

ЗАКЛЮЧЕНИЕ
по результатам рассмотрения возражения заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 1 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 231-ФЗ, в редакции действующей на дату подачи возражения и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности споров в административном порядке, утвержденными приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020 г. № 644/261, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020 № 59454, с изменениями, внесенными приказом Минобрнауки России и Минэкономразвития России от 23.11.2022 № 1140/646 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение Общества с ограниченной ответственностью «ФармВектор», Российская Федерация (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее 09.11.2023, против выдачи патента Российской Федерации на группу изобретений № 2345993, при этом установлено следующее.

Патент Российской Федерации № 2345993 на группу изобретений «ЛАКТАМСОДЕРЖАЩЕЕ СОЕДИНЕНИЕ И ЕГО ПРОИЗВОДНЫЕ В КАЧЕСТВЕ ИНГИБИТОРОВ ФАКТОРА Ха» по заявке № 2004112191 с конвенционным приоритетом от 21.09.2001 согласно заявке US 60/324,165, выдан на имя БРИСТОЛ МАЕРС СКВИББ КОМПАНИ (США).

Согласно записи в Государственном реестре от 06.03.2017, в соответствии с государственной регистрацией договора об отчуждении исключительного права РД0217792, приобретателем исключительного права является Бристол-Майерс Сквибб Холдингс Айрлэнд (СН).

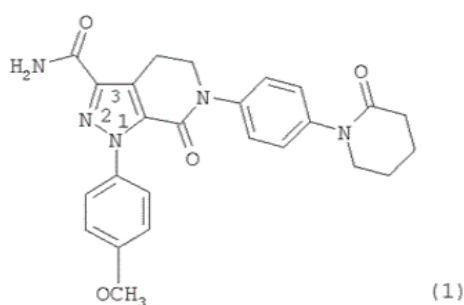
Согласно записи в государственном реестре от 22.03.2021 (Бюл. № 9) об изменении наименования патентообладателя, в настоящее время патентообладателем является Бристол-Майерс Сквибб Холдингс Айеленд Анлимитед Компани (СН) (далее – патентообладатель).

Дата подачи заявки № 2004112191 установлена по дате подачи международной заявки PCT/US02/29491 от 17.09.2002.

Согласно записи в Государственном реестре от 27.08.2012 срок действия патента на изобретение по пунктам 1-16 формулы, на основании заявления патентообладателя, продлен до 03.02.2027.

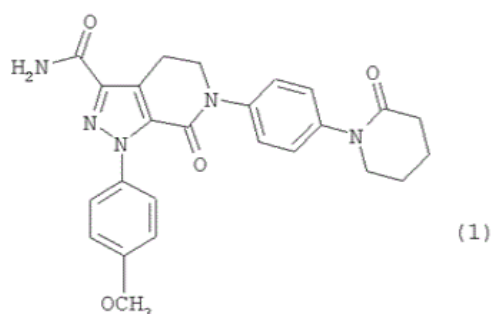
На дату подачи возражения патент действует со следующей формулой изобретения:

1. Соединение формулы 1:



или его фармацевтически приемлемая соль.

2. Соединение по п. 1, представляющее собой соединение формулы 1



3. Соединение по п. 1 или 2, предназначенное для лечения тромбоемболического заболевания.

4. Соединение по п. 1 или 2, предназначенное для изготовления медикамента для лечения тромбоемболического заболевания.

5. Соединение по п. 3 или 4, отличающееся тем, что тромбоемболическое заболевание представляет собой заболевание из группы,

состоящей из артериальных сердечно-сосудистых тромбоэмболических заболеваний, венозных сердечно-сосудистых тромбоэмболических заболеваний и тромбоэмболических заболеваний в камере сердца.

6. Соединение по п. 3 или 4, отличающееся тем, что тромбоэмболическое заболевание представляет собой острый коронарный синдром.

7. Соединение по п. 3 или 4, отличающееся тем, что тромбоэмболическое заболевание представляет собой инфаркт миокарда, переходное ишемическое нарушение или инсульт.

8. Соединение по п. 3 или 4, отличающееся тем, что тромбоэмболическое заболевание представляет собой глубокий тромбоз вены.

9. Соединение по п. 3 или 4, отличающееся тем, что тромбоэмболическое заболевание представляет собой легочную эмболию.

