

Некоторые аспекты правовой охраны изобретений в области фармацевтики и медицины в Евразийском патентном ведомстве

М. Игнатов,
(г. Москва) MIgnatov@EAPO.ORG



М. Серова,
(г. Москва) MSerova@EAPO.ORG



В статье специалистов Евразийского патентного ведомства – к.х.н., начальника отдела химии и медицины М.Е. Игнатова и к.ю.н., зам. начальника отдела химии и медицины М.А. Серовой рассматриваются критерии патентоспособности изобретений в области фармацевтики и медицины. Авторами делается вывод о нецелесообразности введения в законодательство ЕАПВ дополнительных ограничений в отношении предоставления правовой охраны лекарственным средствам и способам лечения.

Experts of the Eurasian patenting authority – head of Chemistry&Medicine Department M. Ignatov (Ph. D. in Chemistry) and his deputy head M. Serova (Ph. D. in Law) examine the criteria for patentability of inventions in the area of pharmaceuticals and medicine. They come to the conclusion that the Eurasian patenting authority should not introduce additional restrictions on the legal protection for medications and methods of treatment.

Ключевые слова:

формула Маркуша, полиморфная форма, лекарственное средство, селективное изобретение, условия патентоспособности, отличительные признаки композиции, ЕАПВ.

Keywords:

Marcush formula, polymorph shape, medication, selective innovation, patentability conditions, distinctive attributes of a composition, Eurasian patenting authority.

В соответствии с нормами Евразийского патентного права объектом изобретения может являться устройство, способ, вещество, биотехнологический продукт, а также применение устройства, способа, вещества, биотехнологического продукта [1].

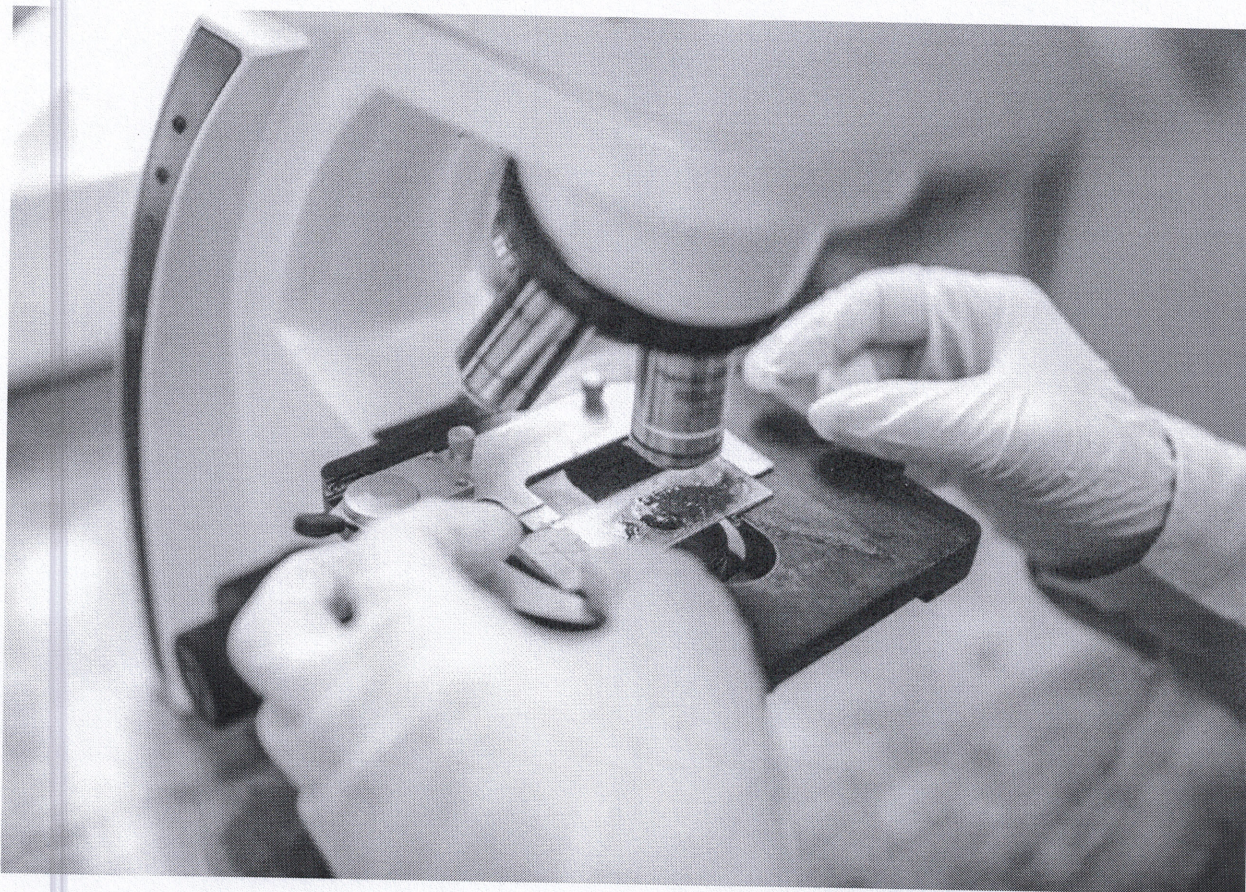
Среди изобретений, относящихся к области фармацевтики и медицины, значительная часть касается лекарственных средств, поскольку патентная охрана является одним из основных факторов, стимулирующих инновационную деятельность в фармацевтической промышленности. Патентоспособными объектами изобретений, относящихся к лекарственным средствам, могут являться фармацевтические продукты, способы их получения и применение в медицинских целях. К фармацевтическим продуктам относятся, в частности, химические соединения и биотехнологические продукты, обладающие фармакологической активностью, и фармацевтические композиции, содержащие несколько ингредиентов. Условия патентоспособности для всех изобретений, независимо от области техники, в том числе относящихся к лекарственным средствам, идентичны: промышленная применимость, новизна и изобретательский уровень [2].

