

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 «Тева» (ООО «Тева») (далее – лицо, подавшее возражение), поступившее 12.03.2025, 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).

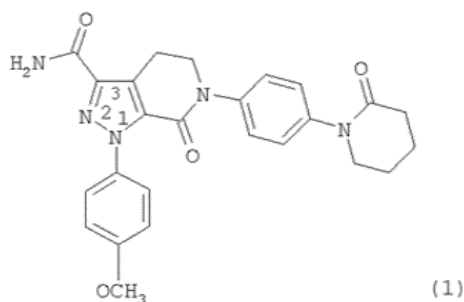
Согласно записи в государственном реестре от 22.03.2021 (Бюл. № 9) об изменении наименования патентообладателя, в настоящее время патентообладателем является Бристол-Майерс Сквибб Холдингс Айеленд Анлимитед Компани (СН) (далее – патентообладатель).

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.

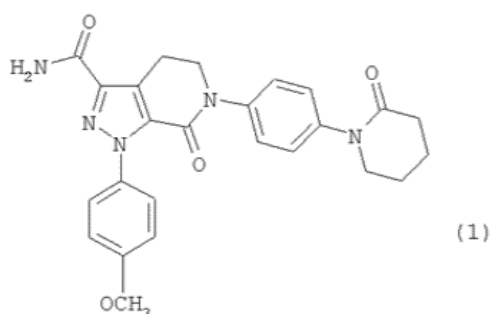
На дату подачи возражения патент действует со следующей формулой изобретения:

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 изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «изобретательский уровень».

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

- копия приоритетной заявки US 60/324,165 от 21.09.2001, с частичным переводом на русский язык (далее – [А]);
- патентный документ WO00/39131, дата публикации 06.07.2000, с частичным переводом на русский язык (далее – [1]);
- патентный документ WO 99/50255 A2, дата публикации 07.10.1999, с частичным переводом на русский язык (далее – [2]);
- патентный документ WO98/28269, дата публикации 02.07.1998, (выборочно - 176 л. из 342 л.), с частичным переводом на русский язык (далее – [3]);
- Терней А. Современная органическая химия, т.2, с.203, 1981, Москва, Издательство МИР, выдержка из главы 21 на 1 л. (далее – [4]);
- Решение суда (Великобритания) от 07.04.2022, The High Court of Justice, Business and Property Courts of England and Wales, Intellectual property List (ChD), Patents Court - [2022] EWHC 822 (Pat), case No's: HP-2020-1000042

and HP-2021-000003), с. 62-63 с частичным переводом на русский язык (далее – [B]);

- Решение суда (Словакия) от 22.08.2024, № EP 1427415/1-16-2024, с частичным переводом на русский язык (далее – [C]).

Перевод документа [C] представлен в корреспонденции, поступившей 11.04.2025.

Суть доводов возражения в отношении несоответствия группы изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость», сводится к следующему.

По мнению лица, подавшего возражение, в отношении изобретений, назначением которых является лечение заболеваний, для подтверждения реализации назначения предоставляются соответствующие примеры, которые, между тем, в заявке, в соответствии с которой установлен приоритет, отсутствуют.

В частности, отмечено, что в приоритетной заявке US 60/324,165 нет ни одного примера применения соединения по пункту 1 формулы, а именно соединения аликсабан, полученного в примере 18 (с. 92-94 описания к оспариваемому патенту) и нет ни одного примера его применения ни для одного из тромбоемболических заболеваний, перечисленных в соответствующем разделе описания к оспариваемому патенту (с. 54-55 описания) и в пунктах 5 и 12 формулы.

При этом в возражении отмечено, что не приведены такие примеры и ни для одного из других соединений, полученных в приведенных в описании приоритетной заявки примерах 1-70.

Кроме того, лицо, подавшее возражение, указывает на то, что таблица 9 иллюстрирующая результаты тестирования на крысах, кроликах и собаках и таблица 8, раскрывающая фармацевтические композиции по примеру 18, а также таблица 6, включающая данные о протестированных активностях (значения Ki) отсутствовали как в приоритетной заявке US 60/324,165, так и в международной заявке, опубликованной как WO03/026652.

Таким образом, по мнению лица, подавшего возражение, на дату приоритета реализация указанного заявителем назначения изобретений по пунктам 1 и 10 формулы оспариваемого патента не подтверждена.

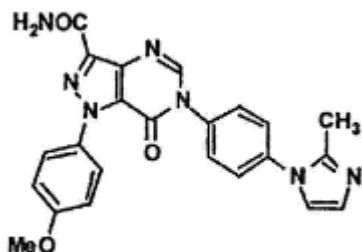
Также в возражении приведены доводы в отношении несоответствия изобретений, охарактеризованных в зависимых пунктах 5 и 12, 6 и 13, 7 и 14, 9 и 16 формулы условию патентоспособности «промышленная применимость».

Суть доводов возражения в отношении несоответствия изобретений по независимым пунктам 1 и 10 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «изобретательский уровень», сводится к следующему.

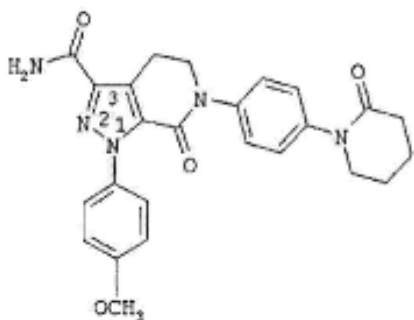
В качестве технического результата в возражении рассматривается расширение арсенала средств заявленного назначения (с.8-9 описания).

Техническое решение по пункту 1 формулы не имеет изобретательского уровня при известности решения из документа [1] (прототип) с учетом сведений, раскрытых в документах [2] или [3] и [4].