10. Фармацевтическая композиция для лечения тромбоэмболического заболевания, содержащая фармацевтически приемлемый носитель и терапевтически эффективное количество соединения формулы (1) по п.1 или его фармацевтически приемлемой соли.

11. Фармацевтическая композиция для лечения тромбоэмболического заболевания, содержащая фармацевтически приемлемый носитель и терапевтически эффективное количество соединения по п. 2.

12. Фармацевтическая композиция по п. 10 или 11, отличающаяся тем, что тромбоэмболическое заболевание представляет собой заболевание, выбранное из группы, состоящей из артериальных сердечно-сосудистых тромбоэмболических заболеваний, венозных сердечно-сосудистых тромбоэмболических заболеваний и тромбоэмболических заболеваний в камере сердца.

13. Фармацевтическая композиция по п. 10 или 11, отличающаяся тем, что тромбоэмболическое заболевание представляет собой острый коронарный синдром.

14. Фармацевтическая композиция по п. 10 или 11, отличающаяся тем, что тромбоэмболическое заболевание представляет собой инфаркт миокарда, переходное ишемическое нарушение или инсульт.

15. Фармацевтическая композиция по п. 10 или 11, отличающаяся тем, что тромбоэмболическое заболевание представляет собой глубокий тромбоз вены.

16. Фармацевтическая композиция по п. 10 или 11, отличающаяся тем, что тромбоэмболическое заболевание представляет собой легочную эмболию.

Против выдачи данного патента в соответствии с пунктом 1 статьи 1398 указанного выше Кодекса поступило возражение, мотивированное несоответствием изобретения по оспариваемому патенту (независимый пункт 1 (соединение) и зависимые пункты 13-16) условию патентоспособности «промышленная применимость», а также несоответствием изобретений по независимому пункту 1 и зависимому пункту 2 условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень».

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

- патентный документ WO00/39131, дата публикации 06.07.2000 (далее – [1]).

Суть доводов возражения в отношении несоответствия изобретения по независимому пункту 1 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «промышленная применимость», сводится к следующему.

По мнению лица, подавшего возражение, данных *in vitro* о константе ингибирования, недостаточно для специалиста, чтобы делать какие-либо выводы о возможности применения соединения по пункту 1 формулы оспариваемого патента в соответствии с назначением, указанным в пунктах 13-16 формулы, поскольку, лекарственное средство, как правило, не сразу попадает в кровь после введения (например, перорального введения), может

подвергаться преобразованиям в печени (инактивации), а возможность достижения необходимой концентрации в крови зависит от многих факторов (растворимость, доза, способность всасывания, связывание с белками плазмы, инактивация печенью и почками и т. п.).

Кроме того, как известно специалистам в данной области техники, помимо целевого действия, биологически активные вещества почти всегда характеризуются побочным и токсическим действием. Однако в отношении соединения по пункту 1 формулы изобретения на дату приоритета отсутствовали какие-либо сведения, свидетельствующие, что эффективная концентрация соединения ниже токсической, без чего невозможно использовать это соединение в фармацевтике.

Кроме того, в возражении отмечено, что после перехода международной заявки на национальную фазу в описание изобретения заявитель внес таблицу 9, отсутствовавшую в первоначальных материалах заявки (с. 176).

В этой связи, по мнению лица, подавшего возражение, изобретения по пунктам 1, 13-16 формулы не соответствуют условию патентоспособности «промышленная применимость».

Суть доводов возражения в отношении несоответствия соединения по независимому пункту 1 и зависимому пункту 2 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «новизна», сводится к следующему.

В патентном документе [1] (точным переводом которой на русский язык является публикация заявки ЕА200100688) раскрыто химическое соединение, которому присущи все без исключения признаки соединения по пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента.

Кроме того, в патентном документе [1] особо отмечено, что радикал G в предпочтительных вариантах может принимать значения, идентичные таковым для соединения по пункту 1 и 2 формулы оспариваемого патента.

По мнению лица, подавшего возражение, возможность получения соединения, имеющего структуру соединения по пунктам 1 и 2 формулы подтверждена примерами 13 и 17 в описании к патентному документу [1].

Таким образом, соединение по пункту 1 и 2 формулы оспариваемого патента не соответствует условию патентоспособности «новизна».

Суть доводов возражения в отношении несоответствия изобретения по независимому пункту 1 и зависимому пункту 2 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «изобретательский уровень», сводится к следующему.

