

ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии по результатам рассмотрения
☒ возражения ☐ заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 Гражданского Кодекса Российской Федерации (далее – Кодекс) и Правилами подачи возражений и заявлений и их рассмотрения в Палате по патентным спорам, утвержденными приказом Роспатента от 22.04.2003 № 56, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 08.05.2003 № 4520 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение на решение об отказе в выдаче патента на изобретение по заявке № 2011115712/15, поданное компанией НОВАРТИС, Швейцария (далее – заявитель), поступившее 30.10.2014. При этом установлено следующее.

Заявлена группа изобретений «Комбинации с фиксированной дозой алискирена и амлодипина в форме двухслойных или однослойных таблеток», совокупность признаков которых изложена в формуле, представленной в корреспонденции от 14.04.2014, в следующей редакции:

1. Однослойная таблетка, включающая:

а) терапевтически эффективное количество алискирена или его фармацевтически приемлемой соли, предпочтительно полуфумарата указанного соединения,

б) терапевтически эффективное количество амлодипина или его фармацевтически приемлемой соли, предпочтительно безилата указанного соединения, и

дезинтегрирующий агент в количестве от 2 до 15 мас.%, в расчете на массу таблетки, где

таблетка характеризуется профилем растворения *in vitro* компонента

а) 60% или менее через 10 мин и 98% или менее через 20 мин, и профилем растворения компонента

б) 50% или более через 20 мин и 70% или более через 30 мин при рН 2.

2. Таблетка по п. 1, в которой дезинтегрирующий агент содержится в количестве от 2 до 12 мас.%.

3. Таблетка по п. 1, в которой дезинтегрирующий агент содержится в количестве 4, 7, или 10 мас.%.

4. Таблетка по п. 1, включающая включающая дезинтегрирующий агент в количестве от 2 до 15% в расчете на массу таблетки, связующий агент в количестве в интервале от 0,5% до 15% в расчете на массу таблетки, разбавитель в количестве в интервале от 1% до 60% в расчете на массу таблетки, причем указанное массовое процентное содержание определяют до необязательного нанесения любого пленочного покрытия.

5. Таблетка по п. 1, в которой дезинтегрирующий агент содержится в слое, включающем компонент (а), в количестве в интервале от приблизительно 0,5% до приблизительно 20%, предпочтительно от приблизительно 1% до приблизительно 15%, и указанное массовое процентное содержание определяют до необязательного нанесения любого пленочного покрытия.

6. Таблетка по п. 1, в которой дезинтегрирующий агент содержится в слое, включающем компонент (б), в количестве в интервале от приблизительно 1% до приблизительно 20%, предпочтительно от приблизительно 2% до приблизительно 10%, и указанное массовое процентное содержание определяют до необязательного нанесения любого пленочного покрытия.

7. Таблетка по п. 1, содержащая дезинтегрирующий агент, который выбирают из группы, включающей кальциевую соль карбоксиметилцеллюлозы (КМЦ-Са), натриевую соль карбоксиметилцеллюлозы (КМЦ-Na), сшитый ПВП, альгиновую кислоту, альгинат натрия и гуаровую камедь, наиболее предпочтительно сшитый ПВП (CROSPOVIDONE), сшитую КМЦ (Ac-Di-Sol), натриевую соль карбоксиметилкрахмала (PIRIMOJEL и EXPLOTAB).

8. Таблетка по п. 1, включающая дезинтегрирующий агент, которым является кросповидон.

9. Таблетка по п. 1, причем содержание компонента (а) находится в интервале от 75 до 300 мг, предпочтительно 300 мг свободного основания.

10. Таблетка по п. 1, причем содержание компонента (б) находится в интервале от 1 до 20 мг, предпочтительно 10 мг.