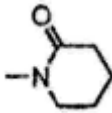
При этом отмечено, что в документе [1] (с.110) раскрыта группа соединений того же назначения - «для лечения тромбоэмболических заболеваний», а непосредственно прототипом является одно из соединений группы, охарактеризованной формулой Маркуша по пункту 1 формулы упомянутого документа, а именно соединение, полученное в примере 10 (с.110):



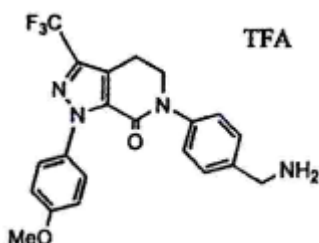
При этом соединение по пункту 1 формулы оспариваемого патента (далее - аликсабан) имеет структуру



Соответственно в возражении сделан вывод о том, что из структурных формул соединения прототипа и апиксабана видно, что апиксабан по оспариваемому патенту имеет в своей структуре шестичленное гетероциклическое кольцо с одним атомом азота с окси группой во втором

положении в качестве заместителя  (2-окси-1-пиперидинил), что и является признаком отличающим апиксабан от известных из документа [1] соединений.

При этом в возражении отмечено, что в документе [1] также получены другие соединения с идентичным бициклом в структуре, включающим фенил. В частности приведено соединение примера 99:



При этом лицо, подавшее возражение, считает, что фенил имеет в соответствующем положении азотсодержащий заместитель эквивалентный группе 2-око-1-пиперидинил у апиксабана (с. 208-253 [1]).

Кроме того, в возражении отмечено соединение 1043, в котором фенил имеет заместитель представляющий собой 1-пирролидинкарбонил (с.240 [1]).

Вместе с тем, лицо, подавшее возражение, отмечает, что отличительный признак - «лактаманная группа 2-оксо-1-пиперидинил» -

известен для соединений с идентичным противоэмболическим действием и активностью (ингибиторы фактора Ха) в документе [2]. Так, отмечено, что в пункте 1 формулы патентного документа [2] представлен заместитель, представляющий собой 6-членный гетероцикл с 1 гетероатомом «N» и замещенный 1 радикалом R_{4a}, являющимся «=O» (пункт 1, с.103 [2]).

Вместе с тем, по мнению лица, подавшего возражение, в патентном документе [2] (пункт 17 формулы) известен и достигаемый для этих соединений технический результат - реализация того же назначения - «лечение тромбоэмболических заболеваний».

Кроме того, в возражении отмечено, что в документе [3] (пункт 1 формулы) для группы соединений также раскрыт эквивалентный отличительный признак, включающий терминирующий гетероциклический заместитель - оксо-пирролидиловый цикл, который является эквивалентной заменой оксопиперидинилу в апиксабане по оспариваемому патенту.

Кроме того, в возражении отмечено, что в патентном документе [3] получены также азотсодержащие гетероароматические ингибиторы фактора Ха - соединения 903, 913, 923, 933, 943, замещенные эквивалентным оксо-пирролидиловым циклом, в частности пирролидинокарбонилем (как и соединения 883, 893, 903, 913, 923, 933, 943, полученные в патентном документе [2]).

При этом, лицо, подавшее возражение, отмечает, что из документа [4] известно, что пиперидини пирролидин являются ближайшими гомологами класса циклических аминов, 5-ти и 6-ти членными циклами, и, соответственно, по физико-химическим свойствам замена указанного цикла, одного на другой будет очевидна для специалиста в данной области техники

Кроме того, в возражении указано, что из патентного документа [3] (пункт 25 формулы, абз.1 с.384) также известен и достигаемый для этих соединений технический результат - реализация того же назначения - «лечение тромбоэмболических заболеваний».

Патентообладатель, уведомленный в установленном порядке о поступлении и содержании возражения, на заседании коллегии, состоявшемся 10.07.2025 представил отзыв по мотивам возражения (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии).

К отзыву приложены копии следующих материалов:

- решение Роспатента от 18.06.2024 на 22 л. (патент №2345993) (далее – [D]);

- статья Михайлов С.В. «Синдром ретроспективной предвзятости при оценке изобретательского уровня» (далее – [E]);

- документ 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 – [5]).

Патентообладатель в отзыве акцентирует внимание на том, что Роспатентом уже было рассмотрено возражение ООО «ФармВектор» от 09.11.2023 против выдачи данного патента (см. документ [D]).

При этом отмечено, что мотивы настоящего возражения о несоответствии изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «промышленная применимость» и «изобретательский уровень» совпадают с таковыми, приведенными в возражении ООО «ФармВектор», а также практически полностью совпадают противопоставленные документы.

Таким образом, патентообладатель считает, что настоящее возражение необходимо рассматривать с учетом выводов Роспатента, изложенных в решении [A] с целью соблюдения принципа правовой определенности, на что неоднократно было указано судами (см. постановления Президиума Суда по интеллектуальным правам от 01.11.2019 по делу СИП-580/2017, от 10.02.2021 по делу СИП-432/2020, от 12.10.2018 по

делу СИП-57/2018, оставленные без изменения определениями СКЭС Верховного Суда Российской Федерации, а также постановления Президиума Суда по интеллектуальным правам от 08.04.2021 года по делу СИП-971/2019, от 19.10.2018 по делу СИП-137/2018, от 31.10.2019 по делу СИП-202/2019).

Суть доводов патентообладателя в отношении соответствия изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «промышленная применимость» сводится к следующему.

Апиксабан является единственным соединением, которое было получено в граммовых количествах (3,07 г), в отличие от прочих соединений, которые были получены в количествах, не превышающих десятки или сотни миллиграммов. При этом апиксабан был единственным соединением, подвергнутым многостадийной перекристаллизации с использованием различных систем растворителей с целью выделения высокоочищенного продукта с максимально возможным выходом.

При этом патентообладатель поясняет, что количества нового соединения порядка 500 мг или выше требуются в единственном случае, когда указанное соединение успешно прошло первоначальные испытания *in vitro* и продемонстрировало свою перспективность для дальнейшей фармацевтической разработки и проведения доклинических исследований *in vivo*. Все это указывает на то, что в описании изобретения пример 18 не просто является иллюстрацией синтеза соединения, но описывает реальный масштабированный синтез, проведенный уже после того, как соединение было получено в малых количествах, испытано в первоначальных испытаниях *in vitro*, и подтвердило свою перспективность для дальнейшей разработки и проведения доклинических исследований *in vivo*, включая исследование фармакокинетических параметров.

