

В:

**Евразийское патентное ведомство**

Россия, 109012, г. Москва, М. Черкасский пер., д. 2.

[info@eapo.org](mailto:info@eapo.org)

Заявитель: Республиканское общественное объединение «Люди ПЛЮС»

Адрес: ул. Интернациональная 1/70, г. Светлогорск, Беларусь, 247434

Тел.: +375264267954

E-mail: hivby2016@gmail

**Евразийская заявка № 202391454**

## **ЗАМЕЧАНИЯ ТРЕТЬИХ ЛИЦ**

**в отношении патентоспособности изобретения**

**по евразийской заявке № 202391454**

**«ТЕРАПЕВТИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ ИНФЕКЦИИ ВИЧ»**

### **1. ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ ПО ЗАЯВКЕ**

Согласно открытым данным реестра евразийских заявок на изобретения по состоянию на 05.06.2025 г., компанией ЯНССЕН САЙЕНСИЗ АЙРЛЭНД АНЛИМИТЕД КОМПАНИ (IE) подана евразийская заявка №202391454 «ЛЕЧЕНИЕ ИЛИ ПРОФИЛАКТИКА ВИЧ-ИНФЕКЦИИ» (далее- **ЕА 202391454**).

Заявка 202391454 подана 17.11.2021, опубликована 25.07.2023 г. В настоящее время по заявке проводится экспертиза по существу, заявка не считается отозванной, и по ней не принято решение о готовности выдать патент.

В качестве приоритета указана дата: 17.11.2020 по приоритетной заявке US 63/114,997. На основании приоритетной заявки была подана международная заявка PCT/US2021/072453 с датой подачи 17.11.2021, с международной публикацией WO 2022/109555, дата публикации 27.05.2022.

Заявка 202391454 подана с формулой изобретения, которая включает 66 пункта, из них независимые пункты:

- п. 1 -33 – относится к способу лечения ВИЧ – инфекции, при этом вводят рилпивирин в виде микро- или наночастиц в суспензии посредством внутримышечной или подкожной инъекции, и рилпивирин вводят в комбинации с гиалуронидазой, в виде внутримышечной или подкожной инъекции, введение проводят с перерывами во времени от 3 мес. до 2 лет.
- п. 34 – рилпивирин в комбинации с гиалуронидазой, в виде микро- или наночастиц, вводят в виде внутримышечной или подкожной инъекции.
- п. 35 – препараты, содержащие рилпивирин в комбинации с гиалуронидазой, в виде микро- или наночастиц, вводят в виде внутримышечной или подкожной инъекции.
- п. 36 – набор компонентов, содержащий рилпивирин в комбинации с гиалуронидазой, в виде микро- или наночастиц, вводят в виде внутримышечной или подкожной инъекции.
- п. 37 – рилпивирин в комбинации с гиалуронидазой, в виде микро- или наночастиц, вводят в виде внутримышечной или подкожной инъекции.
- п. 38 – применение рилпивирин в комбинации с гиалуронидазой, в виде микро- или наночастиц, вводят в виде внутримышечной или подкожной инъекции.
- п. 39 – комбинация рилпивирин с гиалуронидазой, в виде микро- или наночастиц, причем рилпивирин в виде суспензии.
- п. 40 – набор компонентов, содержащий рилпивирин в комбинации с гиалуронидазой, в виде микро- или наночастиц, причем рилпивирин в виде суспензии.
- пп. 41 - 51 – рилпивирин в форме микро- или наночастиц в суспензии, причем частицы имеют  $Dv90$  от около 1 мкм до около 10 мкм.
- пп. 52 – 54 – фармацевтическая композиция, содержащая рилпивирин, в виде микро- или наночастиц в суспензии.
- п. 55 – рилпивирин в форме микро- или наночастиц в суспензии, причем частицы имеют  $Dv90$  от около 1 мкм до около 10 мкм для лечения ВИЧ-инфекции.
- п. 56 – способ лечения или профилактики ВИЧ-инфекции, при этом вводят рилпивирин в форме микро- или наночастиц в суспензии, причем частицы имеют  $Dv90$  от около 1 мкм до около 10 мкм.

- п. 57 – применение в форме микро- или наночастиц в суспензии, причем частицы имеют  $Dv90$  от около 1 мкм до около 10 мкм, для получения лекарственного средства для лечения ВИЧ-инфекции.

- п. 58 - 66– Рилпивириин для применения для лечения ВИЧ-инфекции, при введении с перерывом от 3 месяцев до 2 лет.

(полностью формула изобретения приведена в заявке, с. 104 -112).

Далее будут рассмотрены только независимые пункты формулы изобретения, по объектам.

Лицо, подающее замечания в отношении изобретения по евразийской заявке №202391454 (далее- ЕА 202391454), полагает, что по данной заявке не может быть выдан патент по следующим основаниям:

- 1) Изобретение по независимым пунктам 1, 34-41, 52, 55, 56, 57, 58 не соответствует условиям патентоспособности «новизны» и «изобретательский уровень»;
- 2) Евразийская заявка не раскрывает изобретение достаточно ясно и полно, чтобы изобретение могло быть осуществлено специалистом;
- 3) Формула изобретения не определяет объект изобретения и не выражает сущность изобретения, а также не является ясной, точной и не основана на описании. Более подробно указанные основания будут рассмотрены ниже.