По мнению лица, подавшего возражение, в патентном документе [1] раскрыты все без исключения признаки, характеризующие соединение по пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента.

При этом отмечено, что известные из патентного документа [1] соединения описаны с помощью общей структурной формулы.

Вместе с тем лицо, подавшее возражение, констатирует, что индивидуальное соединение по пункту 1 и 2 формулы оспариваемого патента не было описано в патентном документе [1] как специально полученное и исследованное.

В возражении отмечено, что в патентном документе [1] раскрыто, что известная группа соединений, также, как и соединение по пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента, может быть использована для лечения тех же самых тромбоемболических нарушений, которые указаны в пунктах 13-16 формулы изобретения.

Лицо, подавшее возражение, отмечает, что в патентном документе [1] приводится идентичная методика определения K_i и также, как и в оспариваемом патенте, указано, что соединения демонстрируют значения K_i менее 0,001 мкМ, т. е. менее 1 нМ.

Эффективные дозы для лечения, указанные в патентном документе [1] совпадают с таковыми, указанными в описании к оспариваемому патенту.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, соединение по пункту 1 и 2 не проявляет каких-либо неожиданных в качественном или количественном отношении свойств по сравнению с известной из патентного документа [1] группой химических соединений.

В отношении данных, представленных в таблице 9 оспариваемого патента, лицо, подавшее возражение, отмечает, что эти данные не содержались в материалах, послуживших основанием для установления приоритета и в материалах международной заявки до ее перевода на национальную фазу. По мнению лица, подавшего возражение, упомянутые данные из таблицы 9, получены позднее и не могут изменить вывод о том, что на дату подачи заявки изобретения по пунктам 1 и 2 формулы не соответствовали условию патентоспособности «изобретательский уровень» и не могли рассматриваться в качестве селективного изобретения.

От патентообладателя, уведомленного в установленном порядке о поступлении и содержании возражения, в корреспонденции, поступившей 13.03.2024 (см. также приложение №1 к протоколу заседания коллегии, состоявшегося 15.03.2024), представлен отзыв на указанное возражение.

К отзыву приложены копии следующих материалов:

- статья Donald J. P. Pinto, et al. «Discovery of 1-(4-Methoxyphenyl)-7-oxo-6-(4-(2-oxopiperidin-1-yl)phenyl)-4,5,6,7-tetrahydro-1H-pyrazolo[3,4-c]pyridine-3-carboxamide (Apixaban, BMS-562247), a Highly Potent, Selective, Efficacious, and Orally Bioavailable Inhibitor of Blood Coagulation Factor Xa». Journal of Medicinal Chemistry, 2007, Vol. 50, No. 22, p. 5339-5356 (с переводом на русский язык) (далее – [2]).

По мнению патентообладателя, описание к оспариваемому патенту содержит сведения, подтверждающие, что изобретение может быть использовано в здравоохранении, а именно, что предложенное соединение (действующее вещество лекарственного средства-антикоагулянта - селективного ингибитора фактора свертывания крови Xa, имеющего международное непатентованное наименование МНН-Апиксабан), может

быть использовано для лечения патологических состояний, опосредуемых ингибированием фактора Ха, в частности, для лечения тромбоемболических заболеваний.

Патентообладатель обращает внимание на то, что даже без информации, приведенной в таблице 9, описание изобретения содержит данные, достаточные для подтверждения возможности реализации назначения изобретения.

В отзыве отмечено, что в таблице 6 (с. 166-174) содержатся сведения о константе ингибирования K_i для соединения по независимому пункту 1 формулы изобретения оспариваемого патента (соединение по примеру 18), а именно, $K_i = 0,08$ нм.

Также патентообладатель обращает внимание на то, что в описании (с.54) указано, что соединение по оспариваемому патенту является ингибитором фактора Ха и полезно в качестве антикоагулянта для лечения или профилактики тромбоемболических заболеваний у млекопитающих, а также поясняется, что подразумевается под тромбоемболическими заболеваниями, и приведен их перечень, который охарактеризован в пунктах 5-9, 12-16 формулы изобретения.

По мнению патентообладателя, из уровня техники уже было известно о роли, которая принадлежит фактору Ха в каскаде свертывания крови, и о влиянии ингибирования фактора Ха на функционирование указанного каскада, о чем свидетельствуют сведения из раздела «Предыдущий уровень техники» описания изобретения, со ссылками на многочисленные публикации до даты приоритета изобретения.

