



СТРАТЕГИИ ПАТЕНТНОЙ ЗАЩИТЫ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ

**Мария
Пустовалова**

Старший эксперт,
Руководитель направления Биомед
Патентной практики

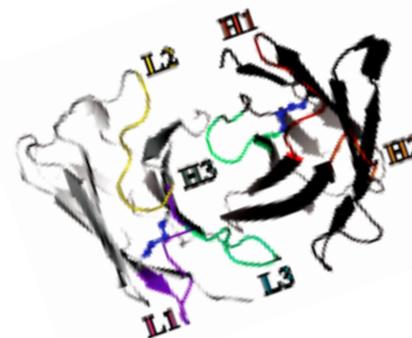
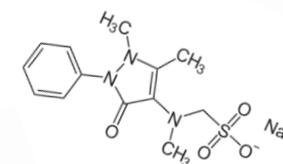
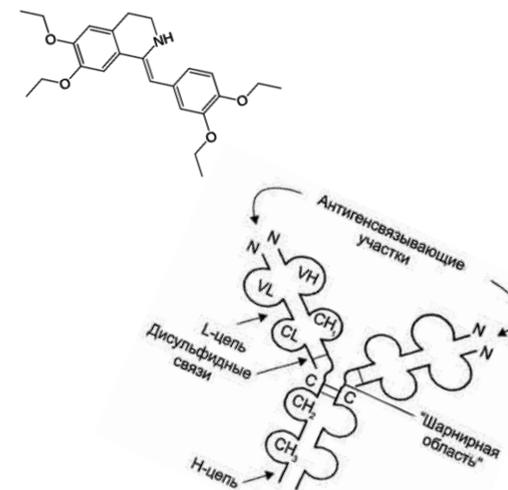
15.09.2017

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



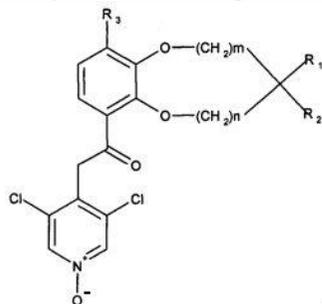
Для максимальной защиты фармкомпании, разрабатывающие инновационные препараты, патентуют различные аспекты применения лекарственного средства.

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)₂-;

R3 представляет собой -CHF₂, -CF₃, -OCHF₂, -OCF₃, -SCHF₂ или -SCF₃; или его фармацевтически приемлемая соль, гидрат или сольват.

ПАТЕНТ
на изобретение
RU2583787

патентообладатель
ЛЕО ФАРМА А/С
(DK)

Дата выдачи
патента
10.05.2016

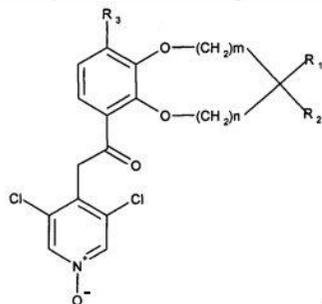


✓ Конечный перечень возможных вариантов радикалов в формуле изобретения (не допускается «замещенный гетероцикл» без указания гетероатомов, их количества и перечня заместителей)

✓ 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



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)₂-;

R3 представляет собой -CHF₂, -CF₃, -OCHF₂, -OCF₃, -SCHF₂ или -SCF₃; 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[2H-1,5-бензодioxепин-3(4H)],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.

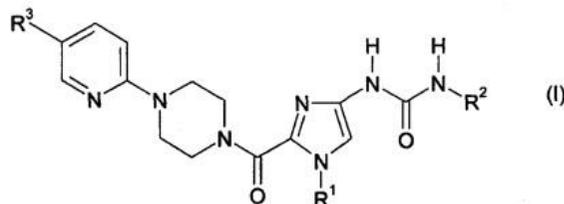
26. **Способ предотвращения, лечения или ослабления воспалительного заболевания или состояния**, включающий введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества соединения по п. 1.