В ЕАПВ невозможна защита вещества с новым назначением, если оно известно из уровня техники и известно его использование по другому, в том числе не медицинскому назначению, поскольку новизна изобретения, касающегося вещества, оценивается по совокупности признаков, характеризующих вещество без учета его назначения. Объектом изобретения в случае обнаружения у известного вещества нового свойства может быть только применение этого вещества по новому назначению. По мнению авторов, существование такого объекта необходимо, поскольку в данном случае предоставляется охрана изобретению, основанному именно на обнаружении новой активности (нового свойства) известного ве-

щества и его использованию на основе этих свойств. При этом обязательным условием выдачи патента является наличие в материалах заявки достоверных сведений, подтверждающих возможность применения вещества по заявленному назначению.

Нарушителем прав на запатентованное изобретение, относящееся к применению известного вещества по новому назначению, является и то лицо, которое непосредственно его применяет, и то, которое подготовило его к применению, в частности, поставило на рынок в форме, «подготовленной к применению» («упакованным для применения»). Если же вещество введено в хозяйственный оборот для использования по другому назначению, что может быть отражено, например, в аннотации к соответствующему лекарственному препарату, то такие действия не нарушают прав патентообладателя на указанный выше патент.

В особую группу изобретений, относящихся к химическим соединениям с установленной структурой, можно выделить различные полиморфные (кристаллические) формы. Такие изобретения часто встречаются в области фармакологии, поскольку, например, одна кристаллическая форма по целому ряду показателей может быть более эффективной для получения лекарственного средства, предназначенного для лечения какого-либо заболевания, чем другая форма. Каждая полиморфная форма соединения, известного из уровня техники или впервые полученного заявителем, должна быть охарактеризована в формуле изобретения физико-химическими данными (рентгено-фазовый анализ (далее – РФА), инфракрасная спектроскопия, ядерно-магнитный резонанс и т.д.). Наиболее точными и приемлемыми являются данные РФА (обычно в виде перечисления основных, т.е. наиболее интенсивных, пиков на дифрактограмме) или, если получен монокристалл заявленной кристаллической формы, данными рентгено-структурного



© istockphoto.com/Bogdanhoda

анализа. В формулу изобретения можно включать данные РФА в виде таблицы, а также допускается отсылка к самой дифрактограмме, показанной на соответствующей фигуре. Аналогичные требования относятся и к аморфным формам соединений.