Данные, приведенные на страницах 7-8, 54-56, 92-94 описания к оспариваемому патенту, содержат исчерпывающие сведения, подтверждающие возможность реализации назначения изобретения для

признания изобретения соответствующим условию патентоспособности «промышленная применимость».

В таблице 6 (с.166-174 описания) приведены соединения с определенной химической структурой, в отношении которых продемонстрирована биологическая активность, а именно приведены результаты K_i (константа ингибирования) в нМ. K_i для аписабана составляет 0,08 нМ.

В таблицах 7 и 8 описания приведены примеры фармацевтических композиций в форме таблеток, содержащих аписабан (BMS-562247-01).

В таблице 9 продемонстрированы *in vivo* испытания аписабана.

Кроме того, патентообладатель указывает на то, что согласно нормативно-правовой базе, действовавшей на дату подачи заявки, в алгоритме проверки промышленной применимости, четко указано, что как назначение изобретения, так и сведения о возможности его реализации, должны быть приведены в материалах заявки, а не в описании приоритетной заявки.

Вместе с тем, патентообладатель обращает внимание на то, что таблицы 6, 8 и 9 содержащиеся в материалах заявки были правомерно представлены в процессе делопроизводства по заявке и были правомерно включены в описание патента.

При этом отмечено, что необходимость учета таких материалов при оценке патентоспособности изобретений, подтверждена судебной практикой, в частности решением Суда по интеллектуальным правам от 5 декабря 2019 года по делу № СИП-151/2019, оставленным без изменения постановлением президиума СИП от 28 мая 2020 года.

Более того, по мнению патентообладателя, даже без информации, приведенной в таблицах 6, 8 и 9, описание изобретения содержит сведения, достаточные для подтверждения возможности реализации назначения изобретения. В описании изобретения (страница 55, последний абзац и его окончание на странице 56) сообщается, что «соединения, протестированные в

вышеупомянутом испытании, считаются активными, если они обладают $K_i < 10 \text{ мкМ}$ ». Чем ниже K_i , тем выше аффинность и тем сильнее ингибируется активность мишени. Чем ниже K_i , тем меньше соединения требуется для достижения того же эффекта ингибирования. Поэтому соединение с низким K_i обычно предпочтительнее соединения с высоким K_i .

В отношении соответствия изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень», патентообладатель сообщает следующее.

Техническим результатом изобретений по оспариваемому патенту является предоставление новых ингибиторов фактора Ха с улучшенными фармакологическими характеристиками, в частности, с улучшенной ингибирующей активностью, на что неоднократно указано в описании изобретений к оспариваемому патенту (см. например, с. 8, абзац 1).

Теоретически независимый пункт 1 формулы изобретения документа [1] охватывает многие миллиарды индивидуальных соединений, в 109 примерах получения соединений, представленных в документе [1], отсутствуют какие-либо примеры, иллюстрирующие получение соединений, в которых заместитель, соответствующий радикалу В в структуре Маркуша, приведенной в пункте 1 формулы [1], представлял бы собой какое-либо оксопиперидинильное кольцо, в частности 2-оксо-1-пиперидинил, присутствующий в структуре аписабана по оспариваемому патенту.

В документах [2] и [3] фактически описаны совершенно другие соединения общих формул, и не приведено какое-либо обоснование или предположение для создания изобретения по оспариваемому патенту «простой» заменой существенных элементов предложенной в оспариваемом патенте химической структуры.

По мнению патентообладателя, в документах [1]-[3] нет сведений, которые бы указывали на очевидность и предпочтительность именно той комбинации заместителей, которая присутствует в соединении по оспариваемому патенту, и нет также указания на то, что именно такая

комбинация будет обеспечивать ингибитор фактора Ха с улучшенными фармакологическими характеристиками, в частности, с улучшенной ингибирующей активностью.

В документах [2] и [3] 1-пирролидинокарбонильный радикал, который кроме того, что отличается от 2-оксо-1-пиперидинила, присутствует в совершенно ином соединении. Даже в том случае, когда указанный 1-пирролидинокарбонильный радикал в соединениях, раскрытых в документах [2] и [3] присоединен к фрагменту В, представленному фенилом, фенильная группа связана с центральным фрагментом (ядром), который представляет собой замещенный 1,2-диазолин (пиразолин) или замещенный 1,2,3-триазолин ([2]) или замещенный пиррол, замещенный диазол, замещенный триазол или замещенный тетразол ([3]) через линкерную группу Z.

При этом в аликсабанае, наоборот, фенил присоединен непосредственно к центральному фрагменту (ядру), который представляет собой замещенный тетрагидропиразолопиридин.

Вместе с тем, патентообладатель утверждает, что аликсабан проявляет новые, неизвестные для группы известных из патентного документа [1] соединений свойства, а именно, является ингибитором фактора Ха с улучшенными фармакологическими характеристиками, в частности, с улучшенной ингибирующей активностью. В патентном документе [1] представлены общие сведения об ингибировании K_i , способе определения K_i , который сходен со способом настоящего изобретения, и упомянуты интервалы значений K_i для соединений (с.263, абзац 2 – с.264, до начала полного абзаца 2, с. 5 перевода [1]), однако, патентообладатель подчеркивает, что в 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 Ха.

Активность аликсабана характеризуется значением $K_i = 0.08\text{нМ}$, которое на порядок ниже, указанных в патентном документе [1] значений K_i .

Документ [5] (четыре из авторов, являются авторами изобретений по оспариваемому патенту) опубликован после даты подачи заявки, но до даты выдачи оспариваемого патента, содержит таблицу 6, где представлены сравнительные данные для аликсабана и различных известных соединений, относящиеся, в частности, к значениям K_i в отношении фактора X_a человека и кролика, значениям клиренса (Cl), объема распределения (V_{dss}) и времени полувыведения ($T_{1/2}$). При этом отмечено, что аликсабан (соединение 40 в [5]) характеризуется сопоставимым или более высоким сродством к фактору X_a (значение K_i) и при этом демонстрирует лучший фармакокинетический профиль, например по сравнению с соединением 5 (разаксабан) соответствует соединению по примеру 61 документа [1].