## **2. ПРАВОВЫЕ ОСНОВАНИЯ**

### **2.1. Условия патентоспособности изобретения**

Согласно Правилу 3 Патентной инструкции (далее – Инструкция):

*(1) В соответствии со статьей 6 Конвенции евразийский патент выдается на изобретение, которое является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.*

*Изобретение признается новым, если оно не является частью предшествующего уровня техники. Объекты, являющиеся частью предшествующего уровня техники, для определения новизны изобретения могут учитываться лишь отдельно.*

*Предшествующий уровень техники включает все сведения, ставшие общедоступными в мире до даты подачи евразийской заявки, а если испрашен приоритет, - до даты ее приоритета.*

*Для целей проверки новизны изобретения предшествующий уровень техники включает также содержание любой заявки на выдачу евразийского патента в той редакции, в которой она была подана на дату ее подачи, при условии, что эта заявка или выданный по ней евразийский патент впоследствии будут опубликованы в установленном порядке и что дата подачи такой заявки или, если испрашен приоритет, дата ее приоритета предшествует соответствующей дате, указанной в абзаце третьем настоящего пункта.*

*Содержание международной заявки включается в предшествующий уровень техники с даты ее подачи или с даты приоритета, если он испрашен, в случае выполнения требований правила 71(1) Инструкции.*

*Изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста очевидным образом не следует из предшествующего уровня техники.*

*Изобретение является промышленно применимым, если оно может быть использовано в промышленности, сельском хозяйстве, здравоохранении и других областях человеческой деятельности.*

*(2) Не признается обстоятельством, препятствующим признанию патентоспособности изобретения, такое раскрытие информации, относящейся к изобретению, изобретателем, заявителем или любым лицом, получившим от них прямо или косвенно эту информацию, при котором сведения о сущности изобретения стали общедоступными не ранее чем за шесть месяцев до даты подачи евразийской заявки или до даты приоритета, если он испрашен. При этом обязанность доказывания обстоятельств раскрытия информации лежит на заявителе.*

*Согласно Правилу 21<sup>1</sup>(3) Инструкции:*

*(3) Евразийская заявка должна раскрывать изобретение достаточно ясно и полно, чтобы изобретение могло быть осуществлено специалистом.*

*Согласно Правилу 21<sup>1</sup>(4) Инструкции:*

*(4) Формула изобретения должна определять объект изобретения и выражать сущность изобретения. Формула должна быть ясной, точной и основываться на описании.*

*Согласно порядку подачи и рассмотрения замечаний третьих лиц в отношении патентоспособности изобретения (далее- Порядок), п. 5, замечания могут быть*

поданы любым лицом после публикации евразийской заявки и до вынесения решения, принимаемого по результатам экспертизы евразийской заявки по существу.

## **2.2. Нормативные акты, действовавшие на дату подачи международной заявки**

На дату международной подачи заявки 202391454 от 02.12.2022, действовали следующие нормативные правовые акты, необходимые для проверки изобретения в отношении условия патентоспособности «новизна», «изобретательский уровень» и «промышленная применимость»:

- Евразийская Патентная Конвенция (**Патентная Конвенция**),
- Патентная Инструкция к Евразийской Патентной Конвенции (**Инструкция**), утвержденную Административным советом Евразийской патентной организации на втором (первом очередном) заседании 1 декабря 1995 г. с изменениями и дополнениями, в редакции от 2020 г.;
- Правила составления, подачи и рассмотрения евразийских заявок в Евразийском патентном ведомстве, в редакции от 2019 г. (**Правила**).

## **3. НЕСООТВЕТСТВИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ ПО ЗАЯВКЕ 202391454 УСЛОВИЯМ ПАТЕНТОСПОСОБНОСТИ**

### **3.1. Несоответствие условию патентоспособности «новизны» и «изобретательский уровень»**

Согласно п. 5.7. Правил, *«В соответствии с правилом 3(1) Инструкции изобретение признается новым, если оно не является частью предшествующего уровня техники. Проверка новизны осуществляется в отношении всей совокупности признаков, характеризующих изобретение, т.е. содержащихся в формуле изобретения.*

*Изобретение не признается новым, если в предшествующем уровне техники выявлены сведения об объекте, который имеет признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в независимом пункте формулы изобретения.*

*Новизна изобретения, касающегося вещества, изделия, биотехнологического продукта, считается опорооченной, если из предшествующего уровня техники известен объект, имеющий признаки, идентичные всем признакам заявленного*

*вещества, изделия, биотехнологического продукта, и если из предшествующего уровня техники:*

*известен способ получения такого вещества, изделия, биотехнологического продукта или,*

*для специалиста очевидна возможность осуществления (изготовления) такого изобретения (получения такого вещества, изделия, биотехнологического продукта) или,*

*известны сведения о фактическом получении и/или использовании такого вещества, изделия, биотехнологического продукта или,*

*известно о возможности открытого доступа (доступа для неопределенного круга лиц) к такому веществу, изделию, биотехнологическому продукту (например, в целях получения и/или ознакомления) или,*

*известны сведения о депонировании биотехнологического продукта;*

*известно содержание ранее поданной или обладающей более ранним приоритетом евразийской заявки, если эта заявка или выданный по ней евразийский патент будут опубликованы в установленном порядке.*

*Новизна изобретения, касающегося штамма, считается опороченной, если из предшествующего уровня техники наряду с изложенными выше сведениями известны сведения о его депонировании, осуществленном другим лицом до даты подачи заявки на это изобретение, а если испрашен приоритет - до даты приоритета изобретения.*

*Новизна изобретения, касающегося применения устройства, способа, вещества, биотехнологического продукта, считается опороченной, если обнаружен источник информации, из которого известно применение того же устройства, способа, вещества, биотехнологического продукта по указанному в заявке назначению.*

*Если установлено, что предложение, описанное в независимом пункте формулы изобретения, является новым, анализ уровня техники в отношении зависимых пунктов не проводится.*

*Если входящий в состав группы изобретений продукт признаётся соответствующим требованию новизны, то такие изобретения группы, как способ получения продукта, способ, предусматривающий использование продукта или его*

применение, без дополнительной проверки считаются удовлетворяющими этому требованию.

Форма представления информации, порочащей новизну изобретения, значения не имеет. Эта информация может быть представлена в различных источниках (например, детали одного и того же станка могут быть описаны в различных книгах (атласах, проспектах); главное, чтобы эти источники содержали информацию об одном и том же объекте до даты подачи заявки, а если испрашен приоритет - до даты приоритета изобретения.»

Согласно п. 5.8. Правил, «В соответствии с правилом 3(1) Инструкции изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста очевидным образом не следует из предшествующего уровня техники.

Под "специалистом" для этих целей понимается лицо, квалификация которого, соответствующая среднему уровню в данной области техники, позволила бы ему осуществить заявленное изобретение.

В случае рассмотрения заявок, касающихся нескольких технических областей, под "специалистом" понимается группа лиц, которая в совокупности обладает указанными качествами.