По мнению патентообладателя, возражение не содержит каких-либо сведений, на основании которых можно было бы сделать вывод о невозможности реализации назначения соединения по пункту 1. Для усиления своей позиции патентообладатель упоминает постановление президиума Суда по интеллектуальным правам от 25 января 2021 года по делу № СИП-628/2017.

В отношении соответствия изобретений по пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень», патентообладатель сообщает следующее.

В патентном документе [1] структура, соответствующая структурной формуле соединения по пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента (апикабана), конкретно не раскрыта. При этом соединение апикабана не было получено и каким-либо образом охарактеризовано и исследовано в патентном документе [1].

Патентообладатель отмечает, что в описании к оспариваемому патенту (с. 5, неполный абзац 1) со ссылкой на патентный документ [1] специально подчеркивается, что "соединения, специально описанные в WO 00/39131, не являются частью настоящего изобретения".

Кроме того, патентообладатель отмечает, что в патентном документе [1] содержится 109 примеров. При этом в принципе отсутствуют какие-либо примеры, иллюстрирующие получение соединений, в которых структура соединений, например, в части значений радикала В соответствовала бы соответствующим фрагментам в молекуле апикабана по оспариваемому патенту.

В описании к оспариваемому патенту на страницах 166-174 представлена таблица 6, в которой приведено конкретное значение K_i для апикабана, составляющее 0,08 нм (т.е. 0,00008 мкм).

Между тем патентообладатель отмечает, что хотя в патентном документе [1] и представлены сходные сведения относительно способа определения K_i и приведены сходные интервалы значений K_i для описанных соединений в порядке увеличения их предпочтительности (с. 263, абзац 2 –с. 264, до начала абзаца 2), однако в патентном документе [1] ни для одного из соединений, проиллюстрированных в 109 примерах, в принципе не приведены какие-либо фактические сведения об их биологической

активности, в частности, сведения о фактических значениях K_i для описанных соединений в отношении фактора X_a .

По мнению патентообладателя, каждый из указанных в патентном документе [1] интервалов даже при расширительном их толковании следует рассматривать как охватывающий значения в пределах одного порядка величины. В частности, указанный как наиболее предпочтительный интервал $K_i \leq 0,001$ мкМ следует рассматривать как охватывающий значения $K_i \geq 0,001$ мкМ (т.е. ≤ 1 нМ), но $> 0,0001$ мкМ (т.е. $> 0,1$ нМ).

Таким образом, в отзыве сделан вывод о том, что соединение аписабан или его фармацевтически приемлемая соль по независимому пункту 1 и зависимому пункту 2 формулы оспариваемого патента проявляет новые свойства в количественном отношении, которые не известны для соединений общих формул, описанных в патентном документе [1].

Для усиления своей позиции патентообладатель обращает внимание на публикацию [2], четыре автора которой являются авторами изобретений по оспариваемому патенту. Публикация посвящена истории разработки и открытия аписабана.

Патентообладатель также предоставляет дополнительные экспериментальные данные, демонстрирующие, что аписабан имеет лучшее значение K_i , чем четыре соединения, описанные в патентном документе [1] (т.е. соединения примеров 6, 10, 13 и 99 [1]). Выбор соединений сравнения обусловлен тем, что они являются структурно наиболее близкими соединениями с аписабаном, поскольку они характеризуются тремя идентичными структурными особенностями с аписабаном, в то время как другие соединения из патентного документа [1] имеют только 2 или менее структурных особенностей.

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

С учетом даты подачи заявки (17.09.2002), правовая база для оценки патентоспособности изобретения включает Патентный закон Российской

Федерации от 23.09.1992 N 3517-1 с изменениями, внесенными Федеральными законами от 27.12.2000 № 150-ФЗ и от 30.12.2001 № 194-ФЗ (далее- Закон), а также Правила составления и рассмотрения заявки на выдачу патента на изобретение, утвержденные приказом Роспатента от 17.04.1998 № 82, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 22.09.1998 № 1612, с изменениями от 08.07.1999 и от 13.11.2000 (далее - Правила).

Согласно пункту 1 статьи 4 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.

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

Согласно подпункту 2 пункта 19.5.1. Правил при установлении возможности использования изобретения проверяется, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения.

Проверяется также, описаны ли в первичных материалах заявки средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в любом из пунктов формулы изобретения. При отсутствии таких сведений в материалах заявки допустимо, чтобы указанные 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.