Патентообладатель также предоставляет дополнительные экспериментальные данные, демонстрирующие, что аликсабан имеет лучшее значение K_i , чем четыре соединения примеров 6, 10, 13 и 99 документа [1], являющиеся структурно наиболее близкими соединениями с аликсабаном, поскольку они характеризуются тремя идентичными структурными особенностями с аликсабаном, в то время как другие соединения из документа [1] имеют только 2 или менее структурных особенностей.

На заседании коллегии, состоявшемся 03.09.2025, лицом, подавшим возражение, представлена письменная позиция в отношении отзыва патентообладателя (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии).

К позиции, кроме дополненной копии документа [4] приложены копии следующих материалов:

- Patani et al. «Bioisosterism: A Rational Approach in Drug Design», Chem. Rev. 1996, 96, 3147-3176, с частичным переводом (далее – [6]);

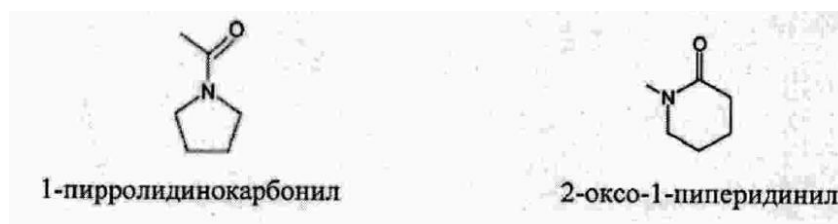
- снимок экрана с видеуроком с ресурса <https://videouroki.net/blog/vidieourok-po-khimii-tsikloalkany.html> (далее – [С]).

Лицо, подавшее возражение, повторно акцентирует внимание на том, что в соответствии с действовавшей правовой базой, оценка соответствия изобретений условию патентоспособности «промышленная применимость»

проводится на основании материалов заявки на дату приоритета изобретения и приводит анализ положений правовой базы.

При этом лицо, подавшее возражение, отмечает, что ни в одном из перечисленных в отзыве судебных актов не упоминается о каких бы то ни было случаях или условиях необязательности выполнения всех требований изложенных в соответствующих пунктах нормативно-правовой базы.

В отношении несоответствия изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» в пояснениях дополняется, что признак, отличающий аликсабан от прототипа (соединение примера 10 в документе [1]) известен в каждом из документов [2] и [3], как изложено в возражении в виде эквивалентного радикалу 2-оксо-1-пиперидинилу радикала 1-пирролидинокарбонил:



в документах [2]-[3]

в аликсабане
по оспариваемому патенту,

указанные структуры имеют одинаковую молекулярную формулу $C_5N_1O_1$ и, по мнению лица, подавшего возражение, являются изомерами с различным числом атомов углерода в гетероцикле.

При этом отмечено, что, как известно из документа [4], эти структуры представляют собой не что иное, как классические изомеры циклоалканов - с одинаковым числом атомов углерода (C_5H_{10}) и одними и теми же заместителями (атомами азота и кислорода), отличаются только их положениями и числом атомов углеродов в цикле, как например, молекулы с разным числом атомов углерода в цикле - метилциклобутан и 1,2-диметилциклопропан - являются тривиальными изомерами к циклоалкану состава C_5H_{10} .

Кроме того, лицо подавшее возражение, приводит доводы о том, что аликсабан не является селективным по отношению к соединениям общей

формулы I в документе [1], поскольку не проявляет новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении (см., например, соединение примера 61 в документе [1] и его активность в документе [5] (соединение 5)). Кроме того, лицо, подавшее возражение, обращает внимание на то, что в приоритетной заявке и материалах заявки на дату подачи сведения об улучшенных характеристиках апиксабана отсутствуют.

На заседании коллегии, состоявшемся 29.10.2025, лицом, подавшим возражение, представлено дополнение к возражению в отношении несоответствия изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень» (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии).

К дополнениям приложены копии следующих материалов:

- патентный документ WO 1998/057934 A1, дата публикации 23.12.1998, с частичным переводом на русский язык (далее – [7]).

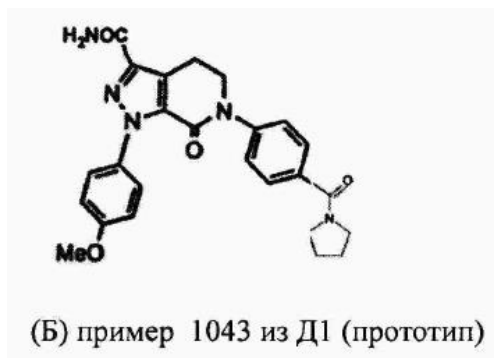
Кроме того, приложено дополнение к ранее представленному частичному переводу документа [1].

При этом, в дополнениях отмечено, что технический результат в описании оспариваемого патента прямо не сформулирован.

Приведенные в описании численные значения ингибирующей по отношению к фактору Ха активности апиксабана, по мнению лица, подавшего возражение, не позволяют сделать вывод об улучшении в количественном отношении по сравнению с известными из документа [1] соединениями того же назначения.

Таким образом, в дополнениях сделан вывод о том, что техническим результатом группы изобретений по оспариваемому патенту является расширение арсенала средств для реализации заявленного назначения - «лечение тромбоземболических заболеваний».

В качестве прототипа аликсабана по оспариваемому патенту в дополнениях указано соединение по примеру 1043 описания к патентному документу [1]



По мнению лица, подавшего возражение, единственным отличием аликсабана от известного из документа [1] соединения 1043 является наличие в структуре аликсабана В-радикала 2-оксо-1-пиперидинила.

При этом в дополнениях отмечено что такой радикал известен у сходного соединения того же назначения, раскрытого в патентном документе [7].

Так, отмечено, что в документе [7] раскрыта группа ароматических соединений схожей структуры, при этом характеризующаяся признаком - терминирующий (примыкающий к А-радикалу фенилу) В-радикал - пиперидинил, замещенный группой =O (пункт 1 и зависимые от него пункты 2-3 формулы документа [7]), а также известны содержащие его фармацевтические композиции (пункты 6-10 формулы документа [7]).

