



# СТРАТЕГИИ ПАТЕНТНОЙ ЗАЩИТЫ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ

**Мария  
Пустовалова**

Старший эксперт,  
Руководитель направления Биомед  
Патентной практики

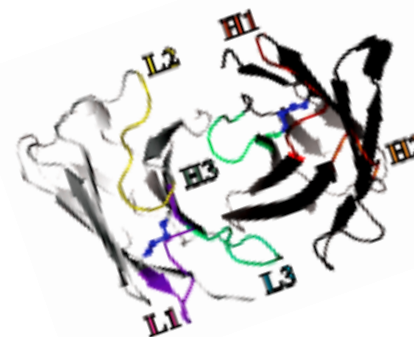
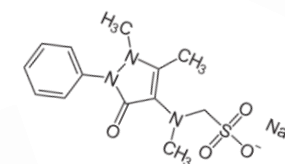
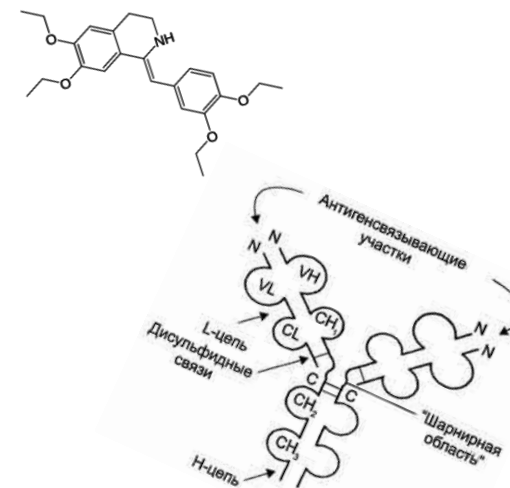
15.09.2017

## Центр интеллектуальной собственности «Сколково»

ООО «Центр интеллектуальной собственности «Сколково» является дочерним обществом Фонда «Сколково», оказывает участникам инновационного проекта «Сколково» и третьим лицам весь комплекс профессиональных услуг в области интеллектуальной собственности, включая патентование в России и за рубежом, проведение патентных поисков и построение патентных ландшафтов, регистрацию товарных знаков и программ для ЭВМ, юридическое сопровождение сделок по российскому и иностранному праву.

**Техническое решение** (созданные или преобразованные человеком материальные объекты или процессы), представляющее собой

- **ПРОДУКТ**, например,
  - Химическое соединение, в том числе высокомолекулярное соединение,
  - Композицию (состав, смесь),
  - Биотехнологический продукт (штаммы микроорганизмов, штаммы и линии клеток растений и животных, белки, пептиды, антитела, нуклеиновые кислоты, генетические конструкции),
- **СПОСОБ** - процесс выполнения действий (операций, приемов), приводящих к созданию новых или изменению известных материальных объектов,
- **ПРИМЕНЕНИЕ** – использование продукта или способа по неизвестному назначению.



- ✓ Техническое решение является **ПРОМЫШЛЕННО ПРИМЕНИМЫМ**, если оно может быть использовано в отраслях экономики или в социальной сфере
- ✓ Техническое решение является **НОВЫМ**, если оно не известно из уровня техники
- ✓ Техническое решение имеет **ИЗОБРЕТАТЕЛЬСКИЙ УРОВЕНЬ**, если для специалиста оно явным образом не следует из уровня техники



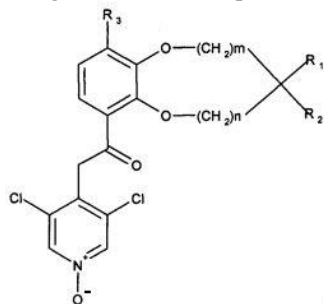
*Для максимальной защиты фармкомпании, разрабатывающие инновационные препараты, патентуют различные аспекты применения лекарственного средства.*

## **Объектом патентования может служить:**

- ❖ **Активное вещество (химическое соединение)** – если вещество ранее не было описано, либо оно было селективно выделено из известной группы соединений и охарактеризовано; энантиомер известного вещества с необычными свойствами;
- ❖ **Различные соли (и другие производные) активного вещества**, имеющие фармакокинетические или другие преимущества;
- ❖ **Различные полиморфные (кристаллические) формы активного вещества** - определенная кристаллическая форма может быть более эффективной для получения лекарственного средства;
- ❖ **Способ получения активного вещества;**
- ❖ **Фармацевтическая композиция на основе активного вещества** (повышение стабильности, растворимости, биодоступности и т.д.);
- ❖ **Новые лекарственные формы на основе активного вещества** (для различных способов введения);
- ❖ **Определенная, наиболее эффективная дозировка фармацевтической композиции;**
- ❖ **Способ лечения заболевания с использованием фармацевтической композиции;**
- ❖ **Применение вещества или фармацевтической композиции по новому назначению.**

**Патентные заявки могут быть поданы последовательно, по мере поступления новых данных при изучении или использовании лекарственного средства**

### Формула изобретения



#### 1. Соединение общей формулы IIb

где каждый из m и n независимо представ.


R1 и R2, вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют гетероциклическое кольцо, содержащее один или два гетероатома, выбранных из кислорода, серы, -S(O)- и -S(O)<sub>2</sub>-;

R3 представляет собой -CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -OCHF<sub>2</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCHF<sub>2</sub> или -SCF<sub>3</sub>; или его фармацевтически приемлемая соль, гидрат или сольват.