Одна евразийская заявка может относиться к группе изобретений, представленной формулой, содержащей характеристику нескольких различных полиморфных форм одного соединения или полиморфные формы разных производных этого соединения (солей, сольватов, гидратов и т.п.). Для того чтобы новая полиморфная форма известного соединения отвечала условию патентоспособности «изобретательский уровень», необходимо в материалах заявки представить сведения, подтверждающие наличие у этой формы новых, неизвестных для указанного соединения свойств в качественном и/или количественном отношении.

Значительная часть заявок подается в ЕАПВ на *селективные изобретения*. К таким изобретениям

относятся, в частности, соединения, подпадающие под общую структурную формулу известных соединений, но специальным образом не полученные и не исследованные. Для защиты таких соединений необходимо, чтобы они были синтезированы и охарактеризованы и проявляли новые, неизвестные для группы свойства в качественном и/или количественном отношении. Примером селективного изобретения может быть следующее.

Заявленное вещество является частным случаем группы известных соединений, охарактеризованных общей структурной формулой, причем для этих соединений показана противоопухолевая активность в отношении карциномы желудка. Поскольку заявленное соединение не было описано ранее как специально полученное и исследованное, оно является новым. Автор изобретения впервые обнаружил, что это вещество способно также эффективно предотвращать метастазирование опухоли, что очевидным образом не следует из предшествующего уровня техники. Таким образом, заявленное соединение

признается проявляющим новое, неизвестное для ранее описанной группы соединений свойство и соответствующим также условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Если заявлен способ получения соединения, включающий в качестве отличительного признака какой-либо параметр (температуру, давление, соотношение реагентов, концентрацию и т.п.), который попадает в известный из уровня техники интервал, такое изобретение может рассматриваться как селективное в случае, когда в этом интервале при реализации способа достигается новый, неизвестный результат (например, резко повышается выход целевого продукта или продукт приобретает новое свойство, не описанное в уровне техники). Сведения, подтверждающие указанный выше новый результат, должны быть представлены в материалах заявки и однозначно свидетельствовать о достижении этого результата.

В формулу изобретения, относящегося к новым химическим соединениям, индивидуальным или представленным формулой Маркуша, может не включаться указание на назначение заявленного изобретения, однако в описании заявки должны быть приведены сведения, характеризующие назначение этих соединений. Если из содержащихся в материалах заявки сведений не представляется возможным однозначно определить назначение соединений, то это является основанием для вынесения решения о несоответствии данного изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость».

Отдельные соединения редко становятся объектами изобретения. Большая часть евразийских заявок в области химии подается на соединения с установленной структурой, описываемые формулой Маркуша, способы их получения и их применение в различных областях промышленности, но наиболее часто в области фармацевтики и медицины.

Если изобретение относится к группе (ряду) новых химических соединений с установленной структурой, описываемых общей структурной формулой, то, согласно евразийскому законодательству, подтверждается возможность получения всех соединений группы путем приведения сведений, включающих общую схему способа их получения, а также

примера получения, по меньшей мере, одного соединения группы (ряда) и, кроме того, показывается возможность реализации по указанному назначению по меньшей мере одного соединения группы. Если группа (ряд) новых химических соединений с общим существенным структурным элементом включает (представляет собой) соединения с разными по химической природе радикалами, то приводятся примеры, достаточные для подтверждения возможности получения соединений с этими разными радикалами, и обоснования возможности реализации всех таких соединений по заявленному назначению. В примерах осуществления изобретения раскрывается способ получения определенного соединения с указанием выхода данного соединения, его физико-химических констант, подтверждающих факт получения данного соединения, и приводятся результаты анализа, доказывающие структуру полученного соединения.

В ЕАПВ невозможна защита вещества с новым назначением, если оно известно из уровня техники и известно его использование по другому, в том числе не медицинскому назначению, поскольку новизна изобретения оценивается по совокупности признаков, характеризующих вещество без учета его назначения

Стремление экспертов ЕАПВ ограничить пункт формулы, насколько это возможно, приведенными примерами вызывает возражения со стороны заявителя. Следует понимать, что никто не в состоянии представить все возможные примеры, подтверждающие получение всех соединений, охватываемых общей структурной формулой. Достаточность примеров определяется экспертом в каждом конкретном случае. В некоторых ситуациях известные закономерности позволяют распространить способ получения конкретного соединения и на другие соединения данной группы, если же такая возможность отсутствует, приводятся примеры на получение всех соединений, входящих в группу. Обычно достаточным является приведение одного примера получения соединения, относящегося к каждой из групп разной химической природы.