Кроме того, по мнению лица, подавшего возражение, из документа [7] также известен и достигаемый для этих соединений и содержащих их композиций технический результат - реализация того же назначения (и расширение арсенала средств того же назначения), а именно для лечения тромбоемболических заболеваний (пункт 6, а также зависимые от него пункты 7-10 формулы, с.156-157 и с.1, с.5-6 и с.2 перевода [7]).

Кроме того, в дополнении к возражению лицом, подавшим возражение, указано, что «техническое решение по пунктам 1-2 (аликсабан) не имеет изобретательского уровня, не является селективным изобретением

при известности его прототипа из Д1 с учетом присущих этому соединению свойств - активности (уточненной численно в Д5)» (Д1, Д5 = [1], [5]).

На заседании коллегии, состоявшемся 23.12.2025, патентообладателем представлены пояснения по мотивам позиции лица, подавшего возражение, от 03.09.2025 (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии).

К пояснениям приложен перевод с.207-208 документа [1].

Патентообладатель повторно поясняет, что таблицы 6, 8 и 9 содержатся в материалах заявки, они были правомерно представлены в процессе делопроизводства по заявке и были включены в описание патента.

В отношении документа [7] патентообладатель отмечает, что данный документ указан в разделе «Предыдущий уровень техники» описания к оспариваемому патенту (с.5 описания) и соответственно, был учтен при проведении экспертизы.

Также патентообладатель обращает внимание на то, что соединение примера 10 из документа [1] отличается от аписабана не только заместителем фенильного кольца, но и структурой бицикла (иллюстрации приведены).

Кроме того, патентообладатель отмечает, что группа 1-пирролидинокарбонил в соединениях, раскрытых в документах [2] или [3] и группа 2-оксо-1-пиперидинил в аписабане практически не имеют ничего общего с точки зрения своих химических свойств, хотя являются изомерами, т.е. просто имеют одинаковое количество атомов углерода, азота, кислорода и водорода. Карбонильная группа в 2-оксо-1-пиперидиниле не может образовывать делокализованную π -электронную систему с фенильным кольцом, поскольку она пространственно отдалена от него двумя одинарными связями, что препятствует участию карбонильной группы в мезомерном эффекте, в отличие от образования системы сопряженных двойных связей, когда карбонильная группа связана непосредственно с ароматической группой, как в противопоставленных соединениях.

В отношении сведений раскрытых в документе [6] патентообладатель сообщает, в частности, что на фигуре 8 изображен классический пример прототропной таутомерии, а именно лактим-лактамной таутомерии, при которой группа =O при присоединении протона от соседней группы -NH переходит в группу -OH, однако в 1-пирролидинокарбониле и 2-оксо-1-пиперидиниле отсутствует «мобильный протон атома азота», и отсутствует группа -OH, поскольку атомы N в обоих соединениях являются третичными атомами азота.

Кроме того, патентообладатель уточняет, что в документе [1] не было получено и изучено соединение 1043, по мнению патентообладателя оно сконструировано лицом, подавшим возражение, исходя из набора заместителей «R1a = CONH2, A = фенил, B = 1-пирролидинокарбонил», при выборе «G-метокси-фенил» из 17-и возможных значений заместителя G.

При этом в документе [7] раскрыты совершенно другие соединения общих формул. По мнению патентообладателя, документ [7] в основном направлен на соединения на основе ароматических или гетероароматических шестичленных N-содержащих циклов, как указано в пунктах 2 и 3 формулы [7], т.е., фрагментов, которые отсутствуют в структуре соединения по оспариваемому патенту.

Также патентообладатель отмечает, что документ [5] не является уровнем техники для изобретения по оспариваемому патенту, поскольку он стал общедоступным после даты его приоритета, и был представлен самим патентообладателем для подтверждения того, что аликсобан обладает улучшенными фармакологическими характеристиками, в частности, улучшенной ингибирующей активностью по сравнению с раскрытыми в [5] соединениями, в частности с соединением 5, а не наоборот.

На заседании коллегии, состоявшемся 13.02.2026, лицом, подавшим возражение, представлены пояснения по мотивам позиции патентообладателя от 23.12.2025 (см. приложение №1 к протоколу заседания коллегии).

К пояснениям приложены выдержки из документа [4].

Лицо, подавшее возражение, отмечает, что соединения с бициклической центральной структурой - полностью идентичной апиксабану получены и исследованы в документе [1], подтверждена их ингибирующая активность к фактору Ха, в частности соединение примера 99 в патентном документе [1].

Соединение примера 99 документа [1] может быть рассмотрено в качестве альтернативного прототипа, где отличающимся признаком будет В-радикал.

В документе [1] раскрыты и исследованы не только соединение примера 99, а также и другие соединения в примерах 100-104 - с такой же идентичной бициклической системой апиксабана, каждое из которых исследовано и обладает активностью для лечения тромбоэмболических заболеваний.

При этом, по мнению лица, подавшего возражение, радикал - 2-оксо-1-пиперидинил, отличающий апиксабан от известного из документа [1] соединения, известен из документа [7] - пиперидинил, замещенный группой =O (пункт 1 и зависимые от него пункты 2-3 формулы [7]), а также известны содержащие его фармацевтические композиции (пункты 6-10 формулы [7]) или из документов [2] или [3], с учётом сведений из документов [4] и [6]. При этом лицом, подавшим возражение, приведены доводы в отношении изомерии соединений с одинаковой молекулярной массой и конформационной перестройке.

В корреспонденции, поступившей 20.02.2026 лицом, подавшим возражение, представлен заменяющий документ, в котором исправлена техническая ошибка, а именно включены доводы в отношении технического результата, по ошибке пропущенные ранее в пояснениях от 13.02.2026.

При этом лицо, подавшее возражение, настаивает на том, что в соответствии с описанием техническим результатом, на достижение которого

направлены изобретения по оспариваемому патенту, является именно расширение арсенала технических средств известного назначения.