**ПАТЕНТ**  
на изобретение  
**RU2583787**

патентообладатель  
**ЛЕО ФАРМА А/С**  
(DK)

Дата выдачи  
патента  
**10.05.2016**

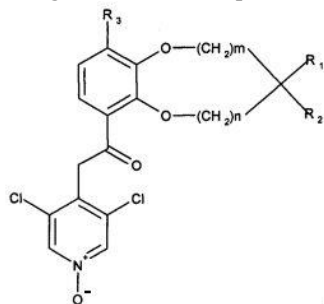


✓ Конечный перечень возможных вариантов радикалов в формуле изобретения (не допускается «замещенный гетероцикл» без указания гетероатомов, их количества и перечня заместителей)

✓ Если установлена известность хотя бы одного из альтернативных вариантов изобретения (например, одного из вариантов описанных в формуле изобретения соединений), это обстоятельство служит **препятствием для признания всего изобретения новым**

✓ Производные – «фармацевтически приемлемая соль, гидрат или сольват» (не допускается «изомер», «эфир» - требуется детальное описание и примеры, «пролекарство» - признак считается неясным без приведения конкретных молекул пролекарств)

### Формула изобретения



IIb,

### 1. Соединение общей формулы IIb

где каждый из m и n независимо представ.

R1 и R2, вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют гетероциклическое кольцо, содержащее один или два гетероатома, выбранных из кислорода, серы, -S(O)- и -S(O)<sub>2</sub>-;

R3 представляет собой -CHF<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -OCHF<sub>2</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -SCHF<sub>2</sub> или -SCF<sub>3</sub>; или его фармацевтически приемлемая соль, гидрат или сольват.

**ПАТЕНТ**

на изобретение  
**RU2583787**

патентообладатель  
**ЛЕО ФАРМА А/С**  
(DK)

Дата выдачи  
патента  
**10.05.2016**

✓ В зависимых пунктах – конкретные соединения, в том числе наиболее перспективное

**10.** Соединение по п. 1, выбранное из группы, состоящей из **2-(3,5-Дихлор-1-оксидо-пиридин-4-ил)-1-{9-дифторметокси-спиро[2Н-1,5-бензодиоксепин-3(4Н),3'-оксетан]-6-ил}этанона, ...**

✓ **Дополнительные объекты изобретения – «фармацевтическая композиция», «применение для лечения», «способ лечения»**

**24. Фармацевтическая композиция**, обладающая PDE4 ингибирующей активностью, содержащая в качестве терапевтически активного ингредиента соединение по п. 1 и фармацевтически приемлемый носитель или связующее.

**26. Способ предотвращения, лечения или ослабления воспалительного заболевания или состояния**, включающий введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения по п. 1.

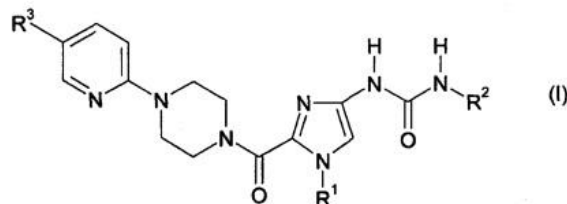
- ❖ Для **всех** слов и выражений в Формуле изобретения нужна поддержка в описании; Формула, не основанная на описании, не подлежит защите;
- ❖ Описание должно подтверждать всю широту притязаний; желательно описывать все возможные дополнительные, факультативные элементы и характеристики изобретения;
- ❖ Должна быть продемонстрирована возможность осуществления изобретения средним специалистом. Количество материалов и объем указаний в описании заявки должны быть обратно пропорциональны количеству знаний, накопленных в уровне техники и предсказуемости уровня техники. Химия и биология обычно требуют повышенного уровня описания;
- ❖ Желательно описать большое количество различных вариантов для ключевых параметров изобретения для поддержки широкой охраны и возможности варьировать объем притязаний в процессе делопроизводства: «Реакция может протекать при температуре в пределах от 40 до 90° С, более предпочтительно, в пределах от 50 до 80° С, например, при температуре около 50, около 55, около 60, около 65, ...».

- ❖ Указание назначения изобретения (промышленная применимость);
  - ❖ Указание решаемой технической задачи и достигаемого технического результата;
  - ❖ Раскрытие совокупности существенных признаков, достаточной для достижения указанного результата;
  - ❖ Обоснование возможности достижения технического результата в случае осуществления изобретения по любому из пунктов формулы;
  - ❖ Раскрытие средств и методов, с помощью которых может быть осуществлено изобретение в том виде, как оно охарактеризовано в формуле;
  - ❖ Детальное описание, по крайней мере, одного способа осуществления изобретения.
-



### Формула изобретения

#### 1. Соль соединения формулы



в которой

R1 обозначает метил, этил, бутил или циклопропилметил,

R2 обозначает фенил, где фенил содержит заместитель, который выбран из группы, включающей трифторметоксигруппу и дифторметоксигруппу, и

R3 обозначает водород, метил, хлор, метоксигруппу или трифторметил

**с органической сульфоновой кислотой** или **ее сольват, или гидрат.**

2. Соль по п. 1, отличающаяся тем, что органической сульфоновой кислотой является метансульфоновая кислота.

3. Соль по п. 2, где соль является димезилатом.

9. **Фармацевтическое средство** для лечения и/или предупреждения вирусных инфекций, ...

11. **Применение** соли по одному из пп. 1-6 для приготовления фармацевтического средства...