Согласно подпункту 3 пункта 19.5.1. Правил, если установлено, что на дату приоритета изобретения соблюдены все указанные требования,

изобретение признается соответствующим условию промышленной применимости.

Согласно подпункту 1 пункта 19.5.2 Правил 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 3 пункта 19.5.2 Правил изобретение не признается соответствующим условию новизны, если в уровне техники выявлено средство, которому присущи признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в предложенной заявителем формуле изобретения, включая характеристику назначения.

Согласно подпункту 5 пункта 19.5.2 Правил если установлено, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, содержащей зависимые пункты, соответствует условию новизны, то анализ уровня техники в отношении зависимых пунктов не проводится.

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

Проверка изобретательского уровня включает:

- определение наиболее близкого аналога в соответствии с пунктом 3.2.4.2 настоящих Правил;
- выявление признаков, которыми отличается заявленное изобретение 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 в качестве аналога изобретения указывается средство того же назначения, известное из сведений, ставших общедоступными до даты приоритета изобретения.

Согласно подпункту 6 пункта 19.5.3 Правил известность влияния отличительных признаков заявленного изобретения на технический результат может быть подтверждена как одним, так и несколькими источниками информации.

Согласно подпункту 4 пункта 19.5.3 Правил условию изобретательского уровня соответствуют, в частности:

- индивидуальное соединение, подпадающее под общую структурную формулу группы известных соединений, но не описанное как специально полученное и исследованное, и при этом проявляющее новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении (селективное изобретение).

Согласно статье 20 Закона, в течение двух месяцев, с даты поступления заявки, заявитель имеет право внести в ее материалы исправления и уточнения без изменения сущности заявленного изобретения.

Исправления и уточнения могут быть представлены по заявке на изобретение и по истечении указанного срока, но не позднее вынесения решения по результатам экспертизы по существу.

Согласно подпункту 4 пункта 20 Правил при поступлении дополнительных материалов, представленных заявителем по собственной инициативе или по запросу Патентного ведомства и принятых к рассмотрению, проверяется не изменяют ли они сущность заявленного изобретения.

Дополнительные материалы признаются изменяющими сущность заявленного изобретения, если они содержат подлежащие включению в формулу признаки, отсутствующие в первоначальных материалах заявки.

Дополнительные материалы, содержащие отсутствующие в первоначальных материалах заявки сведения о заявленном изобретении, не

относящиеся к признакам, подлежащим включению в формулу, не считаются изменяющими сущность изобретения. К таким сведениям могут быть отнесены, в частности, новые (дополнительные) сведения об условиях осуществления изобретения, примеры реализации изобретения, указание на возможность получения дополнительного технического результата, уточненные графические материалы и т.д.

Дополнительные материалы, содержащие наряду с отсутствующими в первоначальных материалах заявки признаками, подлежащими включению в формулу изобретения, также иные сведения, необходимые для рассмотрения заявки, признаются изменяющими сущность лишь в части, содержащей указанные признаки. Иные сведения учитываются при проведении экспертизы.

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

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

Лицо, подавшее возражение, не оспаривает соблюдение требований относящихся к тому, содержат ли материалы заявки указание назначения заявленного объекта изобретения и описаны ли в первичных материалах заявки средства и методы, с помощью которых возможно осуществление изобретения в том виде, как оно охарактеризовано в любом из пунктов формулы изобретения.

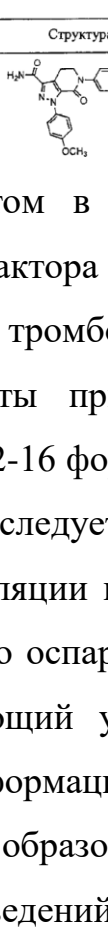
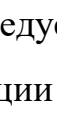
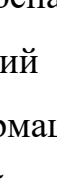
Лицо, подавшее возражение, оспаривает лишь соблюдение требования, касающегося того, действительно ли возможна реализация указанного заявителем назначения.

Здесь следует согласиться с доводом патентообладателя, что в описании к оспариваемому патенту (с.55, абзацы 1-2) (также в материалах заявки, на дату ее подачи), приведено подробное описание способа, который

использовался для определения эффективности соединения по оспариваемому патенту как ингибитора фактора Ха. Эффективность соединения выражена в виде значений константы ингибирования K_i .