На заседании коллегии, состоявшемся 13.04.2026, лицом, подавшим возражение, представлены сведения о рассмотрении патента-аналога в Патентном ведомстве Польши (см. приложение №2 к протоколу заседания коллегии), а также резолютивная часть по результатам рассмотрения спора в упомянутом ведомстве (см. приложение №4 к протоколу заседания коллегии).

Кроме того, лицом, подавшим возражение, озвучен новый довод, ранее отсутствовавший в возражении и дополнениях к нему, а именно несоответствие соединения и композиций на его основе по оспариваемому патенту, условию патентоспособности «новизна» в свете известности из патентного документа [1] общей структурной формулы группы соединений, в которую входит апиксабан в качестве одной из альтернатив (соответствующие радикалы раскрыты на с.12 возражения), который при этом не отвечает требованиям, предъявляемым к селективным изобретениям, поскольку, в частности, по отношению к соединению 61 не проявляет новых свойств ни в качественном, ни в количественном отношении (см. пункт 6 протокола заседания коллегии от 13.04.2026).

Позднее на данном заседании коллегии, лицом, подавшим возражение, приобщены письменные доводы о несоответствии изобретений по пунктам 1 и 10 формулы оспариваемого патента условию патентоспособности «новизна» (см. приложение №6 к протоколу заседания коллегии).

Кроме того, лицо, подавшее возражение, ходатайствовало об исключении из рассмотрения прототипа, представляющего собой соединение 10, раскрытое в документе [1], в качестве прототипа соединений по пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента. При этом лицо, подавшее возражение, указывает в качестве прототипа соединение примера 99 документа [1]. Ходатайство было удовлетворено.

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 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.

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.

Однако следует констатировать, что назначение изобретения, заключающееся в создании лактамсодержащего соединения и его производных, которые представляют собой ингибиторы подобных трипсину серинпротеазных ферментов, в особенности, фактора Ха, а также фармацевтических композиций, содержащих указанные ингибиторы, способов их использования в качестве антикоагулирующих агентов для лечения тромбоэмболических заболеваний указано на с.3, абзац 1 описания (см. название изобретения).

Соединение по пунктам 1 и 2 формулы (апиксабан) было получено в примере 18 описания к оспариваемому патенту. Апиксабан является ингибитором фактора Ха и полезен в качестве антикоагулянта для лечения тромбоэмболических заболеваний (с.54 описания).

Примеры фармацевтических композиций в форме таблеток представлены в таблице 7 описания.

Перечень тромбоэмболических заболеваний, охарактеризованных в пунктах 5-9, 12-16 формулы оспариваемого патента приведен на с.54 описания.

Кроме того, на с. 56 описания к оспариваемому патенту приведено также описание *in vivo* способа, с помощью которого может быть продемонстрировано антитромботическое действие соединения по изобретению на модели кролика с тромбозом, вызванным артерио-венозным шунтированием.

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.

На с.57 описания к оспариваемому патенту указано, что используя раскрытую в описании методику, были исследованы некоторые соединения по изобретению, и было обнаружено, что они имеют K_i меньше, чем 10 мкМ, тем самым подтверждая полезность соединений по изобретению в качестве эффективных ингибиторов тромбина.

При этом необходимо акцентировать внимание на том, что как справедливо отмечает патентообладатель, аписабан является единственным соединением, которое было получено в граммовых количествах (3,07 г), в отличие от прочих соединений, которые были получены в количествах, не превышающих десятки или сотни миллиграммов. При этом аписабан был единственным соединением, подвергнутым многостадийной перекристаллизации с использованием различных систем растворителей с целью выделения высокоочищенного продукта с максимально возможным выходом.

Следует согласиться, что количества нового соединения порядка 500 мг или выше требуются в единственном случае, когда соединение представляет наибольший интерес из всей группы соединений, предложенных в материалах заявки, по которой выдан оспариваемый патент.

Соответственно, нет причин сомневаться в том, что в число упомянутых на с.57 описания соединений, имеющих по результатам исследований K_i меньше, чем 10 мкМ, входит соединение по пунктам 1 и 2 формулы оспариваемого патента.

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, как оно представлено на дату приоритета изобретений, приведено достаточно сведений позволяющих убедиться в том, что предложенные изобретения могут быть использованы в здравоохранении.

В соответствии с изложенным, следует констатировать, что группа изобретений по оспариваемому патенту, соответствует условию патентоспособности «промышленная применимость» (пункт 1 статьи 4 Закона, пункт 19.5.1. Правил).

Анализ доводов сторон, касающихся оценки соответствия изобретений по оспариваемому патенту условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень», показал следующее.

Прежде всего, в отношении сведений, раскрытых в таблицах 6, 8, 9 описания к оспариваемому патенту, 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.

При этом упоминание о необходимости наличия сведений в первоначальных материалах заявки, в данном случае на дату приоритета изобретений по оспариваемому патенту, приведено только в пункте 19.5.1. Правил, относящемся к оценке промышленной применимости и не является требованием в пунктах Правил, относящимся к оценке соответствия изобретений условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень» (см. правовую базу выше).

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

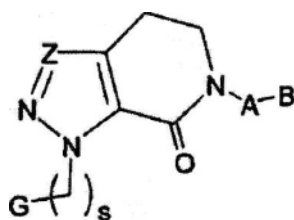
Однако указывает, что в патентном документе [1] среди большого количества альтернатив в формуле Маркуша можно собрать и составить соединение с радикалами, соответствующими соединению по оспариваемому патенту.

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).

Довод лица, подавшего возражение, изложенный им на заседании коллегии, состоявшемся 13.04.2026, о том, что если требование подпункта 4 пункта 19.5.3 Правил (селективное изобретение) не выполнено, то тогда изобретение не соответствует новизне, некорректен, поскольку очевидно, что если такое требование не выполнено, то изобретение не соответствует именно изобретательскому уровню.

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 A) 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 упомянутых 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.

