



# ЕВРАЗИЙСКАЯ ПАТЕНТНАЯ ОРГАНИЗАЦИЯ (ЕАПО) The Eurasian Patent Organization

## ЕВРАЗИЙСКОЕ ПАТЕНТНОЕ ВЕДОМСТВО (ЕАПВ) The Eurasian Patent Office

Россия, 109012, Москва, М. Черкасский пер., 2  
2, M. Cherkassky per., Moscow 109012, Russia

Факс (Fax) +7(495) 621-2423, Email: info@eapo.org

### РЕШЕНИЕ

#### об отклонении возражения против выдачи евразийского патента

В соответствии с правилом 53(8) Патентной инструкции Евразийской патентной конвенции (далее инструкции) Евразийское патентное ведомство приняло решение об отклонении возражения против выдачи евразийского патента **№ 015145** на изобретение **ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ КОМПОЗИЦИЯ И ПЕРОРАЛЬНАЯ ФАРМАЦЕВТИЧЕСКАЯ ДОЗИРОВАННАЯ ФОРМА (ВАРИАНТЫ), ПРОЯВЛЯЮЩИЕ АКТИВНОСТЬ В ОТНОШЕНИИ ВИЧ-ИНФЕКЦИЙ, ЛЕЧЕБНЫЙ НАБОР И ТАБЛЕТКА И СПОСОБ ЛЕЧЕНИЯ ИЛИ ПРЕДОТВРАЩЕНИЯ СИМПТОМОВ ИЛИ ЭФФЕКТОВ ВИЧ-ИНФЕКЦИИ**

Патент выдан со следующей формулой изобретения:

#### Патент выдан со следующей формулой изобретения:

- независимый пункт 1, характеризующий фармацевтическую композицию, проявляющую активность в отношении ВИЧ-инфекций, содержащую тенофовир дизопроксил фумарат (ТДФ) и эмтрицитабин (ФТС);

- независимый пункт 21, характеризующий дозированную форму, проявляющую активность в отношении ВИЧ-инфекций, содержащую тенофовир дизопроксил фумарат (ТДФ), эмтрицитабин (ФТС) и атазанавир сульфат;

- независимый пункт 22, характеризующий дозированную форму, проявляющую активность в отношении ВИЧ-инфекций, содержащую тенофовир дизопроксил фумарат (ТДФ), эмтрицитабин (ФТС) и лопинавир/ретиновир;

- независимый пункт 23, характеризующий дозированную форму, проявляющую активность в отношении ВИЧ-инфекций, содержащую тенофовир дизопроксил фумарат (ТДФ), эмтрицитабин (ФТС) и эфавиренз;

- независимый пункт 24, характеризующий таблетку, содержащую 300 мг тенофовир дизопроксил фумарата (ТДФ), 200 мг эмтрицитабина (ФТС) и носители и/или наполнители, достаточные для того, чтобы кислотная деградация тенофовир изопроксила фумарата или эмтрицитабина составляла менее 5% после 6 месяцев хранения с поглотителем влаги при 40 град. C/75% относительной влажности;

- независимый пункт 25, характеризующий лечебный набор, включающий фармацевтическую композицию, содержащую тенофовир дизопроксил фумарат (ТДФ), эмтрицитабин (ФТС) и информационный вкладыш, содержащий указания по применению композиции для лечения пациента, нуждающегося в антивирусной терапии, представляющей собой анти-ВИЧ терапию;

\*200501134\*  
\*502\*

- независимый пункт 27, характеризующий применение тенофовир изопроксила фумарата (ТДФ) в комбинации с эмтрицитабином (ФТС) для производства объединенной в один препарат композиции для лечения или предотвращения симптомов или эффектов ВИЧ-инфекции.

В поступившем возражении оспаривается выдача патента ЕА 015145 В1 в связи с несоответствием условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень».

**Промышленная применимость:** изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других областях человеческой деятельности ( правило 3(1) Патентной инструкции). Сомнений в том, что заявленная группа изобретений соответствует данному условию, нет, поскольку предметом изобретения по существу является комбинированный лекарственный препарат, на дату рассмотрения возражения существующий на рынке под торговым наименованием ТРУВАДА. Стороны высказали согласие с тем, что вопрос соответствия условию «промышленная применимость» не будет более предметом обсуждения в рамках рассмотрения возражения.

**Новизна:** изобретение признается новым, если оно не является частью предшествующего уровня техники (правило 3(1) Инструкции). Поскольку в качестве оснований для установления отсутствия новизны были представлены источники информации Д2-Д5, подпадающие под действие правила 3(2) Инструкции, стороны выразили согласие с тем, что вопрос соответствия условию «новизна» не будет более предметом обсуждения в рамках рассмотрения возражения.

В открытом устном рассмотрении оспаривалась выдача патента в связи с несоответствием условию «изобретательский уровень».

Необходимо отметить, что в тексте возражения, поданного в корреспонденции №1808 от 03/11/2011, доводы, обосновывающие несоответствие условию «изобретательский уровень», не приведены отдельно от доводов по новизне. Кроме того, отсутствие изобретательского уровня обосновывается со ссылками не только на публикации, являющиеся частью уровня техники, но и на источники информации, таковыми не являющимися (указанные выше Д2-Д5).

При устном рассмотрении стороной, подавшей возражение, как наиболее релевантное было предложено сочетание документов Д7 и Д8.

