту относится к фармацевтическому составу в форме таблетки и включает ссылку на пункты формулы 1 и 2, которые, в свою очередь, относятся к фармацевтической композиции.

Зависимый пункт 37 уточненной формулы относится к таблетке и включает ссылку на пункт 36 уточненной формулы. Таким образом, родовое понятие, указанное в зависимых пунктах 36 и 37 уточненной формулы отличается от указанного в пунктах 1 и 2 уточненной формулы, что нарушает положения полпункта 2 пункта 3.3.2.5 Правил ИЗ.

Данное заключение было направлено в адреса сторон спора.

Ознакомившись с представленным экспертным заключением, патентообладатель ходатайствовал об очередной корректировке ранее уже уточненной им формулы изобретения по оспариваемому патенту, предлагая сохранить патент в отношении одного альтернативного варианта, касающегося содержания активных ингредиентов в композиции 50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина.

При этом лицо, подавшее возражение высказалось против очередной корректировки формулы, мотивируя тем, что очередное уточнение формулы изобретения не приведет к признанию его патентоспособности, а также является злоупотреблением права.

При этом анализ доводов сторон показал, что указанная альтернатива, характеризующая содержание активных ингредиентов в композиции 50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина известна из табл. 7 и 8 публикации [1].

Так, в таблице 7 публикации [1] раскрыто соотношение содержания вилдаглиптина к метформину в композиции от 4:1 до 1:60. При этом соотношение вилдаглиптина к метформину в рассматриваемой альтернативе по уточненной формуле, содержащей 50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина при простом математическом расчете (50 относится к 1000 так, как 1 к 20, поскольку $1000:50 = 20$) показывает, что данное соотношение (1:20) является частью известного из таблицы 7 публикации [1] диапазона (от 4:1 до 1:60).

Кроме того, из таблицы 8 публикации [1] известно содержание в композиции вилдаглиптина от 25 до 1000 мг и метформина от 250 до 1500 мг. Таким образом, содержание 50 мг вилдаглиптина и 1000 мг метформина по

уточненной патентообладателем формуле также является частью известных из публикации [1] (табл. 8) диапазонов: вилдаглиптина от 25 до 1000 мг и метформина от 250 до 1500мг.

Таким образом, можно констатировать, что группе изобретений, охарактеризованных в формуле оспариваемого патента (см. выше) и во всех предлагаемых патентообладателем вариантах корректировки формулы, не может быть предоставлена правовая охрана ввиду несоответствия всех альтернативных совокупностей признаков условиям патентоспособности новизна (альтернатива 3) и изобретательский уровень (альтернативы 1 и 2) (см. пункт 1 статьи 4 Патентного закона, пункты 19.5.2 и 19.5.3 Правил ИЗ).

От патентообладателя поступила 11.11.2021 корреспонденция, в которой содержится информация о важности препаратов, разработанных патентообладателем и внедренных в производственную и медицинскую деятельность, а также сведения технического характера, по сути, повторяющие доводы патентообладателя, изложенные в его отзыве и устных выступлениях на заседаниях коллегий.

Патентообладатель считает не подкрепленным законодательно процедуру направления уточненной им формулы изобретения на дополнительный информационный поиск.

Патентообладатель высказал несогласие с выводом, сделанным в заключении по результатам дополнительного информационного поиска о том, что группа изобретений по уточненной формуле не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» и отметил, что изобретение могло сохранить свою правовую охрану в рамках патентоспособной альтернативы 3) независимого пункта 1 уточненной формулы.

В ответ на приведенные в данной корреспонденции доводы можно отметить следующее.

Сведения информационного характера о значимой важности разработок патентообладателя в области здравоохранения не влияют на оценку патентоспособности изобретения по оспариваемому патенту.

Направление материалов заявки, содержащей наряду с доводами лица, подавшего возражение и патентообладателя, уточненную формулу изобретения, не приводит к нарушению действующего законодательства, в том числе Правил ППС, поскольку ни в одном из нормативно-правовых документов, в том числе и Правилах ППС, не содержится запретительной нормы в отношении осуществления при необходимости дополнительного информационного поиска и подготовки экспертного заключения по его результатам.

Более того, необходимость проведения экспертизы по существу, включающей осуществление информационного поиска и оценку патентоспособности, следует из пункта 2 статьи 1386 и пункта 1 статьи 1350 Гражданского кодекса Российской Федерации.

Что касается приведенных в упомянутой корреспонденции доводов технического характера, то они, по своей сути повторяют доводы, приведенные в отзыве, которые проанализированы и освещены в настоящем заключении выше.

Дополнительно можно обратить внимание, что решение Роспатента, в случае его принятия, вступает в силу со дня принятия и может быть оспорено в суде в установленном законом порядке (см. статья 1248 пункт 2 Гражданского кодекса Российской Федерации).

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

удовлетворить возражение, поступившее 15.03.2021, патент Российской Федерации на изобретение № 2483716 признать недействительным полностью.