11. Применение таблетки по любому из предшествующих пунктов для лечения гипертензии, застойной сердечной недостаточности, стенокардии, инфаркта миокарда, атеросклероза, диабетической нефропатии, диабетической сердечной миопатии, почечной недостаточности, заболевания периферических сосудов, гипертрофии левого желудочка, дисфункции познавательной способности, инсульта, головной боли и хронической сердечной недостаточности, прежде всего, гипертензии.

12. Способ однослойной таблетки с фиксированной дозой по любому из п.п. 1-10, включающий следующие стадии:

(1) грануляция компонента (а) в смеси крайней мере с одной фармацевтически приемлемой добавкой, включающей дезинтегрирующий агент, необязательно в присутствии жидкости для грануляции, при этом получают гранулят алискирена,

(2) грануляция компонента (б) в смеси по крайней мере с одной фармацевтически приемлемой добавкой, включающей дезинтегрирующий агент, при этом получают гранулят амлодипина,

(3) необязательно высушивание соответствующих полученных гранулятов,

(4) просеивание соответствующих гранулятов,

(5) необязательно смешивание соответствующих гранулятов с эксципиентами внешней фазы,

(6) смешивание соответствующих гранулятов,

(7) просеивание материала, полученного на стадии (6),

(8) необязательно, смешивание просеянного на стадии (7) материала с дополнительными фармацевтически приемлемыми добавками, включающими дезинтегрирующий агент,

(9) прессование смеси, полученной на стадии (8) с получением однослойной таблетки и

(10) необязательно, нанесение пленочного покрытия на полученную однослойную таблетку».

По результатам рассмотрения по существу данной заявки Роспатентом 25.04.2014 было принято решение об отказе в выдаче патента на изобретение из-за несоответствия заявленной группы изобретений, состоящей из трех независимых пунктов 1, 11, 12 условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В решении отмечено, что в международной публикации WO 2008/061622 от 29.05.2008 (далее публикация – [1]) раскрыты кристаллические формы алискирена полуфумарата, которые можно в терапевтически эффективных количествах использовать для получения фармацевтических препаратов, например, в виде таблетки (с содержанием алискирена от 75 до 300 мг), в комбинации, например, с амлодипином (например, амлодипина безилатом, с. 20, абзац 5), с содержанием дезинтегрирующего агента в количестве от 0 до 20%.

В публикации [1] также содержатся сведения о возможности включения в таблетку связующего агента в количестве от 0 до 20% и разбавителя – от 0 до 80% в расчете на массу таблетки. При этом в качестве дезинтегрирующего агента могут быть использованы следующие вещества: кальциевая соль карбоксиметилцеллюлозы, натриевая соль карбоксиметилцеллюлозы, сшитый поливинилпирролидон (кросповидон), сшитая карбоксиметилцеллюлоза, альгиновая кислота, альгинат натрия и гуаровая камедь (с. 26, абзац 3), как указано в зависимых пп.2-4, 7-9).

Указанные препараты применяются для лечения гипертензий, застойной сердечной недостаточности, стенокардии, инфаркта миокарда, атеросклероза, диабетической нефропатии, диабетической сердечной миопатии, почечной недостаточности, заболевания периферических сосудов, гипертрофии левого желудочка, дисфункции познавательной способности,

инсульта, головной боли и хронической сердечной недостаточности (публикация [1], стр. 15-16).

Кроме того, в публикации [1] раскрыт способ получения таких композиций, который состоит из следующих стадий: 1) грануляция кристаллической формы алискирена (компонента (а)) в смеси с фармацевтически приемлемыми добавками, в присутствии жидкости для грануляции; 2) высушивание полученного гранулята; 3) смешивание гранулята с эксципиентами внешней фазы, включающими дезинтегрирующий агент, 4) прессование смеси с получением таблетки, 5) необязательно нанесение пленочного покрытия на полученную таблетку.