Поскольку разнообразие функциональных групп и радикалов в органической химии чрезмерно велико, признак «разные по химической природе радикалы» по существу означает, что в одной заявке может быть представлено огромное число соединений, объединяемых общей структурной формулой. Оценка патентоспособности таких изобретений сложна и обычно вызывает наибольшее число проблем. Соответствующие заявки отличаются широким объемом притязаний и зачастую в них отсутствуют сведения, подтверждающие возможность осуществления изобретения в полном объеме. Решение этой проблемы представляет собой не легкую задачу, однако некоторыми требованиями для ограничения числа соединений, описываемых формулой Маркуша, могут, например, являться следующие: наличие общей структурной формулы для всех соединений, которые она объединяет (альтернативами могут быть только заместители); общая структурная формула не должна представлять собой буквенную схему, которая формулой не является (скажем, А1-А2-3Х-4М, где А1, А2, Х и М, в свою очередь, представляют собой соединения, выраженные общей структурной формулой с различными значениями радикалов); общая структурная формула не должна содержать неясные признаки, типа «замещенный арил», «алкил» (без указания числа атомов углерода), «отщепляемая группа», «функциональная группа», «полимерная группа» и т.д.

Известность общей структурной формулы не порождает новизну конкретного соединения, подпадающего под общую формулу. Однако раскрытие конкретного соединения порождает новизну изобретения, охарактеризованного общей структурной формулой, включающей это соединение, но только в части данного соединения, и не порождает новизну других соединений, охватываемых этой общей формулой. Если часть заявленных соединений, описываемых общей структурной формулой, известна из уровня техники, эти соединения должны быть исключены из притязаний. При этом следует иметь в виду, что новизна химического соединения может быть опровержена, если из уровня техники известна его структурная формула (или название в соответствии с одной из принятых номенклатур), а также известен способ получения соединения (или он является для специалиста очевидным), или известны сведения о фактическом получении и/или использовании соединения, или известно

о возможности открытого доступа к этому соединению. Иными словами, «просто бумажная формула» не может быть противопоставлена заявленному химическому соединению по новизне.

Если независимый пункт формулы изобретения включает помимо самих соединений их различные производные (соли, сольваты, гидраты, изомеры, пролекарства и т.д.), то при оценке патентоспособности таких изобретений экспертиза ЕАПВ использует следующие подходы. Такой признак, как «соли» (чаще всего «фармацевтически приемлемые соли»), может быть принят экспертизой, даже если в описании отсутствуют примеры получения солей, а имеется лишь перечисление возможных представителей этих производных. Однако если, например, в зависимом или *отдельном* пункте формулы заявлена какая-либо конкретная соль, необходимо, чтобы в описании был приведен пример получения этой соли с описанием ее физико-химических характеристик.

Если в качестве указанных выше производных заявлены гидраты, сольваты, эфиры, амиды соединений, в описании должны быть представлены сведения о способах получения этих производных с указанием их физико-химических характеристик и приведены соответствующие примеры. При отсутствии указанных сведений заявителю направляется уведомление с предложением представить недостающие данные или исключить соответствующие объекты из объема притязаний.

Такие признаки, как «пролекарство», «миметик», «метаболит», фактически характеризуют функциональное назначение, а не структуру самого соединения. Поэтому эти признаки следует исключать из притязаний или представлять их в виде конкретных производных (например, эфиров или амидов), если эти производные описаны в первичных материалах заявки.

Для изобретений, относящихся к композиции, в формулу изобретения включаются следующие признаки:

- «качественный состав» (ингредиенты);
- «количественный состав» (содержание ингредиентов);
- «структурные характеристики».



© istockphoto.com/psphotograph

Для композиции неустановленного состава в формулу изобретения включаются физико-химические, физические, утилитарные показатели, а также признаки способа получения этой композиции.