**ПАТЕНТ**

на изобретение

**RU2606639**

патентообладатель

**АИКУРИС ГМБХ**

**УНД КО. КГ (DE)**



Дата выдачи

патента

**10.01.2017**

**Объект изобретения - предпочтительная соль для группы соединений.**

Технический результат:

- ✓ значительно лучшая растворимость, чем свободное основание, а также широкий спектр других солей соединений формулы (I),
- ✓ стабильность в течение длительного периода времени при обычных условиях хранения,
- ✓ высокая и постоянная растворимость при условиях, существующих в желудке человека

### Формула изобретения

1. Фармацевтически приемлемая соль (R)-7-[3-амино-4-(2,4,5-трифторфенил)бутаноил]-3-трифторметил-5,6,7,8-тетрагидроимидазо[1,5-а]пиразин-1-карбоновой кислоты, где соль представляет собой **соль присоединения кислоты, образованную органической или неорганической кислотой** и (R)-7-[3-амино-4-(2,4,5-трифторфенил)бутаноил]-3-трифторметил-5,6,7,8-тетрагидроимидазо[1,5-а]пиразин-1-карбоновой кислотой, или **соль присоединения основания, образованную органическим или неорганическим основанием** и (R)-7-[3-амино-4-(2,4,5-трифторфенил)бутаноил]-3-(трифторметил)-5,6,7,8-тетрагидроимидазо[1,5-а]пиразин-1-карбоновой кислотой, где соль присоединения кислоты выбрана из группы, состоящей из **фосфата, малата и тартрата**, соль присоединения основания выбрана из группы, состоящей из соли **натрия, соли лития, соли калия, соли кальция, соли магния, соли тетраметиламмония, соли тетраэтиламмония, соли этаноламина, соли холина и соли аргинина**.

2. Соль по п.1, где соль присоединения кислоты представляет собой **фосфат**.

3. Соль по п.1, где соль присоединения основания представляет собой **соль этаноламина или соль холина**.

5. **Применение** солей по любому из пп.1-4 для получения лекарственного средства для лечения диабета...

11. **Способ получения соли** по любому из пп.1-4, включающий стадии...

13. **Фармацевтическая композиция** для ингибирования активности дипептидилпептидазы,....

...

### ПАТЕНТ

на изобретение  
**RU2523543**

патентообладатель  
**ЦЗЯНСУ ХЭНЖУЙ  
МЕДИЦИН КО.,  
ЛТД. (СН), ШАНХАЙ  
ХЭНЖУЙ  
ФАРМАСЬЮТИКАЛ  
СО., ЛТД. (СН)**

Дата выдачи  
патента  
**20.07.2014**



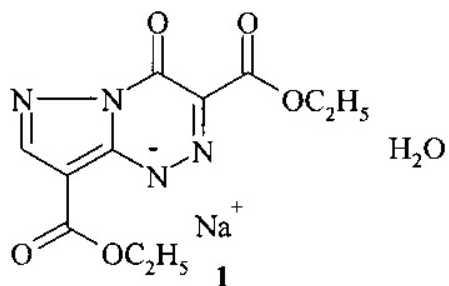
Объект изобретения - предпочтительная соль для группы соединений

Технический результат:

- ✓ улучшенная растворимость,
- ✓ хорошая активность и биодоступность in vivo,
- ✓ более низкая токсичность

### Формула изобретения

1. **Натриевая соль** диэтилового эфира 4-оксо-1,4-дигидропиразоло[5,1-с]-1,2,4-триазин-3,8-дикарбоновой кислоты, **моногидрат, проявляющая антигликирующие свойства**



**ПАТЕНТ**

на изобретение  
**RU2612300**

патентообладатель  
ФГАОУВ «УФУ  
им.Б.Н.Ельцина» (RU)  
ГБОУ ВПО «ВГМУ»  
МЗРФ (RU)

Дата выдачи  
патента  
**06.03.2017**

*Ближайший аналог изобретения*

1) По мнению заявителя (из описания изобретения):

**Противовирусный препарат** Триазавирин - 2-метилтио-6-нитро-1,2,4-триазоло [5,1-с]-1,2,4-триазин-7(4H)-он, тригидрат (№ гос. регистрации ЛП-002604)

2) По мнению экспертизы (из отчета о поиске ФИПС):

Русинов В.Л. И др. "Азоло[5,1-с]-1,2,4-триазины - новый класс **противовирусных соединений**" // Известия Академии наук Серия химическая, N5, 967-995, 2008, схема 2, соедин. 15

**Сужение притязаний одновременно по нескольким параметрам нецелесообразно**

- ❖ Формула изобретения должна содержать точное описание характеристических параметров кристаллической формы вещества, позволяющих отличить новую форму от известной (т.е. быть ясной)
- ❖ Точное описание кристаллической формы в независимых пунктах формулы должно допускать некоторые вариации (допускаются термины «в приблизительных положениях пиков», «по существу, такой как на рис.»)
- ❖ Предпочтительно охарактеризовать защищаемую кристаллическую форму разными методами ее идентификации
- ❖ В описании должны быть раскрыты
  - способ получения заявленной кристаллической формы с указанием условий процесса,
  - методы ее идентификации с указанием условий проведения идентификации
- ❖ Допускается отсылка к рисунку с изображением спектра (например, дифрактограммы) в формуле изобретения

## Пример неясного изложения формулы изобретения

### Формула изобретения в заявке 2007141198

1. Соединение транс-5-Хлор-2,3,3а,12b-тетрагидро-2-метил-1Н-добенз[2,3:6,7]оксепино-[4,5-с]пиррол-(Z)-2-бутендиоат **в орторомбической кристаллической форме.**
2. Соединение по п.1, которое характеризуется рентгеновской порошковой дифрактограммой, полученной с помощью излучения  $\text{CuK}\alpha$  и характеризующейся 2-тета ( $2\theta$ )  $10,5^\circ$  и  $15,7^\circ$ .
3. ...