Изобретение признается не следующим для специалиста явным образом из уровня техники, в частности, в том случае, когда не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не установлена известность влияния отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Проверка соблюдения указанных условий включает:

- выявление наиболее близкого аналога (прототипа);
- выявление признаков, которыми заявленное изобретение отличается 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.

*В результате анализа независимого пункта формулы изобретения может быть установлено, что:*

*все содержащиеся в нем признаки изобретения имеют отношение к достижению заявленного технического результата. В этом случае установление соответствия изобретения по этому пункту условию патентоспособности "новизна", как правило, одновременно означает соответствие этого изобретения условию патентоспособности "изобретательский уровень".*

*часть содержащихся в нем признаков имеет отношение к заявленному техническому результату, другая же часть признаков либо имеет отношение к получению иного технического результата, либо технический результат, связанный с этими признаками, не установлен.*

*Если технический результат достигается за счет совокупности части признаков, не связанных функционально с остальными признаками, устанавливается известность этой совокупности признаков и достигаемого технического результата.*

*Если известность указанной совокупности части признаков и/или ее связи с достигаемым техническим результатом не установлены, то делается вывод о том, что изобретение имеет изобретательский уровень.*

*Если известность такого решения установлена, то дополнительно определяется насколько очевидной для специалиста является возможность использования этого известного решения при решении частной задачи, сформулированной в заявке.*

*Для этого может быть использована информация, косвенным образом характеризующая очевидность или неочевидность такого использования, в том числе:*

*удовлетворение длительно существующей потребности;*

*сложность решаемой задачи;*

*внесение существенных улучшений в технический прогресс;*

*преодоление недоверия и скепсиса специалистов;*

*продолжительность исследований, приведших к положительному результату;*

*простота заявленного изобретения, решающего давно существующую проблему,*

*свидетельствующая об оригинальности изобретения;*

*существенная экономическая значимость изобретения;*

использование экспертизой множества ссылок, относящимся к различным временным периодам и/или к различным областям техники;

пионерный характер изобретения.

Наличие позитивных данных хотя бы по одному из указанных условий, может служить основанием для вывода о соответствии изобретения изобретательскому уровню.

Не требуют указанного дополнительного анализа и, как правило, не признаются соответствующими изобретательскому уровню изобретения, основанные на:

дополнении известного средства какой-либо известной частью, присоединяемой к нему по известным правилам, для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно таких дополнений;

замене какой-либо части известного средства другой известной частью для достижения технического результата, в отношении которого установлено влияние именно такой замены;

исключении какой-либо части (элемента, операции) с одновременным исключением обусловленной ее наличием функции и достижением при этом обычного для такого исключения результата (упрощение, уменьшение массы, габаритов);

выполнении известного средства или его части из известного материала для достижения технического результата, обусловленного известными свойствами этого материала;

создании средства, состоящего из известных частей, выбор и связь между которыми осуществлены на основе известных правил и рекомендаций, а достигаемый при этом технический результат обусловлен только известными свойствами указанных частей и связей между ними;

применении известного устройства, способа, вещества, биотехнологического продукта по определенному назначению, если возможность реализации этого назначения обусловлена их известными свойствами (структурой, выполнением) и известно, что именно эти свойства необходимы для реализации этого назначения.

Не могут быть признаны соответствующими изобретательскому уровню также изобретения, основанные на изменении количественного признака (признаков), если известен факт влияния каждого из них на технический результат и новые значения этих признаков получены, исходя из известных закономерностей.

*Известность влияния отличительных признаков заявленного изобретения на технический результат может быть подтверждена как одним, так и несколькими источниками информации. Допускается привлечение аргументов, основанных на общеизвестных в данной области техники знаниях, без указания источников информации. Однако если заявитель в дальнейшем будет настаивать на указании таких источников, его требование подлежит выполнению.*

*Признаки, отличающие изобретение от ближайшего аналога (прототипа), не связанные с ожидаемым техническим результатом, указанным в описании, анализируются в связи с тем техническим результатом, получение которого при использовании изобретения предопределяется ими исходя из их функционального назначения.*

Таким образом, изобретение не соответствует условиям новизны и/или изобретательского уровня, если известны документы, раскрывающие объект, который имеет признаки, идентичные всем признакам, содержащимся в независимом пункте формулы изобретения, или изобретение очевидным образом для специалиста следует из доступных документов. При этом, следует выделить существенные признаки, Форма представления информации не имеет значения, однако, дата ее публикации должна быть ранее даты приоритета изобретения, а если установлено несколько приоритетов, то до даты самого раннего приоритета (17.11.2020).

### **3.2. Независимые пункты 1, 34-41, 52, 55, 56, 57, 58 не соответствуют условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень»**

Изобретение по пп. 1, 34-41, 52, 55, 56, 57, 58 относится по существу к применению рилпивирин в комбинации с гиалуронидазой, имеет форму внутримышечной или подкожной инъекции, рилпивирин в виде суспензии, рилпивирин также в форме микро- или наночастиц в суспензии, причем частицы имеют  $Dv90$  от около 1 мкм до около 10 мкм, для лечения и профилактики ВИЧ-инфекции, при этом введение может осуществляться периодически, с перерывом от 3 месяцев до 2 лет.

Технический результат согласно заявке не сформулирован в определенном виде, но на с. 3 присутствует следующее:

*В отношении препаратов для введения посредством подкожной или внутримышечной инъекции, таких как рилпивирин, переносимость пациентом является дополнительной сложностью в случае больших объемов препарата. Например, введение посредством подкожной или внутримышечной инъекции может привести к раздражению, воспалению, набуханию, острой боли и/или покраснению и кровоподтекам в течение и после инъекции в месте инъекции (реакции в месте инъекции).*

*(...) для дозирования только один раз в несколько месяцев или реже...*

Таким образом, технический результат может быть сформулирован как получение композиции пролонгированного действия или способа лечения ВИЧ-инфекции длительного действия, обладающим сниженным раздражительным действием.

При этом, следует отметить, что формулировки независимых пунктов содержат 2 группы признаков, каждая из которых влияет на достижение своего, отдельного технического результата.

Как указано в описании Заявки, добавление гиалуронидазы улучшает переносимость, и может снижать утечку рилпивирин и сопротивление ткани (с. 6).