Источник информации Д8 имеет дату публикации, указанную как **Jan. 2003**. Представителем патентообладателя была представлена информация, распечатанная с сайта Д8, свидетельствующая о том, что дата публикации – **15 января 2003 г.** Кроме того, для печатных

изданий, при отсутствии точного указания даты выпуска их в свет, датой, определяющей включение источника в уровень техники, считается последний день месяца, согласно п. 5.6 Правил составления, подачи и рассмотрения евразийских заявок. В данном случае это **31 января 2003 г.** Поскольку дата приоритета **14 января 2003 г.**, Д8 был исключен из перечня документов при устном рассмотрении возражения в отношении изобретательского уровня, с согласия сторон.

## **ИЗОБРЕТАТЕЛЬСКИЙ УРОВЕНЬ**

Согласно правилу 47(2) Инструкции, изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста очевидным образом не следует из предшествующего уровня техники.

Согласно п. 5.8 Правил, проверка этого условия включает определенные этапы, а именно: выявление наиболее близкого аналога; выявление отличительных признаков; выявление из уровня техники решений, имеющих такие признаки; анализ уровня техники, с целью установления известности влияния указанных признаков на технический результат.

Возражение заявителя не содержит анализа изобретательского уровня в этом классическом варианте, который предписывается п. 5.8 Правил и традиционно применяется в патентной экспертизе.

Кроме того, как указано выше, в письменном возражении аргументы в отношении изобретательского уровня даны в совокупности с аргументами в отношении новизны и основаны на сочетании релевантных и нерелевантных источников информации.

Тем не менее, доводы стороны, подавшей возражение, были коллегией рассмотрены.

В устном рассмотрении возражение основывалось на том, что декларируемый патентообладателем технический результат, а именно: 1) обеспечение химически стабильной комбинации противовирусных средств, является очевидным, поскольку нет оснований предполагать, что твердая таблетка будет проявлять нестабильность при хранении, так как из уровня техники известна возможная нестабильность компонентов комбинации в сильно разбавленных растворах, что не может быть экстраполировано на твердую лекарственную форму; 2) обеспечение стабильной комбинации противовирусных средств, проявляющих более низкую резистентность, также является очевидной, поскольку в Д7 раскрыто применение ТДФ пациентами, продолжающими принимать ФТС, что привело к улучшению показателей, которые определяются ВИЧ-инфекцией.

Анализ возражения, приложенных к нему источников информации в совокупности с материалами заявки показал следующее. В Д1 раскрыта неустойчивость компонентов композиции при 40 град С в растворе. В описании патента ЕА 015145 (стр. 18-20) раскрыт способ получения композиции, включающий стадию влажной грануляции в растворе с получением гранул, содержащих 40% и 60% воды (стр. 18 описания, абз. 6) и сушки влажных гранул при температуре

47-70 град. С (стр. 19, абз. 2). В этих условиях, исходя из химического строения компонентов композиции, специалист мог бы ожидать гидролитического дезаминирования эмтрицитабина и гидролиза сложноэфирных групп ТДФ. Эти процессы могут приобрести усиливающийся характер, поскольку в результате дезаминирования ФТС образуется аммиак, который, в свою очередь, катализирует деградацию ТДФ с образованием углекислого газа, что приводит к необратимости этого процесса.

По мнению коллегии, такой результат, как химическая стабильность комбинации по изобретению, не является очевидным в свете предшествующего уровня техники, поскольку налицо преодоление предубеждения специалиста, так как сведения из уровня техники предполагают очень высокую вероятность деградации заявленной комбинации при ее получении.

Относительно очевидности низкой резистентности и синергизма комбинации ФТС и ТДФ в свете Д7 коллегия экспертов установила следующее. В Д7 описана терапия хронического гепатита В введением ТДФ пациентам, коинфицированным ВИЧ, принимающим ЗТС. Указано, что пациенты принимали ЗТС или ФТС (стр. 1844, последний абзац). Далее на стр. 1845 абз. 2 описано исследование 5 пациентов, продолжающих принимать ЗТС или ФТС, которым добавили 300 мг ежедневно ТДФ. Далее в абз. 1 раздела «Результаты» указано, что для одного пациента лечение ФТС было признано неудачным после 30 месяцев. Видимо, далее его лечение не исследовалось. В пояснениях к таблице 1 сказано, что один пациент принимал ЗТС в течение 26 месяцев, затем ФТС в течение 36 месяцев. В самой таблице нет данных по каждому отдельному пациенту, все показатели даны как усредненные для 6 человек. Считать, что сведения о лечении единственного пациента от гепатита В, пусть и коинфицированного ВИЧ, сначала в течение более чем 2 лет препаратом ЗТС, затем 3 года препаратом ФТС, затем добавлением к этой терапии ТДФ свидетельствуют об очевидности выбора комбинации ТДФ и ФТС для лечения ВИЧ инфекции, нет оснований. На стр. 1846 Д7 абз. 2 указано, что следствием описанных экспериментов является теоретическая перспективность комбинированной терапии гепатита В с использованием ЗТС и ТДФ. О перспективности, даже теоретической, комбинации ФТС и ТДФ в отношении ВИЧ не упоминается.

Для комбинации по оспариваемому патенту достоверные сведения, подтверждающие ее эффективность, были представлены в полном объеме в опубликованных после даты приоритета источниках информации Д31, Д39-41.

На основании изложенного, Коллегия ЕАПВ по рассмотрению возражения против выдачи патента ЕА015145 делает вывод о его соответствии условиям патентоспособности «промышленная применимость», «новизна» и «изобретательский уровень».