Таким образом, соединение аписабан, несколько затруднительно, но все же можно сконструировать исходя из сведений раскрытых в пункте 1 документа [1]. Поэтому следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что аписабан подпадает под общую структурную формулу группы известных из документа [1] соединений.

Однако аписабан в патентном документе [1] специально не получали и не исследовали.

Таким образом, индивидуальное соединение аписабан по оспариваемому патенту не известно из уровня техники, является новым соединением, т.е. соответствует условию патентоспособности «новизна» согласно подпункту 1 пункта 19.5.2 Правил и, с учетом изложенного выше, его следует оценивать в соответствии с положениями подпункта 4 пункта 19.5.3 Правил (селективное изобретение).

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, апиксабан, согласно сведениям из таблицы 6 (с.166-174) имеет $K_i=0,08$ нМ, что соответствует $0,00008$ мкМ.

Здесь следует пояснить, что изложено выше, что таблицы 6, 8 и 9 содержащиеся в описании к оспариваемому патенту были правомерно представлены в процессе делопроизводства по заявке и были правомерно включены в описание патента.

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.

Документ [5] не является уровнем техники для изобретений по оспариваемому патенту, поскольку он стал общедоступным после даты его приоритета и не учитывался при оценке изобретений по оспариваемому патенту условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Таким образом, группа изобретений по оспариваемому патенту, соответствует условию патентоспособности "изобретательский уровень" в свете требований, установленных законодательством по отношению к селективным изобретениям (подпункт 4 пункта 19.5.3 Правил).

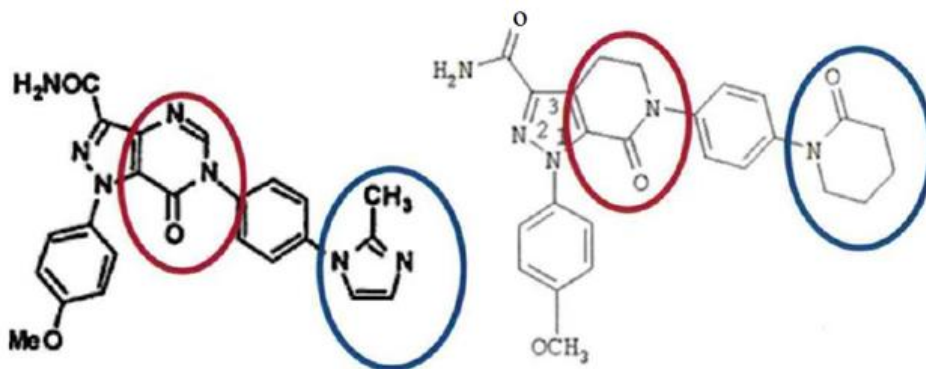
Далее, в отношении довода возражения о несоответствии апиксабана и композиции на его основе условию патентоспособности «изобретательский уровень» в свете соединений общей структурной формулы по независимому пункту 1 формулы документа [1] и сведений раскрытых в документах [2] и [3] необходимо отметить следующее.

Техническим результатом изобретений по оспариваемому патенту является предоставление новых ингибиторов фактора Ха с улучшенными фармакологическими характеристиками, в частности, с улучшенной

ингибирующей активностью (см. с. 8, абзац 1 описания к оспариваемому патенту).

Следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что независимый пункт 1 формулы документа [1] охватывает многие миллиарды индивидуальных соединений, в 109 примерах получения соединений, представленных в документе [1], отсутствуют какие-либо примеры, иллюстрирующие получение соединений, в которых заместитель, соответствующий радикалу В в структуре Маркуша, приведенной в пункте 1 формулы документа [1], представлял бы собой какое-либо оксопиперидинильное кольцо, в частности 2-оксо-1-пиперидинил, присутствующий в структуре аликсабана по оспариваемому патенту.

Как уже было отмечено выше, конструирование соединения аликсабан крайне затруднительно даже без учета радикала 2-оксо-1-пиперидинил, выделенного лицом, подавшим возражение, в качестве отличительного признака. При этом соединение примера 10 документа [1] было исключено лицом, подавшим возражение, из рассмотрения в качестве прототипа, однако все же стоит отметить, что соединение 10 документа [1] отличается не только радикалом 2-оксо-1-пиперидинил в В-заместителе, но и центральным фрагментом в структуре. Для наглядности можно воспользоваться иллюстрациями приведенными патентообладателем:



Соединение Примера 10 Д1

Соединение Формулы 1 по пункту 1

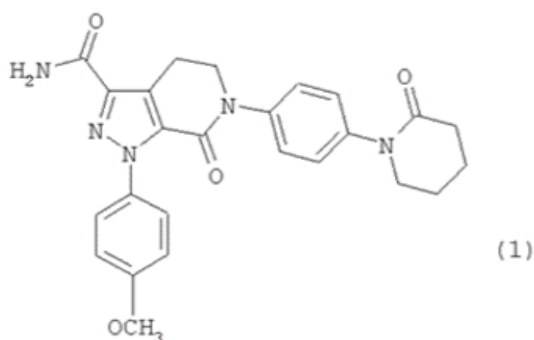
Что касается соединения 1043, то оно не было получено как таковое в документе [1], соответственно не было исследовано, соединение сконструировано лицом, подавшим возражение, лишь охватывается

документом [1] (см. с.207-208 документа [1]), не может быть использовано для оценки изобретательского уровня изобретений по оспариваемому патенту как это предусмотрено подпунктом 1 пункта 19.5.3 Правил.

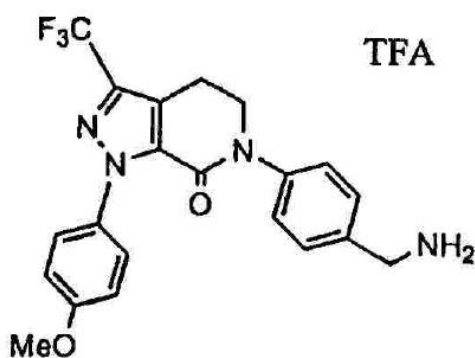
Таким образом, согласно разъяснениям лица, подавшего возражение, данным в ходе рассмотрения на заседании коллегии, состоявшемся 13.04.2026, наиболее близким аналогом (прототипом) к аликсабану по оспариваемому патенту является соединение 99 документа [1].