В свою очередь, рилпивирин в форме микро- или наночастиц с размером частиц от 1 мкм до 10 мкм имеет сниженный или уплощенный профиль, сохраняя замедленное или пролонгированное высвобождение рилпивирин в плазму крови (с. 8 описания Заявки).

Следует отметить, что описание должно включать подтверждение достижения технического результата. Как следует из описания заявки, приведено 4 примера и 4 графика (Фиг. 1-4), при этом:

Пример 1 – введение рилпивирин с гиалуронидазой:

- состав, помимо рилпивирин, включает вспомогательные вещества: полоксамер, глюкозу, дигидрофосфат натрия, лимонную кислоту, гидроксид натрия, воду для инъекций. Исследования проводили на карликовых свиньях, раствор рилпивирин и гиалуронидазы вводили последовательно.

Пример 2 – эффекты последовательного и смешанного введения рилпивирин с гиалуронидазой после однократного введения. Растворы рилпивирин и гиалуронидазы вводили одновременно или последовательно карликовым свиньям.

Пример 3 – исследование растворения при различном размере частиц рилпивирин, исследование проводилось *in vitro*.

Пример 4 – исследование растворения рилпивирин при различном размере частиц, в форме суспензии.

Таким образом, следует заключить, что материалы заявки НЕ включают подтверждение достижения технического результата «снижение раздражительного действия», т.к. не приведены примеры по уменьшению раздражения и т.п.

Кроме того, как следует из Фиг. 1, при длительном применении не показан уплощенный профиль, из Фиг. 2 – не доказан перерыв до 2 лет, график включает точку только 6,5 мес. Следовательно, признаки «с перерывами во времени от 3 мес. до 2 лет» не влияют на достижение технического результата, относящегося к пролонгированному действию (с перерывами от 3 мес. до 2 лет).

Также, как следует из Фиг. 3 и 4, профили частиц с размером от 1 мкм до 10 мкм совпадают при растворении, при этом, на Фиг. 3 представлен профиль растворения частиц рилпивирин с размером 685 нм, который является более гладким и показывает большее растворение, чем частицы рилпивирином размером 1,91 мкм и 5,55 мкм. Таким образом, признаки «частицы имеют  $Dv90$  от около 1 мкм до около 10 мкм» также не подтверждены в отношении технического результата «пролонгированное действие».

На основании вышесказанного следует заключить, что в отношении данных признаков (размер частиц, введение с перерывами от 3 мес до 2 лет) не подтверждено достижение технического результата, и они не должны учитываться при оценке новизны и изобретательского уровня.

Далее будут рассмотрены аргументы, подтверждающие несоответствие условию новизны и изобретательского уровня с учетом этого.

#### Аргументы, подтверждающие несоответствие условию новизны и изобретательского уровня

Соединение рилпивирин для лечения ВИЧ-инфекции уже было известно до даты приоритета изобретения. Например, оно описано достаточно подробно в следующих заявках на патент:

Таблица 1 международные заявки на патент, относящиеся к рилпивирину

Международная заявка (WO/PCT)	Объект по существу
WO/2001/064656 PCT/GB2001/000829	Основное соединение рилпивирин (АФС) и аналоги (в т.ч. соли) (в виде структуры Маркуша)
WO/2003/016306 PCT/EP2002/008953	Основное соединение рилпивирин, аналоги и применение в лечении ВИЧ-инфекции
WO/2005/021001 PCT/EP2004/052028	Комбинация рилпивирин RIL + TDF/ЗТС/FTC/ABC
WO/2006/024667 PCT/EP2005/054341	Фумаратная соль рилпивирин и применение в ВИЧ-инфекции
WO/2006/024668 PCT/EP2005/054342	Рилпивирин хлорид и применение в ВИЧ-инфекции
WO/2007/082922 PCT/EP2007/050516	Композиция для парентерального введения (длительного действия)
<b>WO/2007/147882</b> <b>PCT/EP2007/056230</b>	Наночастицы рилпивирин (длительного действия)
WO/2008/110619 PCT/EP2008/053056	Композиция (порошок для восстановления суспензии)
WO/2009/007441 PCT/EP2008/059054	Полиморфные формы (длительного действия)
WO/2012/068535 PCT/US2011/061515	Комбинация рилпивирин RIL+TDF
WO/2017/004012 PCT/US2016/039762	Комбинация рилпивирин RIL+TAF+FTC
WO/2018/077815 PCT/EP2017/077030	Композиция (в виде дисперсии)
WO/2019/003150 PCT/IB2018/054769	Композиция, комбинация (многослойная таблетка DTG+RIL)
WO/2019/016732 PCT/IB2018/055349	Способ лечения ВИЧ-инфекции, комбинация рилпивирин CAB+RIL (длительного действия)
WO/2021/001568 PCT/EP2020/068913	Способ лечения ВИЧ-инфекции (педиатрические дозы)
WO/2021/001508 PCT/EP2020/06873	Способ лечения ВИЧ-инфекции (педиатрические дозы)

Как следует из Таблицы выше, рилпивирин в виде лекарственного средства для лечения ВИЧ-инфекции уже известен и широко изучен. Также рилпивирин исследован в виде своих солей, и в виде комбинаций. В связи с этим специалист в данной области техники был бы мотивирован к поиску комбинаций рилпивирин с другим активным веществом или в какой-либо лекарственной форме, например, пролонгированного или длительного действия.

Кроме того, заявитель на с. 3-4 описывает источники, в который раскрыт рилпивирин в виде наночастиц (WO 2007147882 – Д1), при этом в данном документе представлено прямое указание на то, что в настоящее время отдается предпочтение инъекционным (парентеральным) формам, т.е. в виде внутримышечной или подкожной инъекции. Также в Д1 раскрыто применение ПАВ из группы полуксамеров (п. 3 Д1), аналогично Примеру 1 по Заявке, и “из Pluronic™ F108” (п. 4, с. 17 Д1), с указанием, что это – полуксамер 338. В Д1 также представлен средний размер частиц рилпивирин: менее 50 мкм, в частности, менее 200 нм. до 0,2 мкм. В общем виде в Д1 также описаны композиции, и их конкретные варианты (пример 1 Д1): 5000 мг рилпивирин, 3-50% рилпивирин (п. 7), а также указано, что интервал между введениями может быть от 1 недели до 2 лет. Таким образом, из Д1 известны суспензии рилпивирин для инъекционного введения, с перерывом до 2 лет. Следовательно, технический результат «композиция с пролонгированным действием» достигается за счет уменьшения размера частиц рилпивирин до микро- или наночастиц. Об этом также свидетельствует то, что известен препарат RECAMBYS<sup>1</sup> в виде инъекции в форме суспензии рилпивирин, длительного действия, для внутримышечного введения.