- ❖ 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



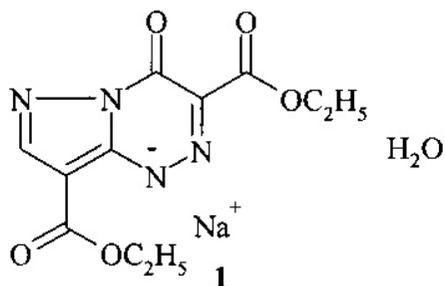
Объект изобретения - предпочтительная соль для группы соединений

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 (2θ) $10,5^\circ$ 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 (2θ) $10,5^\circ$ 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 (2θ) $10,5^\circ$, $15,7^\circ$, $18,3^\circ$, $19,0^\circ$, $22,2^\circ$, $23,2^\circ$ 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 (2θ) $10,5^\circ$, $15,7^\circ$, $18,3^\circ$, $19,0^\circ$, $20,3^\circ$, $20,8^\circ$, $22,2^\circ$, $23,2^\circ$, $25,6^\circ$ 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 см^{-1} и 824 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 2θ , 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 2θ , 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_{max} 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_{max} 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 одностипных 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

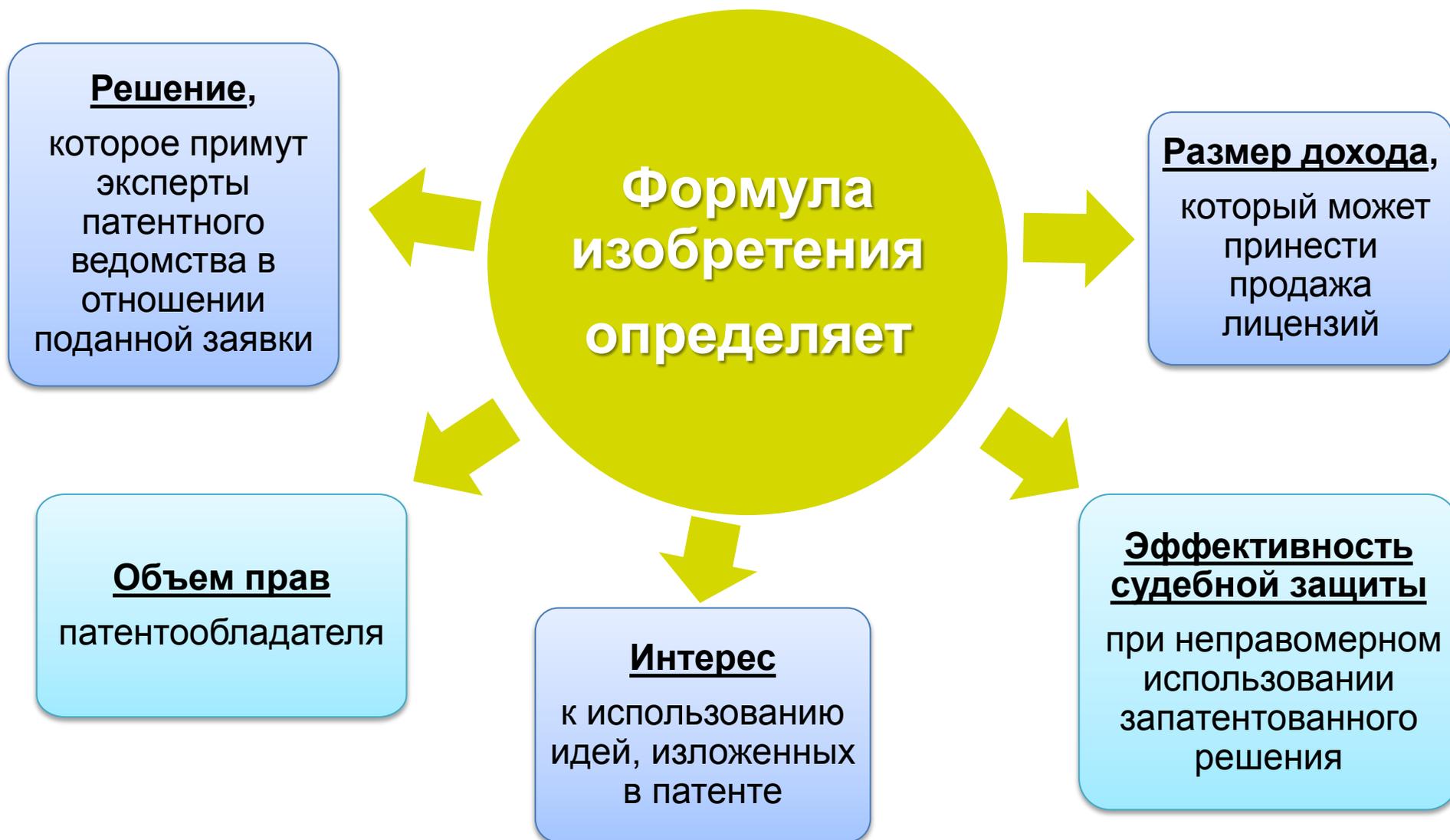
- ❖ Показать, что заявленная ЛФ (новый состав) имеет неожиданные преимущества (например, улучшенная эффективность, стабильность, безопасность, ФК и т. д.);
- ❖ Представить доказательства, показывающие, что предмет изобретения во второй (поздней) заявке не мог быть предсказан на основе первой заявки;
- ❖ 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.