С данным мнением следует согласиться, поскольку соединение 99 имеет три идентичных структурных особенности с аликсабаном.

При этом аликсабан по оспариваемому патенту



отличается наличием в своей структуре радикала 2-оксо-1-пиперидинил в В-заместителе, а также наличием заместителя -CONH₂ в бицикле против группы -CF₃ в структуре соединения 99 документа [1]:



соединение примера 99 документа [1]

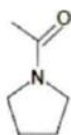
Здесь целесообразно отметить, что практика сбора оспариваемого соединения путем подбора соответствующих или «эквивалентных» радикалов, имеющих в структуре у других соединений, известных из уровня техники, даже если они обладают тем же видом активности, не

сформировалась, и можно согласиться, что такой подход представляет собой тот самый ретроспективный анализ уровня техники, описанный в документе [E].

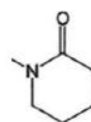
Тем не менее, следуя доводам лица, подавшего возражение, необходимо констатировать, что в уровне техники не выявлены соединения того же назначения, у которых в структуре присутствуют отмеченные выше радикалы.

В отношении замены радикала $-CF_3$ в структуре соединения 99 документа [1] на радикал $-CONH_2$ присутствующий в соответствующем положении бицикла в структуре аписабана, доводы в возражении и дополнениях к нему как таковые не приведены, на заседании коллегии, состоявшемся 13.04.2026, лицом, подавшим возражение, отмечено, что такая замена очевидна для специалиста в данной области техники, при этом данное утверждение ничем не подкреплено.

Однако, что касается наличия радикала 2-оксо-1-пиперидинил в В-заместителе в структуре аписабана, то такой заместитель не раскрыт для соединений, известных из документов [2] или [3].



1-пирролидинокарбонил



2-оксо-1-пиперидинил

Очевидно, что представленные выше схематичные изображения радикалов присутствующих у соединений в документах [2] или [3] свидетельствуют о том, что данные химические радикалы не являются идентичными, а их эквивалентность не подтверждена в возражении.

Так, источник информации [6], представляющий собой снимок экрана не может быть использован для оценки соответствия изобретения по оспариваемому патенту условиям патентоспособности в связи с отсутствием достоверного подтверждения того, что данный источник стал общедоступен

до даты приоритета изобретения 21.09.2001 для возможности включения его в уровень техники.

В любом случае, и здесь следует согласиться с доводом патентообладателя о том, что данный документ содержит справочные сведения общего характера в отношении номенклатуры и изомерии соединений, и он не имеет отношения к изобретению по оспариваемому патенту.

В частности, в документе [6] представлен видеоурок по химии «Циклоалканы», который позволяет сформировать у учащихся представления о циклоалканах как о карбоциклических соединениях при том, что ни 1-пирролидинкарбонил ни 2-оксо-1-пиперидин не являются циклоалканами, а являются гетероциклами с атомом азота.

Документ [4] относится к химии гетероциклических аминов, показывает конформационные преобразования для перехода в устойчивое состояние, однако не иллюстрирует и не раскрывает с какой целью пирролидин трансформируется в пиперидин в соединениях, аналогичных аликсабану и в соединениях совершенно иной структуры согласно документам [2] и [3].

Кроме того, не ясно чем мог бы быть мотивирован специалист в данной области техники, для выбора соединения 99 из патентного документа [1], сведения по активности для которого, в данном документе не приведены и его модифицировать по двум заместителям с целью получения аликсабана по оспариваемому патенту.

Что касается комбинирования сведений, содержащихся в документах [1] и [7], то необходимо отметить следующее.

В документе [7] раскрыты иные соединения общих формул. Документ [7] направлен на соединения на основе ароматических или гетероароматических шестичленных N-содержащих циклов, как указано в пунктах 2 и 3 формулы [7], т.е., фрагментов, которые отсутствуют в структуре аликсабана.

Структурная формула I, приведенная в пункте 1 формулы изобретения патентного документа [7], имеет отношение к соединению, содержащему конденсированную бициклическую гетероароматическую систему (образованную кольцом M вместе с присоединенными к нему соседними радикалами R1a и R1b), такая система отличается по структуре от фрагмента пиразололопиперидинона, присутствующего в апиксабане, по крайней мере, отсутствием лактамной функциональной группы.

Альтернативно, когда в формуле I Z представляет собой C(O)NH, а R1a, присоединенный к углероду кольца M, соседствующему с Z, представляет собой C(O) и заменяет водород амида Z с образованием циклического имида, полученная конденсированная бициклическая система также будет отличаться по своей структуре от пиразололопиперидиновой группы, присутствующей в апиксабане.

Специалист в данной области техники совершенно не мотивирован выбирать какие либо фрагменты формул предложенных в документе [7] соединений и объединять их со сведениями, раскрытыми в документе [1], что бы получить соединение аналогичное апиксабану с хорошими показателями биологической активности.

Таким образом, сведения раскрытые в документах [1]-[4], [6]-[7], в любом их сочетании, не свидетельствуют об очевидности и предпочтительности именно той специфической комбинации заместителей, которая присутствует в соединении по оспариваемому патенту, а также отсутствуют указания на то, что именно такая комбинация будет обеспечивать ингибитор фактора Ха с улучшенными фармакологическими характеристиками, в частности, с улучшенной ингибирующей активностью.

Констатируя сказанное, можно сделать вывод о том, что в возражении не представлено доводов, позволяющих признать изобретения по оспариваемому патенту несоответствующими условиям патентоспособности «изобретательский уровень» (пункт 19.5.3 Правил).

Решение Роспатента [D] не противоречит сделанному выше выводу.

В отношении сведений, представленных в документах [В] и [С], следует отметить, что споры рассматривались в иных юрисдикциях и не могут быть прямо экстраполированы на рассмотрение возражений в Роспатенте.

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

отказать в удовлетворении возражения, поступившего 12.03.2025, патент Российской Федерации на изобретение № 2345993 оставить в силе.