В источнике Д2 также подтвержден тот факт, что при снижении размера частиц возможно изменить фармакокинетику активного вещества в организме, в частности, добиться пролонгирования его действия. (Merisko-Liversidge E, Liversidge GG, Cooper ER. Nanosizing: a formulation approach for poorly-water-soluble compounds. European journal of pharmaceutical sciences, 18 (2), 113-120, 2003 – Д2). Так, в Д2 (с. 113, с. 117) отмечается, что уменьшение размера частиц может приводить к более раннему началу действия препарата в организме, а также к длительности его действия. Таким образом, для пролонгирования действия рилпивирин при введении

---

<sup>1</sup> [https://www.ema.europa.eu/en/documents/product-information/rekambys-epar-product-information\\_en.pdf](https://www.ema.europa.eu/en/documents/product-information/rekambys-epar-product-information_en.pdf)

его суспензии в виде инъекции можно вводить рилпивирин в виде микро или наночастиц.

Таким образом, специалист на основании Д1-Д2 был бы мотивирован снизить размер частиц и изучить длительности действия рилвипивирин в организме.

Следовательно, на основании Д1-Д2 очевидно, что применение рилвипивирин в виде инъекции, содержащей суспензию микро или наночастиц рилвипивирин, можно получить пролонгированную форму препарата для лечения ВИЧ-инфекции.

Заявленное изобретение отличается от Д1 тем, что включает гиалуронидазу. Как указано в описании заявки, гиалуронидаза позволяет снизить сопротивление ткани и уменьшить раздражающее действие на кожу.

Однако, этот эффект также известен из источников Д3-Д5. Так, Д3 (WO2004078140. Soluble hyaluronidase glycoprotein (sHASEGP), process for preparing the same, uses and pharmaceutical compositions comprising thereof. Applicant: Halozyme, Inc.- Д3) раскрывает дозы гиалуронидазы и снижение раздражающего действия в месте инъекции, в модели на животных. В источнике Д4 (Buhren BA et al. Hyaluronidase: from clinical applications to molecular and cellular mechanisms. Eur. J. Med. Res., 21 (5), 2016. – Д4) также раскрыто применение гиалуронидазы, механизм ее действия на ткани и применение в качестве адъюванта, и средства, повышающего биодоступность других активных веществ. В источнике Д5 (Locke KW, et al. Enhance® drug delivery technology: a novel approach to subcutaneous administration using recombinant human hyaluronidase PH20. Drug Deliv. 2019 Dec;26(1):98-106. doi: 10.1080/10717544.2018.1551442. Erratum in: Drug Deliv. 2019 Dec;26(1):1300. doi: 10.1080/10717544.2019.1594569. – Д5) описана технология доставки лекарственных веществ с помощью гиалуронидазы для применения при лечении другими активными веществами.

Таким образом, на основании источников Д3-Д5 специалисту очевидно добавление гиалуронидазы к рилвипивирину для получения технического результата «снижение раздражающего действия», «повышение содержания рилвипивирин» (снижение утечки).

При этом, специалисту известны средства и методы, которыми можно получить и состав, содержащий рилвипивирин и гиалуронидазу в комбинации, способы введения

этих веществ, а также методы, с помощью которых можно получить частицы рилпивирин от 1 до 10 мкм.

На основании вышесказанного следует заключить, что изобретение по пп. 1, 34-41, 52, 55, 56, 57, 58 очевидно для специалиста на основании источников Д1-Д5, с учетом технического результата.

Учитывая, что согласно п. 5.7. Правил, форма представления информации не имеет значения, и она может быть представлена в различных источниках, то в свете документов Д1-Д5 изобретение по п. 1, 34-41, 52, 55, 56, 57, 58 не соответствует условию «новизны» и «изобретательского уровня».

### **3.3. Материалы заявки не раскрывают изобретение достаточно ясно и полно, для осуществления изобретения специалистом**

Как следует из описания и формулы изобретения, 1, 34-41, 52, 55, 56, 57, 58 относится к композиции, содержащей рилпивирин, гиалуронидазу, и способу лечения ВИЧ-инфекции с помощью такой композиции.

Согласно п. 2.5.4.4. Правил, для характеристики композиции могут быть использованы, в частности, следующие признаки:

*качественный состав (ингредиенты);*

*количественный состав (содержание ингредиентов);*

*структурные характеристики.*

*Для характеристики композиции неправомерно в качестве её признаков использовать сведения, непосредственно к композиции не относящиеся (например, условия и режимы использования этой композиции в каком-либо процессе, способе); 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 (например, параметры прочности ламинирования, сопротивления растрескиванию при напряжении, фармакокинетического профиля и т.п.); технический результат, достигаемый при реализации, использовании композиции.*

*При характеристике фармацевтической композиции не допускается использование признаков, относящихся к способу лечения или профилактики заболевания*

(например, указание доз, условий или режимов применения композиции или лекарственных средств, полученных на ее основе).

Как следует из п. 1, 34-41, 52, 55, 56, 57, 58 и описания, характеристики самой композиции не приведены: не указаны дозы, конкретные вспомогательные вещества. При этом, приведено указание на введение с перерывами от 3 мес. до 2 лет, что не относится к характеристикам самой композиции.

Таким образом, евразийская заявка не раскрывает изобретение достаточно ясно и полно, для осуществления изобретения специалистом и не соответствует Правилу 21<sup>1</sup>(3) Инструкции. Исправить данные недостатки невозможно без выхода за пределы первоначальных материалов заявки, содержащихся на дату ее подачи, без изменения сущности изобретения.