При этом отличие заявленной группы изобретений по независимым пунктам 1, 11 формулы от раскрытого в публикации [1] ближайшего аналога отличается тем, что представляет собой однослойную таблетку, а также характеризуется профилем растворения *in vitro* компонента а) 60% или менее через 10 мин и 98% или менее через 20 мин, и профилем растворения компонента б) 50% или более через 20 мин и 70% или более через 30 мин при рН 2.

Изобретение по независимому пункту 12 формулы отличается от ближайшего аналога включением следующих стадий: грануляция компонента (б) в смеси по крайней мере с одной фармацевтически приемлемой добавкой, включающей дезинтегрирующий агент, при этом получают гранулят амлодипина, просеивание соответствующих гранулятов, смешивание соответствующих гранулятов, просеивание материала, полученного на стадии (б).

Однако, как отмечено в решении, из патентного документа US 2006/0018960 (далее – [2]) известны твердые пероральные дозированные формы, содержащие алискирен в виде полуфумарата в количестве от 83 до 332 мг (с. 8, п. 2 формулы), дезинтегрирующий агент в количестве от 0 до 20% (с.4) и характеризующийся профилем растворения *in vitro* алискирена от 27 до 56% через 10 мин и 53 до 94% через 20 мин при рН 2 (с.8, п. 1 формулы).

Из патентного документа ЕА 006826, от 28.04.2006 (далее – [3]) известна таблетки безилата амлодипина в количестве от 2,5 до 10 мг, содержащие в составе дезинтегрирующий агент в количестве от 1 до 5%.

Из международной публикации WO 03/032954, от 24.04.2003 (далее – [4]) известен профиль растворения таблетки амлодипина безилата 10 мг при рН 2,1, который составляет 72% через 20 мин и 80% через 30 мин.

Также в публикации [4] указан процесс изготовления препарата амлодипина, который содержит следующие стадии: гранулирование амлодипина (компонента (б)) в смеси по крайней мере с одной фармацевтически приемлемой добавкой, включающей дезинтегрирующий агент; сушка, просеивание гранулята, смешивание полученного материала с дополнительными фармацевтически приемлемыми добавками, прессование полученной смеси.

В соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса заявитель представил возражение на решение Роспатента об отказе в выдаче патента Российской Федерации на изобретение.

В возражении отмечено, что до даты приоритета заявленной группы изобретений для специалистов данной области не являлось очевидным возможность объединения алискирена и амлодипина в единую дозированную форму в виде однослойной таблетки. Профиль растворения активных веществ при растворении полученной таблетки будет соответствовать таковому при растворении данных веществ по отдельности и определять степень биоэквивалентности созданной дозированной формы в отношении эффекта, полученного при раздельном введении указанных активных веществ.

По мнению заявителя предложенная группа изобретений соответствует условиям патентоспособности.

На основании изложенных в возражении доводов заявитель просит отменить решение Роспатента.

Изучив материалы дела, коллегия установила следующее.

С учетом даты международной подачи заявки (22.09.2009), правовая база для оценки патентоспособности предложенной группы изобретений включает Кодекс, Административный регламент исполнения Федеральной службой по интеллектуальной собственности, патентам и товарным знакам государственной функции по организации приема заявок на изобретение и их рассмотрения, экспертизы и выдачи в установленном порядке патентов Российской Федерации на изобретение, утвержденного приказом Министерства образования и науки РФ от 29 октября 2008 № 327, зарегистрированного в Минюсте РФ 20 февраля 2009, рег. № 13413 (далее – Регламент ИЗ).

В соответствии с пунктом 3.4 Правил ППС лицо, подавшее возражение, вправе отозвать поданное возражение на любом этапе его рассмотрения по существу на заседании коллегии палаты по патентным спорам. В этом случае делопроизводство по возражению прекращается.

На дату заседания коллегии (03.12.2015) от лица, подавшего возражение, поступило ходатайство об отзыве возражения.

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

прекратить делопроизводство по возражению, поступившему 30.10.2014 на решение Роспатента от 25.04.2014 об отказе в выдаче патента на изобретение по заявке № 2011115712/15.