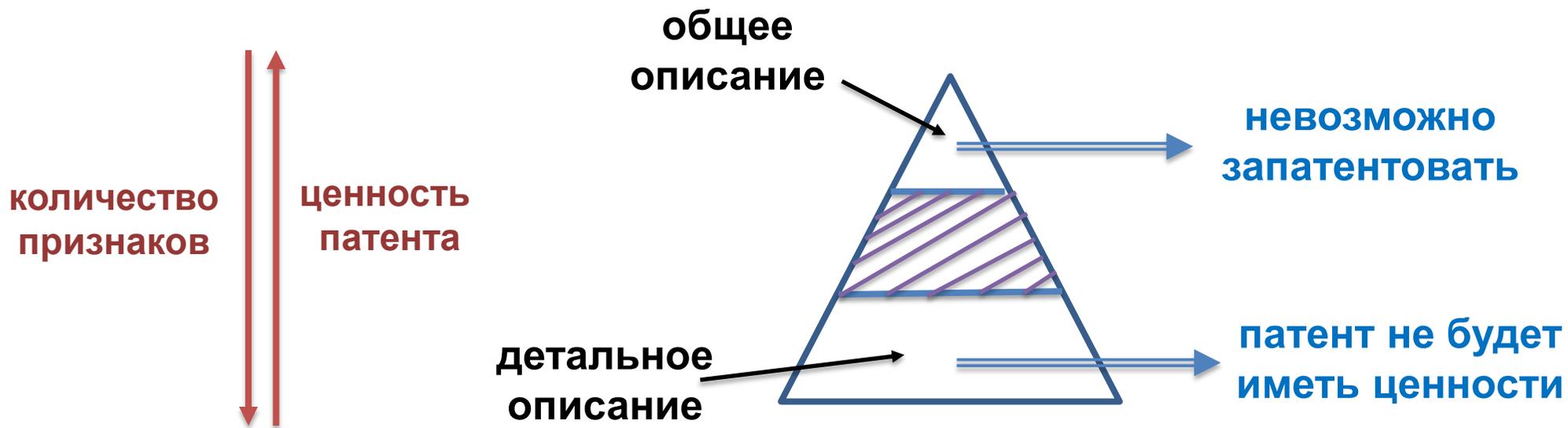
Трудности, присущие разработке сложных биологических молекул, создают улучшенные возможности для патентования

- ❖ 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.