#### **3.4. Формула изобретения не определяет объект изобретения и не выражает сущность изобретения, а также не является ясной, точной и не основана на описании**

Формула изобретения по пп. 1, 34-41, 52, 55, 56, 57, 58 не определяет объем изобретения в связи и не выражает сущность изобретения, не является ясной и точной. Формула изобретения содержит признаки, выраженные общими понятиями и не характеризующими объект изобретения как таковой. Так, согласно формуле изобретения, предложена композиция, содержащая рилпивирин и гиалуронидазу, а также способ лечения ВИЧ-инфекции с введением данной композиции. Однако, в формуле изобретения отсутствует указание на соотношение компонентов между собой, и вспомогательные вещества. Примеров по лечению ВИЧ-инфекции именно предлагаемой комбинацией рилпивирин и гиалуронидазы в материалах заявки не представлено. Кроме того, сами примеры включает только указание 2 возможных значений содержания рилпивирин в композиции, и одного значения гиалуронидазы, в то время как в формуле изобретения по существу указаны любые соотношения (или не указаны вообще).

Согласно п. 2.5.6.3 Правил:

*Если изобретение относится к композиции (смеси, раствору, сплаву, стеклу и т.п.), приводятся примеры, в которых указываются ингредиенты, входящие в состав*

композиции, их количественное соотношение, а также структурные характеристики. Описывается способ получения композиции, а если она содержит в качестве ингредиента новое вещество, то описывается способ его получения.

Если изобретение относится к средству для лечения, диагностики или профилактики определенного заболевания людей и животных, в описании приводятся достоверные сведения, подтверждающие его пригодность соответственно для лечения, диагностики или профилактики указанного заболевания.

Таким образом, формула изобретения в объеме заявленных пп. 1, 34-41, 52, 55, 56, 57, 58 не определяет объект изобретения и не выражает сущность изобретения, а также не является ясной, точной и не основана на описании, и не соответствует Правилу 21.1 (4) Инструкции. Исправить данные недостатки невозможно без выхода за пределы первоначальных материалов заявки, содержащихся на дату ее подачи, без изменения сущности изобретения.

### **3.5. Недостатки заявки не могут быть устранены без внесения существенных изменений**

Согласно Правилу 49(3) Инструкции, «дополнение, уточнение или исправление описания и формулы изобретения, а также чертежей, не выходящее за пределы первоначальных материалов заявки, содержащихся на дату ее подачи, и не изменяющее сущности изобретения, допускается, за исключением исправления технических и очевидных ошибок, до даты вынесения по евразийской заявке решения об отказе в выдаче евразийского патента или решения о его выдаче.

*Изменение формулы изобретения допускается в пределах раскрытия изобретения в описании изобретения в евразийской заявке.»*

Как следует из анализа выше, изобретение не соответствует условиям патентоспособности «новизна» и «изобретательский уровень», при этом, даже при внесении признаков из зависимых пунктов, относящихся к независимым пунктам, и возможных признаков из описания, изобретение не может быть признано патентоспособным. Кроме того, описание не содержит достаточное количество примеров, которые могли бы быть основой для таких. Таким образом, для признания соответствия условиям патентоспособности необходимо внесение существенных

изменений и дополнений, в частности, данными, которых не было в материалах заявки на дату подачи. Эти материалы однозначно будут изменять сущность изобретения, и не могут быть приняты даже при ответе на уведомление при экспертизе по существу.

На основании этого следует признать, что изобретение по заявке 202391454 не является патентоспособным в объеме материалов заявки на дату подачи.

**Как следует из изложенного выше, изобретение по заявке 202391454 в объеме заявленной формулы изобретения не соответствует условиям патентоспособности, установленными правилом 3 Патентной инструкции, требованиям по правилам 21<sup>1</sup>(3) и 21<sup>1</sup>(4) Патентной инструкции. В виду того, что данные недостатки не могут устранены без внесения изменений, не выходящими за пределы первоначальных материалов, патент по данной заявке не может быть выдан.**

Дополнительно, лицо, подающее данные замечания, прилагает социально – экономическое обоснование в отношении рассматриваемой заявки, и хотело бы обратить внимание на следующее. Рилвипирин как субстанция уже известна давно и охраняется 3 патентами, композиции, содержащие рилвипирин и его комбинации, для лечения ВИЧ- инфекции – более 3 патентами. Все это говорит о том, что заявка ЕА 202391454 не раскрывает изобретение как таковое, а относится к известным композициям и их свойствам. В связи с этим, а также по причинам, указанным выше, просим рассмотреть аргументы по отсутствию новизны и изобретательского уровня и отказать в выдаче патента по данной заявке.

Также, лицо, подающее замечания, прикладывает лист с подписями представителей некоммерческих организаций, являющихся членами ЕАПО и присоединившимся к данным замечаниям.



/А.А. Лешенок/

Президент Соц. НПО «Армянская сеть позитивных людей»

Анаит Арутюнян



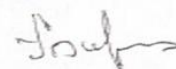
Председатель республиканского общественного  
объединения «Люди ПЛЮС»  
Анатолий Лешенок



Объединение юридических лиц «Ассоциация Answer-Kazakhstan»  
Президент, Растокина Елена Александровна



Общественный фонд «АГЕР'С», Казахстан, Алматы.  
Директор Сергей Анатольевич Бирюков



АНО «Национальный центр общественного здоровья»  
Директор, Истомин Максим



## **Социально-экономическое обоснование в отношении рассматриваемой Евразийской патентной организацией заявки на выдачу патента ЕА 202391454.**

Заявка на выдачу Евразийского патента ЕА 202391454 (от 17.11.2021 г.) относится к рилпивирину или его фармацевтически приемлемой соли в форме микро- или наночастиц в суспензии, а также к лечению или профилактике ВИЧ-инфекции с использованием рилпивирин или его фармацевтически приемлемой соли в форме микро- или наночастиц в суспензии в комбинации с гиалуронидазой.

**Рилпивирин** – Ненуклеозидный ингибитор обратной транскриптазы (ННИОТ). ННИОТ связываются с ферментом обратной транскриптазы ВИЧ, чтобы не дать ему транслировать свою вирусную РНК в ДНК, чтобы вирус не мог размножаться. Рилпивирин был одобрен FDA США в 2011, заявитель или патентообладатель: Janssen Sciences Ireland (J&J).