### Формула изобретения в патенте 2405786

1. Транс-5-Хлор-2,3,3а,12b-тетрагидро-2-метил-1Н-добенз[2,3:6,7]оксепино[4,5-с]пиррол-(Z)-2-бутендиоат **в орторомбической кристаллической форме, который характеризуется рентгеновской порошковой дифрактограммой, полученной с помощью излучения  $\text{CuK}\alpha$  и характеризующейся 2-тета ( $2\theta$ )  $10,5^\circ$  и  $15,7^\circ$ .**
2. Соединение по п.1, которое характеризуется рентгеновской порошковой дифрактограммой, полученной с помощью излучения  $\text{CuK}\alpha$  и °характеризующейся 2-тета ( $2\theta$ )  $10,5^\circ$ ,  $15,7^\circ$ ,  $18,3^\circ$ ,  $19,0^\circ$ ,  $22,2^\circ$ ,  $23,2^\circ$  и  $27,5^\circ$ .
3. Соединение по п.1 или 2, которое характеризуется рентгеновской порошковой дифрактограммой, полученной с помощью излучения  $\text{CuK}\alpha$  и характеризующейся 2-тета ( $2\theta$ )  $10,5^\circ$ ,  $15,7^\circ$ ,  $18,3^\circ$ ,  $19,0^\circ$ ,  $20,3^\circ$ ,  $20,8^\circ$ ,  $22,2^\circ$ ,  $23,2^\circ$ ,  $25,6^\circ$  и  $27,5^\circ$ .
5. Транс-5-Хлор-2,3,3а,12b-тетрагидро-2-метил-1Н-добенз[2,3:6,7]оксепино[4,5-с]пиррол-(Z)-2-бутендиоат **в орторомбической кристаллической форме, который характеризуется рамановским спектром с характеристическими значениями пиков  $2888\text{ см}^{-1}$  и  $824\text{ см}^{-1}$ .**

**ПАТЕНТ**  
на изобретение  
**RU2523543**  
патентообладатель  
**Н.В. ОРГАНОН (NL)**



Дата выдачи  
патента  
**10.12.2010**

## Пример расширения формулы изобретения

Кристаллическая безводная форма II соли молочной кислоты 4-амино-5-фтор-3-[5-(4-метилпиперазин-1-ил)-1H-бензимидазол-2-ил]хинолин-2(1H)-она, охарактеризованная порошковой рентгенограммой, представленной на **фиг.1.**

Кристаллическая безводная форма II соли молочной кислоты 4-амино-5-фтор-3-[5-(4-метилпиперазин-1-ил)-1H-бензимидазол-2-ил]хинолин-2(1H)-она, охарактеризованная порошковой рентгенограммой, **имеющей характеристический максимум при угле  $2\theta$ , составляющем  $18,5^\circ$ .**

### НОВАРТИС АГ:

1. Кристаллическая безводная форма II соли молочной кислоты 4-амино-5-фтор-3-[5-(4-метилпиперазин-1-ил)-1H-бензимидазол-2-ил]хинолин-2(1H)-она, **имеющая чистоту по меньшей мере 90%**, охарактеризованная порошковой рентгенограммой, **имеющей характеристический максимум при угле  $2\theta$ , составляющем  $18,5^\circ$ .**
2. Кристаллическая безводная форма II соли молочной кислоты 4-амино-5-фтор-3-[5-(4-метилпиперазин-1-ил)-1H-бензимидазол-2-ил]хинолин-2(1H)-она, имеющая чистоту по меньшей мере 90%, охарактеризованная порошковой рентгенограммой, представленной на **фиг.1.**
3. ...

**ПАТЕНТ**

на изобретение  
**RU2497820**

патентообладатель  
**НОВАРТИС АГ (СН)  
(RU)**



Дата выдачи  
патента  
**10.11.2013**

- ❖ В формуле изобретения приводятся только входящие в композицию ингредиенты, без указания их количества, если суть именно в качественном составе
- ❖ Количественное содержание ингредиентов предпочтительно приводить не точным числом, а виде интервалов значений
- ❖ Можно указать количество в виде соотношения компонентов, если суть именно в этом соотношении
- ❖ Неправомерно в качестве признаков композиции использовать сведения, непосредственно к композиции не относящиеся (например, условия и режимы использования этой композиции в каком-либо процессе, способе)
- ❖ Не допускается количественный (измеряемый или рассчитываемый) параметр, характеризующий одно или более свойств композиции, в случаях, когда этот параметр используется в качестве единственного признака для характеристики композиции в независимом пункте формулы

Формула изобретения

Фармацевтическая композиция, включающая соединение формулы (I) [...] и фармацевтически приемлемый носитель, при введении которой человеку натошак наблюдаются следующие результаты:

а) в дозе 2,5 мг:

- 1) C<sub>max</sub> от 41,2 до 97,2 нмоль/л, и
- 2) AUC от 273 до 687 нмоль\*ч/л,

или

б) в дозе 5,0 мг:

- 1) C<sub>max</sub> от 124 до 240 нмоль/л, и
- 2) AUC от 1,000 до 1,320 нмоль\*ч/л.

Композиция характеризуется только измеряемыми параметрами, которые не характеризуют композицию как таковую. Нет признаков, которые бы ясно характеризовали состав композиции.



### Формула изобретения в заявке 2011124515

1. Способ улучшения познания, включающий введение пациенту (R)-7-хлор-N-(хинуклидин-3-ил)бензо[в]тиофен-2-карбоксамид или его фармацевтически приемлемой соли в суточной дозе менее 3 мг.
6. **Единичная доза фармацевтической композиции, содержащая от 0,3 до 3,0 мг (R)-7-хлор-N-(хинуклидин-3-ил)бензо[в]тиофен-2-карбоксамид или его фармацевтически приемлемую соль и фармацевтически приемлемый носитель.**

**ПАТЕНТ**  
 на изобретение  
**RU2532327**  
 патентообладатель  
**ФОРУМ**  
**ФАРМАСТЮТИКАЛ**  
**З, ИНК. (US)**



Дата выдачи  
 патента  
**10.11.2014**

### Формула изобретения в патенте 2532327

1. **Применение** (R)-7-хлор-N-(хинуклидин-3-ил)бензо[в]тиофен-2-карбоксамид или фармацевтической композиции, содержащей указанный (R)-7-хлор-N-(хинуклидин-3-ил)бензо[в]тиофен-2-карбоксамид или его фармацевтически приемлемую соль, для улучшения познания пациента, страдающего болезнью Альцгеймера или шизофренией, где (R)-7-хлор-N-(хинуклидин-3-ил)бензо[в]тиофен-2-карбоксамид или его фармацевтически приемлемую соль вводят пациенту **как пероральную ежедневную дозу в количестве от 0,1 мг до 3 мг.**