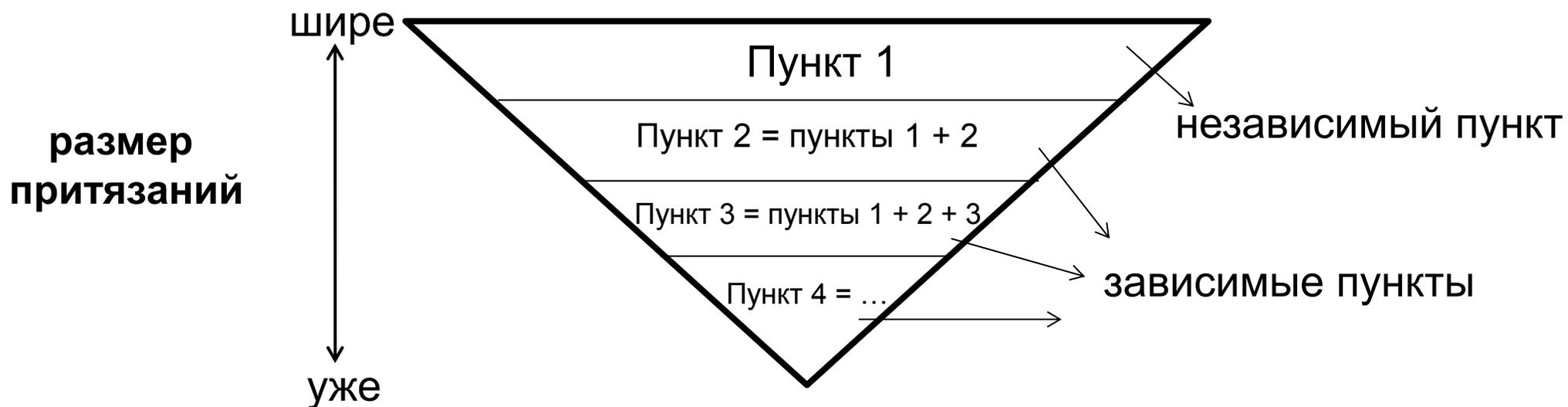
Широкая Формула изобретения

- 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 1×10^8 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.

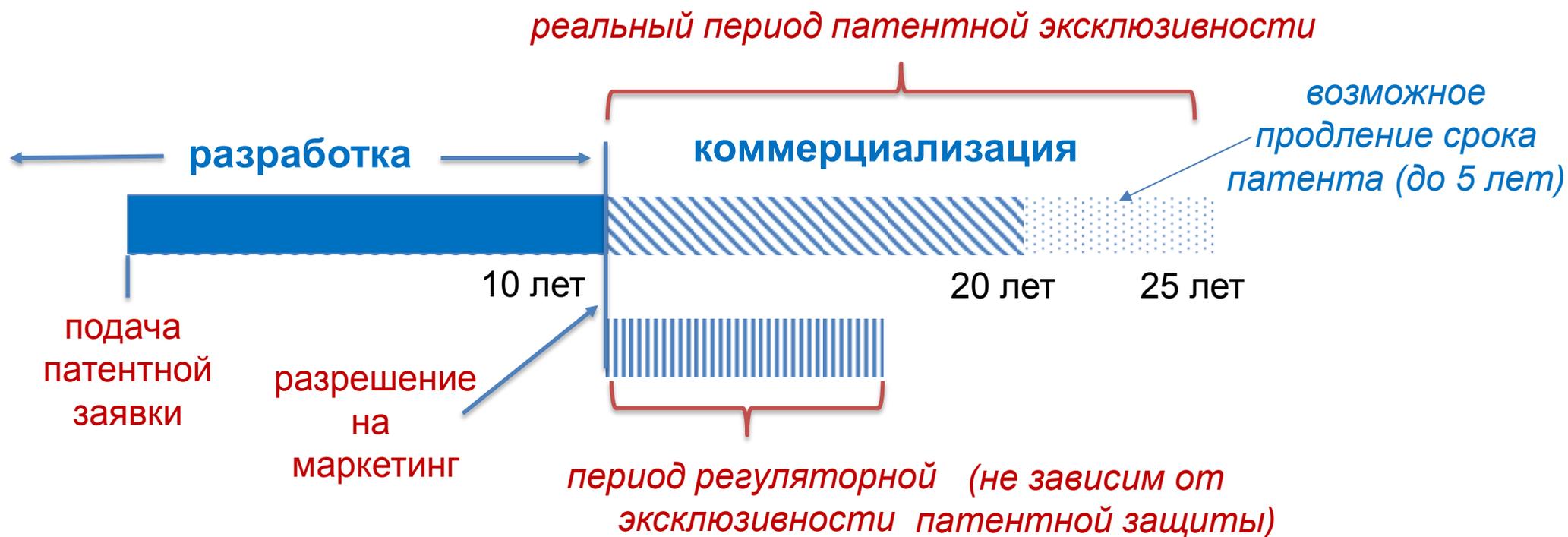
необходимо будет показать с помощью данных, что описанная функциональная активность не ограничена определенной аминокислотной последовательностью, а характерна для широкого спектра последовательностей

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

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

Тел: +7 495 956 00 33 доб. 2405

СПАСИБО ЗА ВНИМАНИЕ!