**Гиалуронидаза** – фермент/белок, который разрушает гиалуроновую кислоту, присутствующую во внеклеточном матриксе. Применение: в качестве вспомогательного вещества для увеличения дисперсии и абсорбции вводимого АФИ без реакций в месте инъекции (раздражение, воспаление, отек, острая боль и/или покраснение и синяки). Рекомбинантная человеческая гиалуронидаза (rHuPH20) – растворимая форма естественной человеческой гиалуронидазы, облегчает абсорбцию и дисперсию вводимых подкожно жидкостей и лекарств.

**!** Важно отметить, что на данный момент в Евразийскую патентную организацию (ЕАПО) было подано не менее **девяти** заявок в отношении рилпивирин, методов профилактики и лечения ВИЧ-инфекции и его производных, как минимум **семь** из них были удовлетворены, и на них были выданы патенты (перечислены ниже):

- Основной патент ЕА 006656 (Евразийская заявка ЕА 200400304 от 09.08.2002г.) был выдан ЕАПО на «Производные пиримидина, ингибирующие ВИЧ» на имя Компании ЯНССЕН ФАРМАЦЕВТИКА Н.В. (ВЕ) 24.02.2006 г.
- 30.12.2008 той же компанией был получен патент ЕА 011036 на «Фумарат 4-[[4-[[4-(2-Цианоэтенил)-2,6-Диметилфенил]Амино]-2- Пиримидинил]Амино] Бензонитрила» (фумарат соль)
- 30.06.2010 был получен патент ЕА 013686 на «Гидрохлорид 4-[[4-[[4-(2-Цианоэтенил)-2,6-Диметилфенил]Амино]-2-Пиримидинил]Амино] Бензонитрила» (соль хлорида)
- Далее 28.02.2011 г. был выдан патент ЕА 014840 (заявка ЕА 200600522) на «Комбинации пиримидинсодержащего NNRTI с ингибиторами обратной транскриптазы» (рилпивирин+тенофовира дизопроксил фумарат/эмтрицитабин/абакавир)
- 28.02.2011 г. – патент ЕА 014914 на «Долговременное Лечение Вич-Инфекции»
- 31.08.2015 – патент ЕА 021700 на «Фармацевтическая композиция, содержащая 4-[[4-[[4-(2-цианоэтенил)-2,6-диметилфенил]амино]-2-пиримидинил]амино]бензонитрил (ТМС278) в форме суспензии микро- или

наночастиц, способ ее получения и ее применение для длительного лечения или профилактики вич-инфекции»

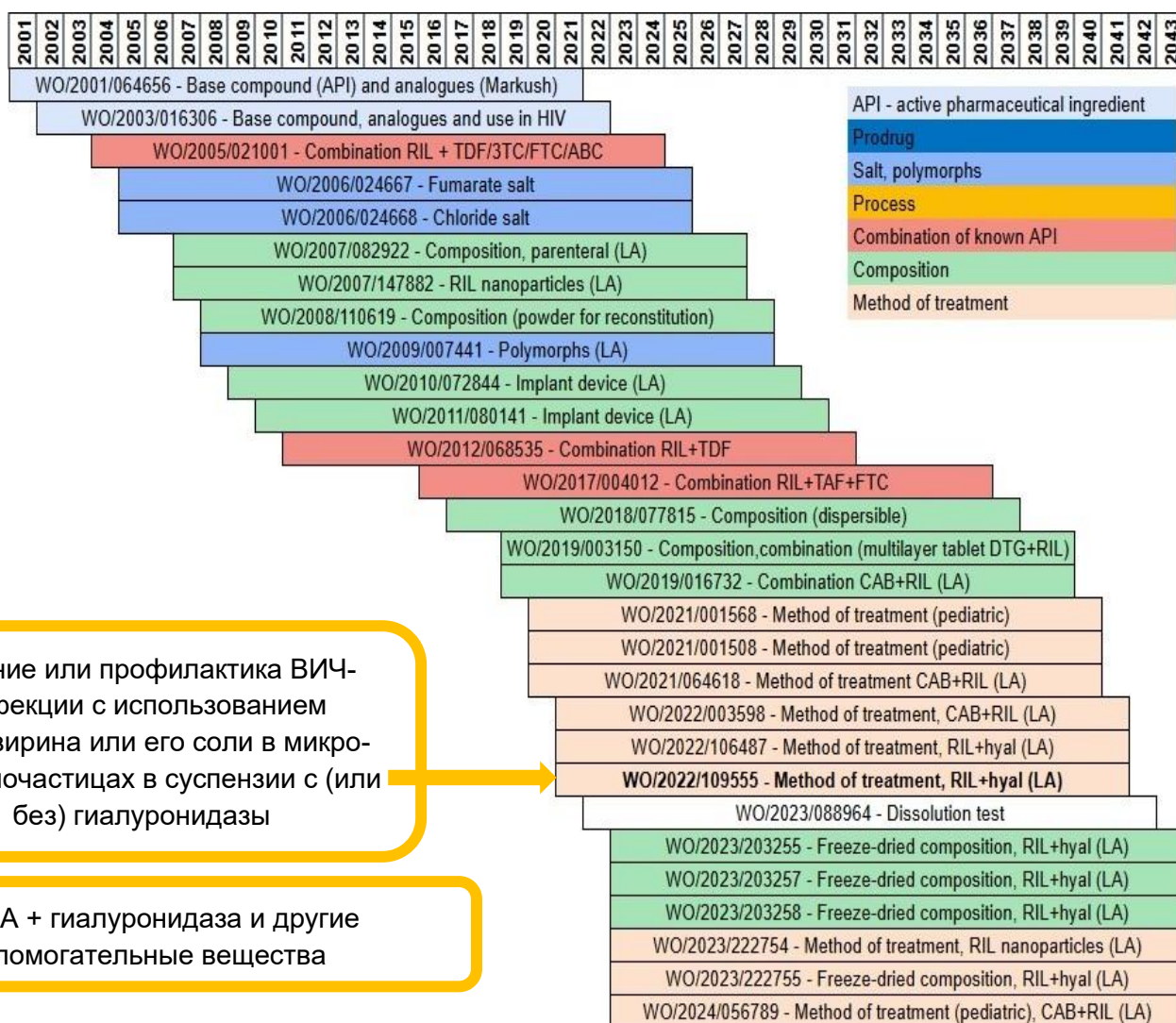
- 28.02.2017 г. – патент ЕА 025852 на «Терапевтические композиции, содержащие рилпивирин НСЛ и тенофовира дизопрроксилфумарат»

Кроме того, 03.07.2020 г. в ЕАПО была подана и на данный момент находится на рассмотрении заявка ЕА 202290205 на «Способы лечения инфекции, вызванной ВИЧ, с помощью рилпивирина у пациентов детского возраста».