### Технический результат:

- ✓ соединение имеет неожиданно большой период полужизни в организме человека по сравнению с ожидаемым, основанным на предварительно-клинических исследованиях на животных
- ✓ неожиданно низкая эффективная суточная доза: по крайней мере на порядок ниже ожидаемой
- ✓ как следствие вышеуказанного, - высокая степень безопасности и благоприятный режим дозирования



# ПАТЕНТОВАНИЕ В ОБЛАСТИ БИОМЕДИЦИНСКИХ ТЕХНОЛОГИЙ - ПРАКТИЧЕСКИЕ СОВЕТЫ

**Дмитрий  
Крындушкин**

Ведущий эксперт направления  
Биомед Патентной практики

15.09.2017

**Центр интеллектуальной собственности «Сколково»**

ООО «Центр интеллектуальной собственности «Сколково» является дочерним обществом Фонда «Сколково», оказывает участникам инновационного проекта «Сколково» и третьим лицам весь комплекс профессиональных услуг в области интеллектуальной собственности, включая патентование в России и за рубежом, проведение патентных поисков и построение патентных ландшафтов, регистрацию товарных знаков и программ для ЭВМ, юридическое сопровождение сделок по российскому и иностранному праву.

- ❑ Изобретательский уровень – как соответствовать?
  - ❑ Формула изобретения – как ее расширить?
  - ❑ Комплексная защита интеллектуальной собственности в медицине.
-

## Как доказать наличие «изобретательского уровня»?

В большинстве случаев, необходимо показать с помощью данных наличие **«неожиданного»** технического результата при осуществлении изобретения.

### Условию изобретательского уровня соответствуют, в частности:

- Новые соединения, обладающие полезными свойствами, для которых не известны структурные аналоги, обладающие такими же свойствами;
- Комбинирование известных элементов с получением непредсказуемого результата; наличие синергидного эффекта при комбинации;
- Удаление одного элемента из комбинации с сохранением функциональности (упрощение структуры);
- Выбор варианта, имеющего значительные (неожиданные) преимущества, из большого числа вариантов.

## Методы определения недостатка изобретательского уровня (из рекомендаций для экспертов USPTO и Правил по изобретениям в РФ):

- 1) Комбинирование элементов по известным методам, получая предсказуемый результат; увеличение количеств однотипных элементов;
- 2) Замена одного элемента на другой с предсказуемым результатом;
- 3) Использование известного метода, чтобы улучшить похожие устройства (продукты) похожим образом;
- 4) Использование известного метода для известного устройства, получая предсказуемый результат;
- 5) “Obvious to try” – выбор из ограниченного числа известных вариантов; выбор оптимальных или рабочих значений известных параметров;
- 6) Известное тех. решение из одной области используется в другой, получая предсказуемый результат;
- 7) teaching, suggestion, or motivation (TSM test) – в двух и более источниках содержалась мотивация/подсказка/направление к объединению решений в одном изобретении.

*Патентование новых лекарственных форм известного активного вещества часто является проблемой, когда все элементы (активные и неактивные ингредиенты) известны из уровня техники.*

**Подобные патенты приводят к эффективной защите рыночной эксклюзивности ЛС после истечения срока патентной защиты активного ингредиента**

Заявка на активное вещество



Заявка на готовую ЛФ

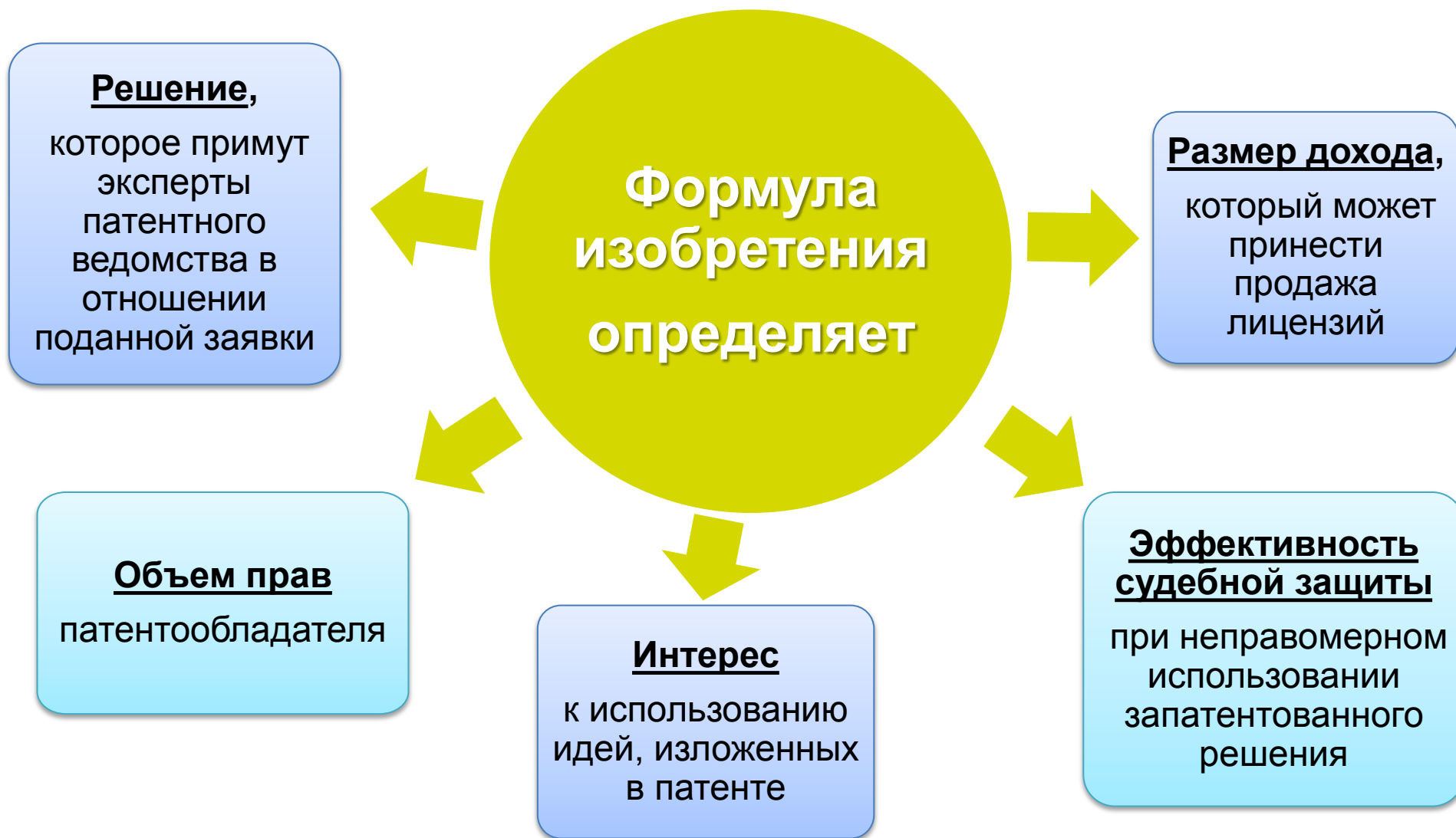
- ❖ Показать, что заявленная ЛФ (новый состав) имеет неожиданные преимущества (например, улучшенная эффективность, стабильность, безопасность, ФК и т. д.);
- ❖ Представить доказательства, показывающие, что предмет изобретения во второй (поздней) заявке не мог быть предсказан на основе первой заявки;
- ❖ Приведение в заявке клинических данных предоставляет хорошие возможности для патентования улучшений, поскольку клинический эффект трудно предсказать.