Неправомерно использовать в качестве отличительных признаков композиции сведения, непосредственно не относящиеся к составу и способу получения самой композиции (например, условия и режимы использования этой композиции в каком-либо процессе); количественный параметр (измеряемый или рассчитываемый), характеризующий одно или более свойств композиции, в случае, если этот параметр используется в качестве единственного отличительного признака в независимом пункте формулы (например, значения величин прочности ламинирования, сопротивления растрескиванию и т.п.). Для фармацевтических композиций не допускается использование в формуле изобретения признаков, относящихся к способу лечения или профилактики заболевания (указание доз, условий или режимов применения

композиции или лекарственного средства на ее основе).

В состав композиции включаются признаки, характеризующие количественное содержание ингредиентов, в случае когда оно влияет на достижение технического результата и/или на возможность реализации назначения композиции. Чаще всего такие случаи имеют место для полимерных, пищевых, цементных смесей и т.п. Для таких композиций количественный состав приводится, как правило, в весовых или массовых процентах, а также в массовых частях. При этом необходимым условием является наличие в описании заявки примеров, в которых указывается количество каждого ингредиента композиции, выраженное в соответствующих единицах.

Для композиции, состоящей из известных ингредиентов (двух или более), обеспечивающих синергетический эффект (т.е. проявляющей новые свойства или свойства обоих ингредиентов,



© istockphoto.com/Totojang

но количественные показатели хотя бы одного из этих свойств в композиции выше известного показателя свойств отдельного ингредиента), необходимо, чтобы в материалах заявки были представлены конкретные данные, подтверждающие наличие такого синергизма. В этом случае композиция соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень». В противном случае по данной заявке выносится отказное решение в связи с несоответствием заявленного изобретения указанному выше условию патентоспособности. Например, заявлена композиция для снижения артериального давления, состоящая из соединений А и Б, для каждого из которых из уровня техники известна такая активность. Однако применение таких соединений вызывает множество побочных эффектов, таких как сухость во рту, тошнота, головная боль, нарушение сна, боли в желудке и т.д. Кроме того, каждое из этих соединений следует применять два раза в день. При использовании заявленной композиции частота побочных эффектов снижается и применять ее с достижением

эффективного результата можно один раз в день, что обусловлено синергическим действием входящих в ее состав компонентов. Изобретение признается соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Патентоспособное изобретение могут составить и новые лекарственные формы известного фармацевтически активного соединения (таблетки, мази, гели, аэрозоли, пластыри и т.д.). Для таких изобретений в описании должны быть приведены сведения, подтверждающие обеспечение нового неизвестного технического результата при использовании заявленной препаративной формы по сравнению с известными формами. Указанный результат может заключаться, например, в улучшении высвобождения активного компонента, изменении фармакокинетического профиля, повышении эффективности действия активного компонента в организме, снижении вводимой дозы и т.д. Если такой результат не показан, то изобретение не признается соответствующим условию патентоспособности

«изобретательский уровень», несмотря на то что соответствует условию патентоспособности «новизна».

Например, при известности пероральной формы соединения X, обладающего определенным видом фармакологической активности, возможна выдача патента на пластырь, обеспечивающий трансдермальную доставку этого вещества. При кажущейся очевидности такого решения оно может быть признано соответствующим условию патентоспособности «изобретательский уровень», однако только в том случае, если заявителем будет подтвержден новый, неизвестный технический результат, обеспечиваемый при его использовании, как отмечено выше. В данном случае пластырь может иметь особую конструкцию и содержать на поверхности подложки определенный материал, в котором соединение X присутствует в концентрации, подобранной специальным образом, что обеспечивает возможность его высвобождения в течение более длительного времени и позволяет избежать воспаления кожи при частой замене пластыря и уменьшить площадь его поверхности. Известные попытки создания пластырей на основе соединения X были безуспешны из-за его плохой растворимости в материалах, обычно используемых для нанесения на подложку пластыря.