При этом в описании указано, что соединения, считаются активными если они обладают $K_i \leq 10$ мкМ.

Апиксабан (соединение, полученное и охарактеризованное в примере 18 описания к оспариваемому патенту), согласно сведениям из таблицы 6 (с.166-174) имеет $K_i=0,08$ нМ, что соответствует 0,00008 мкМ.

Пример №	Структура	R ^{1a}	R ₄	M ₄	K _i (нМ)
18		-CONH ₂			0.08

При этом в описании к оспариваемому патенту раскрыто, что ингибиторы фактора Ха полезны в качестве антикоагулянтов для лечения и профилактики тромбоэмболических заболеваний. Вместе с тем в описании (с.54) раскрыты признаки, которыми охарактеризовано изобретение в пунктах 5-9, 12-16 формулы оспариваемого патента.

Также следует отметить, что влияние ингибитора фактора Ха на процесс коагуляции крови известен из уровня техники до даты приоритета изобретения по оспариваемому патенту, что раскрыто в описании в разделе «Предшествующий уровень техники» со ссылками на соответствующие источники информации.

Таким образом, в описании к оспариваемому патенту приведено достаточно сведений позволяющих убедиться в том, что предложенное изобретение может быть использовано в здравоохранении.

Вместе с тем, в отношении сведений, раскрытых в таблице 9 необходимо отметить, что согласно подпункту 4 пункта 20 Правил дополнительные сведения, представленные заявителем по собственной инициативе или по запросу, к которым могут быть отнесены, в частности, новые (дополнительные) сведения об условиях осуществления изобретения, примеры реализации изобретения, указание на возможность получения

дополнительного технического результата, уточненные графические материалы и т.д., учитываются при проведении экспертизы.

В отношении упомянутых экспериментальных данных следует отметить, что они получены в таких тестовых системах, как шунтированный тромбоз, принудительный тромбоз полых вен и сонной артерии, тромбоз бедренной артерии и кровотечения почечного коркового вещества. Данные сведения подтверждают возможность использования соединений по оспариваемому патенту в фармацевтических композициях для лечения и профилактики, указанных в оспариваемом патенте заболеваний и состояний, т.е. по указанному заявителем назначению.

В соответствии с изложенным, следует констатировать, что изобретение по пункту 1 формулы, а также по пунктам 13-16 соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (пункту 1 статьи 4 Закона, пункт 19.5.1. Правил).

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретения по оспариваемому патенту (пункты 1 и 2 формулы) условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень», показал следующее.

Лицо, подавшее возражение, в своих доводах указывает на то, что соединение аписабан в патентном документе [1] специально не получено и не исследовано.

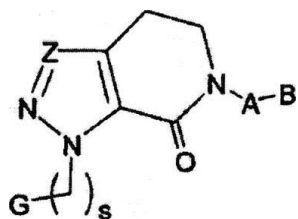
Однако указывает, что в патентном документе [1] среди большого количества альтернатив в формуле Маркуша можно собрать и составить соединение с радикалами, соответствующими соединению по оспариваемому патенту.

Здесь целесообразно отметить, что данное обстоятельство является предметом для исследований согласно подпункту 4 пункта 19.5.3 Правил, в соответствии с которым, индивидуальное соединение, подпадающее под общую структурную формулу группы известных соединений, но не описанное как специально полученное и исследованное, и при этом

проявляющее новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении является селективным изобретением, т.е. данное исследование проводится с целью оценки соответствия изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень», что априори говорит о том, что такие индивидуальные соединения, которые в уровне техники не получены специально и не исследованы, являются новыми (пункт 1 статьи 4 Закона, пункта 19.5.2 Правил)

Вместе с тем, следует отметить, что в патентном документе [1] содержится 109 примеров получения соединений соответствующих одной из 66 общих структурных формул по независимому пункту 1 формулы патентного документа [1].

Наиболее близкой по структуре к апиксабану является формула следующей структуры:



При этом необходимо выбрать определенные значения радикалов Z, G, A, B и индекса s в указанной общей структурной формуле из обширного перечня возможных значений радикалов, имеющих различную химическую природу, приведённых для всех 66 структур.