**При разработке готовых ЛФ для биофармацевтических препаратов возникает гораздо больше проблем, чем при разработке готовых ЛФ для малых молекул.**

- Собственные свойства белка, такие как сложная структура, гетерогенность молекул, склонность к самоагрегации;
- Стабильность молекул, возможные модификации, окисление;
- Растворимость и вязкость для высококонцентрированных составов.

**Трудности, присущие разработке сложных биологических молекул, создают улучшенные возможности для патентования**

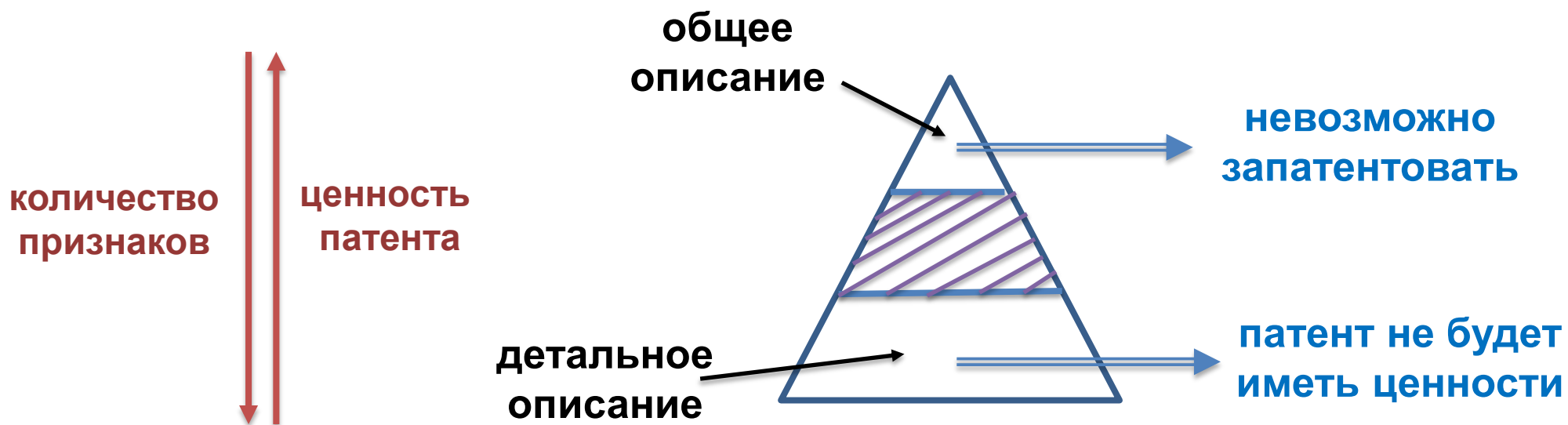
- ❖ Легче показать, что разработка готовой ЛФ не была рутинной, или простой оптимизацией;
- ❖ Сложнее разрабатывать => труднее для разработчиков аналогов скопировать с модификациями для обхождения патента.





**Необходим оптимальный уровень детализации**

## описание объекта изобретения



В зависимости от результатов исследования патентоспособности тех. решения можно сформулировать более **широкую** или **узкую** Формулу изобретения

узкая – один вариант воплощения



широкая – покрывает множество возможных вариантов воплощения



## Широкий вариант Формулы изобретения:

- Границы притязаний должны быть четко определены;
- Описание должно соответствовать широте притязаний – необходимо показать достижимость технического результата для всех вариантов изобретения, покрываемых Формулой.