Одним из наиболее распространенных объектов изобретения в заявках, подаваемых в ЕАПВ, являются способы профилактики, диагностики и лечения человека и животных. Такие способы довольно часто основаны на использовании известных лекарственных средств или физических факторов, в которых они выполняют свойственную им функцию, например, обезболивающую, противовирусную, противовоспалительную, противоопухолевую и т.д. Существенными признаками такого изобретения обычно являются изменения режимов и/или дозировок используемых препаратов. Для признания такого изобретения патентоспособным заявителю необходимо подтвердить, что использование новых схем введения и/или доз приводит к достижению нового, неизвестного технического результата, который не мог быть обеспечен известными схемами введения и/или дозами и не мог быть предсказан специалистом на основании предшествующего уровня техники. Например, в известном способе лечения заболеваний кожи известный препарат нужно было наносить три раза в день в дозе А и выздоровление

наступало не ранее, чем через неделю. При этом препарат стягивал кожу и способствовал образованию морщин. Заявителем была подобрана новая доза препарата, которая при использовании в течение первых трех дней два раза в день и в течение двух последующих дней четыре раза в день обеспечивала полное выздоровление, причем не вызывая сухости кожи. На соответствующий способ может быть выдан евразийский патент.

Нормативные документы ЕАПВ обеспечивают высокие требования к оценке патентоспособности изобретений, относящихся к области фармацевтики и медицины, способные предотвратить необоснованную выдачу патентов

Изобретения, относящиеся к способам лечения с использованием новых фармацевтически активных веществ, как правило, входят в состав группы изобретений, где основным объектом является собственно вещество. Для признания такого изобретения патентоспособным заявителю необходимо представить достоверные сведения, подтверждающие пригодность вещества для лечения указанных заболеваний. Действующее евразийское законодательство также предписывает заявителю представлять данные по активности, а в отдельных случаях и по токсичности, используемых соединений.

Достоверные сведения могут быть представлены различным образом и касаются, в основном, результатов исследований *in vitro* и *in vivo*. Определение того, считаются ли представленные сведения достоверными, зависит от сущности изобретения и известного уровня техники. Наиболее достоверными признаются результаты исследования на людях, но в евразийском законодательстве не существует требования обязательного их представления для подтверждения реализации изобретения, относящегося к лекарственному средству или способу лечения. Однако в некоторых случаях это может быть абсолютно необходимо для признания соответствия заявленного изобретения условию патентоспособности «промышленная применимость». Например, если предметом изобретения является средство для

ингибирования вирусной инфекции и показана способность этого средства уменьшать пролиферацию вируса в культуре клеток (эксперименты *in vitro*, использование которых для тестирования вирусных ингибиторов широко известно из уровня техники), специалист в принципе может экстраполировать этот результат на живой организм и признать, что данное средство будет противодействовать вирусной инфекции и в живом организме. Однако если заявлено средство для лечения нарушений речи, то достоверными сведениями, подтверждающими реализацию назначения такого средства, могут быть только эксперименты на людях, поскольку эксперименты *in vitro* и на животных не могут служить адекватной моделью соответствующих испытаний.

Таким образом, нормативные документы ЕАПВ обеспечивают высокие требования к оценке патентоспособности изобретений, относящихся к области фармацевтики и медицины, способные предотвратить необоснованную выдачу патентов. По мнению авторов, вводить какие-либо ограничения в отношении предоставления правовой охраны лекарственным средствам и способам лечения нецелесообразно. Наиболее действенное решение проблемы ограничения патентной монополии в области фармацевтики и обеспечения населения доступными лекарственными средствами лежит в плоскости государственного регулирования. ■

ЛИТЕРАТУРА:

1. Правила составления, подачи и рассмотрения евразийских заявок в Евразийском патентном ведомстве (п. 1.1), утв. приказом ЕАПВ от 15 февраля 2008 г. № 4 (вступили в силу 1 марта 2008 г. с изменениями и дополнениями, утв. приказом ЕАПВ от 19 декабря 2011 г. № 63, приказом ЕАПВ от 14 июня 2012 г. № 31. [Электронный ресурс] / <http://www.eapo.org/ru/documents/>.
2. Патентная инструкция к Евразийской патентной конвенции [Правило 3(1)], утв. Административным советом Евразийской патентной организации на втором (первом очередном) заседании 1 декабря 1995 г., с изменениями и дополнениями от 25–26 ноября 1997 г., 15–19 октября 2001 г., 17–21 ноября 2003 г., 14–18 ноября 2005 г., 13–15 ноября 2007 г., 30–31 марта 2009 г., 8–10 ноября 2010 г., 20–22 ноября 2012 г., 6–8 ноября 2013 г., 11–13 ноября 2014 г. [Электронный ресурс] / <http://www.eapo.org/ru/documents/>.