При этом можно согласиться с мнением патентообладателя о том, что среди возможных значений радикала B, которые определены в независимом пункте 1 формулы патентного документа [1], в частности, как 5-10-членная гетероциклическая система, содержащая 1 гетероатом, выбранный из N, и замещенная 1 заместителем R4a, причем R4a выбран из =O, выбрать значение оксопиперидинил (который в структурной формуле апиксабана представлен конкретно лактамной группировкой 2-оксо-1-пиперидинилом), то и в этом случае полученная в итоге структурная формула будет охватывать 39 индивидуальных соединений.

Кроме того, согласно сведениям из патентного документа [1], присоединение оксопиперидинила к фенильному остатку (радикал А) возможно в трех положениях (орто-, мета- или пара-) по отношению к тетрагидропиразолопиридиновой бициклической системе, присоединение пиперидинильного кольца к фенильному остатку возможно как по атому азота, так и по любому из атомов углерода кольца, находящихся в орто-, мета- или пара-положении по отношению к указанному атому азота, и присоединение оксо-заместителя к пиперидинильному кольцу возможно в любое из положений в указанном кольце, где это допустимо с точки зрения химии (суммарно 13 вариантов оксопиперидинильного радикала).

Однако, в 109 примерах, представленных в патентном документе [1] отсутствуют какие-либо примеры, иллюстрирующие получение соединений, в которых заместитель, соответствующий радикалу В в структуре Маркуша, приведенной в пункте 1 формулы патентного документа [1], представлял бы собой какое-либо оксопиперидинильное кольцо, в частности 2-оксо-1-пиперидинил, присутствующий в структуре аписабана по оспариваемому патенту.

В соединениях по примерам 13 и 17 согласно патентному документу [1], о которых упоминает лицо, подавшее возражение, конкретные заместители, соответствующие радикалу В в полученных соединениях имеют иную химическую природу, чем оксопиперидинильный заместитель, тем более конкретный, упомянутый выше, лактамный заместитель 2-оксо-1-пиперидинил в аписабане.

Таким образом, даже специалисту в данной области техники представляется затруднительным конструирование соединения, соответствующего по структуре аписабану, при этом предполагая, что такое сконструированное соединение будет обладать какими-либо неожиданными свойствами.

В патентном документе [1] ни для одного из соединений, проиллюстрированных в 109 примерах, в принципе не приведены какие-либо

фактические сведения об их биологической активности, в частности, сведения о фактических значениях K_i для описанных соединений в отношении фактора X_a .

При этом следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что каждый из указанных в патентном документе [1] интервалов даже при расширительном их толковании следует рассматривать как охватывающий значения в пределах одного порядка величины.

Так, указанный в патентном документе [1], как наиболее предпочтительный, интервал $K_i \leq 0,001$ мкМ следует рассматривать как охватывающий значения $K_i \geq 0,001$ мкМ (т.е. ≤ 1 нМ), но $> 0,0001$ мкМ (т.е. $> 0,1$ нМ).

Однако, как раскрыто выше в настоящем заключении, аписабан, согласно сведениям из таблицы 6 (с.166-174) имеет $K_i=0,08$ нМ, что соответствует $0,00008$ мкМ.

Специалисту в данной области техники хорошо известно, что чем ниже K_i , тем выше аффинность и тем сильнее ингибируется активность мишени. Таким образом, чем ниже K_i , тем меньше соединения требуется для достижения того же эффекта ингибирования.

Таким образом, изобретение по оспариваемому патенту (пункты 1 и 2 формулы), соответствует условию патентоспособности "изобретательский уровень" в свете требований, установленных законодательством по отношению к селективным изобретениям (пункт 1 статьи 4 Закона, подпункт 4 пункта 19.5.3 Правил).

Вместе с тем следует отметить, что дополнительные экспериментальные данные, представленные патентообладателем, демонстрирующие, что аписабан имеет лучшее значение K_i , чем четыре соединения, являющиеся структурно наиболее близкими соединениями по отношению к аписабану, описанные в патентном документе [1] в примерах 6, 10, 13 и 99? подтверждают сделанный выше вывод.

В отношении сведений, представленных в статье [2], которая опубликована в период прохождения стадии экспертизы по существу заявки, по которой выдан оспариваемый патент, следует отметить, что они также подкрепляют, сделанный выше вывод.

Констатируя сказанное, можно сделать вывод о том, что в возражении не представлено доводов, позволяющих признать изобретения по оспариваемому патенту несоответствующими условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень».

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 09.11.2023, патент Российской Федерации на изобретение № 2345993 оставить в силе.