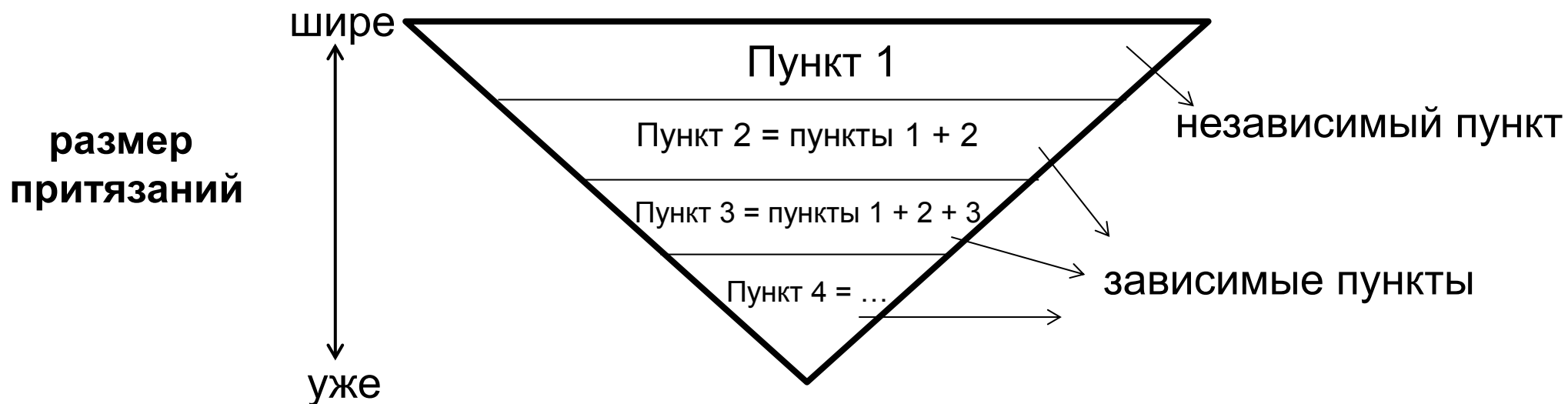
## Широкая Формула изобретения

- большой объем прав
- меньший шанс получить патент и защитить его в суде

## Узкая Формула изобретения

- меньший объем прав
- больший шанс получить патент и защитить его в суде

**Оптимальная Формула изобретения должна содержать как широкие, так и более узкие пункты, регулируя размер притязаний**



Антитело, специфически связывающее белок Б, содержащее аминокислотную последовательность SEQ ID NO:1.

Антитело, или его функциональный фрагмент, специфически связывающее белок Б, включающее **тяжёлую цепь**, содержащую последовательность, **гомологичную** по меньшей мере на 90% последовательности SEQ ID NO:2, и **лёгкую цепь**, содержащую последовательность, **гомологичную** по меньшей мере на 90% последовательности SEQ ID NO:3.

Антитело или его функциональный фрагмент, специфически связывающее белок Б, которое содержит в вариабельной области тяжёлой цепи CDR1, последовательность которого представлена в SEQ ID NO: 4; CDR2, последовательность которого представлена в SEQ ID NO: 5; CDR3, последовательность которого представлена в SEQ ID NO: 6; в вариабельной области лёгкой цепи CDR1, последовательность которого представлена в SEQ ID NO: 7; CDR2, последовательность которого представлена в SEQ ID NO: 8; и CDR3, последовательность которого представлена в SEQ ID NO: 9.

## Патент US 8889137 B2

## Анти-HSV-антитело

1. Антитело или его фрагмент, содержащее гипервариабельные участки CDR1, содержащий SEQ ID NO: 1 CDR2, содержащий SEQ ID NO: 2, CDR3, содержащий SEQ ID NO: 3, CDR1, содержащий SEQ ID NO: 4, CDR2, содержащий SEQ ID NO: 5 , и CDR3, содержащий SEQ ID NO: 6.
2. Антитело, которое распознает тот же **эпитоп**, что и антитело по п.1, где указанный **эпитоп расположен** в аминокислотах 172-195 и 295-313 гликопротеина В HSV1 и HSV2.
3. Антитело по п.2, в котором антитело способно ингибировать распространение HSV из инфицированной клетки в соседнюю вторую неинфицированную клетку (распространение от клетки к клетке).
4. Антитело по п.2, в котором антитело имеет константу диссоциации KD не более 40 нМ.
5. Антитело по п.2, в котором антитело содержит аминокислотную последовательность с по меньшей мере 80% идентичностью последовательностей аминокислотным остаткам, показанным в позициях 1-30, 38-51, 68-99 и 112-122 SEQ ID NO: 7 и в позициях 1-23, 41-55, 63-94 и 104-114 SEQ ID NO: 8.

В описании заявки должна содержаться структура эпитопа, способ получения антител к нему, и их назначение.

## **Возможно ли получение такой широкой защиты в других Патентных ведомствах ?**

*Согласно Правилам составления заявок в РФ, химическое соединение может характеризоваться структурой (амин. посл.), или через физико-химические и иные характеристики, позволяющие отличить данное соединение от других.*

### Рекомендации:

- ✓ В данном случае, для получения патента на изобретение РФ, необходимо будет добавить существенные признаки, характеризующие такие антитела, и позволяющие отличить от других антител.
- ✓ Для патентования группы антител с заданными свойствами, необходимо будет охарактеризовать в описании несколько таких антител с разной структурой.

## **US7935791** *Антагонистические антитела против Notch3 и их использование в профилактике и лечении заболеваний, связанных с Notch3*

1. Моноклональное антитело, которое специфически связывается с Notch3, где антитело специфически связывается с конформационным **эпитопом** фрагмента Notch3, состоящим из аминокислот 1378-1640 SEQ ID NO: 1 и где антитело ингибирует передачу сигнала Notch3.

## **RU2493167** *Антитела-антагонисты против Notch3 и их применение для профилактики и лечения связанных с Notch3.*

1. Моноклональное антитело, которое специфически связывается с Notch3, причем антитело специфически связывается с конформационным **эпитопом** фрагмента Notch3, состоящего из аминокислот 1378-1640 SEQ ID NO:1, и антитело ингибирует передачу сигнала Notch3, где **антитело содержит переменную область** тяжелой цепи (VH), содержащую первую область, определяющую комплементарность (CDR) CDR-H1 с последовательностью SEQ ID NO:32, CDR-H2 с последовательностью SEQ ID NO:33 и CDR-H3 с последовательностью SEQ ID NO:34, и переменную область легкой цепи (VL), содержащую CDR-L1 с последовательностью SEQ ID NO:35, CDR-L2 с последовательностью SEQ ID NO:36 и CDR-L3 с последовательностью SEQ ID NO:37..., при этом антитело может дополнительно содержать метку.

## **US7070775** *Рекомбинантные A2-специфические TNFальфа-специфические антитела*

1. Изолированное рекомбинантное антитело против TNF-альфа или его антигенсвязывающий фрагмент, причем указанное антитело содержит константную область антител человека, где указанное антитело или антигенсвязывающий фрагмент (i) конкурентно ингибирует связывание A2 (ATCC № PTA-7045) к TNF-альфа человека и (ii) связывается с нейтрализующим эпитопом TNF-альфа человека *in vivo* с аффинностью по меньшей мере  $1 \times 10^8$  л / моль, измеренной как константа ассоциации ( $K_a$ ), как определено анализом Скэтчарда.

## **US6914128** *Человеческие антитела, которые связывают человеческий il-12 и способы продуцирования*

1. Изолированное антитело человека или его антигенсвязывающая часть, которая связывается с IL-12 человека и диссоциирует от IL-12 человека с  $K_d = 1 * 10^{-10}$  М или менее и константой скорости  $k_{off} 1 * 10^{-3} \text{ с}^{-1}$  или менее, как определено поверхностным плазмонным резонансом.

*Патент US6914128 был признан недействительным в суде в связи с недостаточностью раскрытия – недостаточно примеров для широкого притязания*



1. Моноклональное антитело, которое специфически связывается с белком X, способное ингибировать рост клеток нейробластомы с IC50 ниже  $10^{-9}$  M.

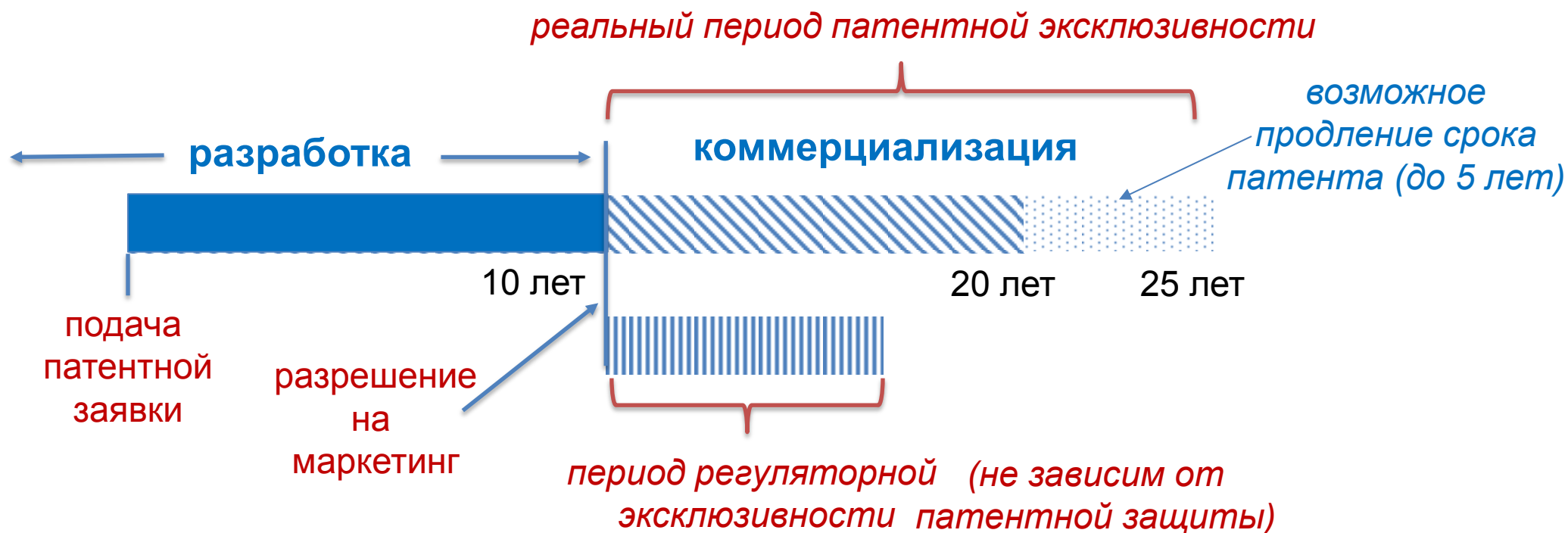
*необходимо будет показать с помощью данных, что описанная функциональная активность не ограничена определенной аминокислотной последовательностью, а характерна для широкого спектра последовательностей*

Альтернативно, можно сформулировать через способ:

1. Способ лечения нейробластомы, включающий введение больному, нуждающемуся в этом, антитела, специфически связывающегося с белком X, в количестве, достаточном для лечения нейробластомы.

*необходимо будет показать с помощью данных, что описанная функциональная активность характерна для каждого антитела с описанными свойствами.*

- ✓ Патентная защита (20-25 лет с момента подачи заявки)
- ✓ Регуляторная защита (после вывода препарата на рынок)
- ✓ Защита как ноу-хау (элементы технологий производства)



На разработку одного нового лекарства крупные фарм-компании тратят более \$ 1 млрд

## Центр интеллектуальной собственности «Сколково»

E-mail: [IPCenter@sk.ru](mailto:IPCenter@sk.ru)

Web: <http://ip.sk.ru>

Тел: +7 495 956 00 33 доб. 2405

# СПАСИБО ЗА ВНИМАНИЕ!