Таким образом, на территории восьми стран-участниц ЕАПО защищен уже как минимум семью патентами, последний из которых (ЕА 28852) **прекращает свое действие в конце 2033 года**. Как показывает схема ниже, в разных странах мира было подано не менее 29 заявок, связанных с рилпивиринном, что может продлевать действие патентных прав вплоть до 2042 года.

Заявка на изобретение ЕА 202391454 является 22-ой из всех заявленных в мире, ее одобрение приведет к выходу вторичного патента, объект которого не несет дополнительной важности для использования в лечении ВИЧ-инфекции. Вместе с этим выдача патента по этой заявке **продлит патентную защиту еще на 8 лет**, и обеспечит дополнительный монопольный период, который будет действовать на территории восьми стран Евразийского региона вплоть до 2041 года.

### Информация о поданных заявках на получение патентов, связанных с рилпивиринном, в профилактике и лечении ВИЧ-инфекции



Лечение или профилактика ВИЧ-инфекции с использованием рилпивирина или его соли в микро- или наночастицах в суспензии с (или без) гиалуронидазы

RIL-LA + гиалуронидаза и другие вспомогательные вещества

- ☞ Исключение из патентоспособности. Изобретение по заявке ЕА 202391454 также относится к методу лечения. При этом в соответствии со статьей 27 Соглашения ВТО по ТРИПС государства-члены имеют право исключить из патентоспособности «3.(а) диагностические, терапевтические и хирургические методы лечения людей или животных».
- ☞ Отсутствие промышленной применимости. Согласно документу ПРООН «Руководящие принципы фармацевтической патентной экспертизы: рассмотрение фармацевтических патентов с точки зрения общественного здравоохранения» (2016 г.), методы медицинского лечения по определению оказывают воздействие на организм и лишены промышленной применимости.
- ☞ Использование. Согласно ПРООН (2016 г.), повторное использование подтверждает отсутствие промышленной применимости, поскольку «эффекты возникают в организме» (стр. 44). Мы полагаем, что даже для первого медицинского использования этот аргумент применим, поскольку использование не может быть объектом промышленного процесса и по этой причине не соответствует требованию промышленной применимости.

Рилпивирин является важным препаратом в лечении ВИЧ-инфекции, он используется в комбинации с долутегравиром, тенофовиром и эмтрицитабином, а также может применяться в составе комплексной терапии в сочетании с другими препаратами. При этом цена комбинации эмтрицитабин/рилпивирин/тенофовир в государственных закупках Российской Федерации в 2024 году составила 304 778 рублей в год<sup>2</sup>, что является самой высокой ценой за годовой курс среди всех АРВ-препаратов.

Из информации выше видно, что рилпивирин как активное вещество для лечения ВИЧ-инфекции давно известен и изучен, на него получено множество охранных документов, патентная защита действует более 20 лет, и выдача патента по заявке ЕА 202391454 приведет к продлению монополии более, чем на 20 лет. Такая ситуация приведет к сохранению высокой цены на препарат, что в свою очередь затруднит доступ к лечению ВИЧ-инфекции всем нуждающимся пациентам стран-участниц ЕАПО.

Более того, выдача патента именно по данной заявке будет представлять собой ошибку, т.к. в данном случае данное изобретение не является патентоспособным в виду известности всех признаков из уровня техники.

Как итог, выдача патента по заявке ЕА 202391454 будет стимулировать подачу фармацевтическими компаниями заявок на вторичные патенты, не соответствующие критериям патентоспособности, основная цель которых заключается в получении сверхприбыли путем необоснованного продления монополии на лекарственные средства. Это в свою очередь может дополнительно негативно сказаться на доступности лекарственных средств для граждан стран – участниц Евразийской патентной организации в целом и на доверии к патентной системе.

---

<sup>2</sup> <https://zdravresource.ru/wp-content/uploads/2025/05/arvt-2024.pdf>

Таблица 15. Стоимость основных схем лечения в 2024 году

Схема лечения первого ряда		Стоимость на одного пациента в год, 2024	
		в рублях	в долларах США <sup>7</sup>
<b>Предпочтительные схемы</b>			
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + эфавиренз 600 мг	3TC+TDF+EFV	8 858,55	\$96
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + долутеграви́р 50 мг	3TC+TDF+DTG	56 553,10	\$611
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + элсульфавирин 20 мг	TDF+3TC+ESV	71 386,70	\$772
тенофовир/элсульфавирин/эмтрицитабин 245/20/200 мг (ФКД)	ESV/TDF/FTC	73 605,90	\$796
ламивудин/тенофовир/эфавиренз 300/300/600 мг (ФКД)	3TC/TDF/EFV	31 641,85	\$342
<b>Альтернативные схемы</b>			
ламивудин 300 мг + абакавир 600 мг + долутеграви́р 50 мг	3TC+ABC+DTG	63 243,55	\$684
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + эфавиренз 400 мг	3TC+TDF+EFV400	6 668,55	\$72
<b>Схема лечения второго ряда</b>		<b>Стоимость на одного пациента в год, 2024</b>	
		<b>в рублях</b>	<b>в долларах США</b>
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + долутеграви́р 50 мг	3TC+TDF+DTG	56 553,10	\$611
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + дарунавир 800 мг + ритонавир 100 мг	3TC+TDF+DRV/r	28 422,55	\$307
ламивудин 300 мг + абакавир 600 мг + дарунавир 800 мг + ритонавир 100 мг	3TC+ABC+DRV/r	35 113,00	\$380
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + атазанавир 300 мг + ритонавир 100 мг	3TC+TDF+ATV/r	23 020,55	\$249
ламивудин 300 мг + абакавир 600 мг + атазанавир 300 мг + ритонавир 100 мг	3TC+ABC+ATV/r	29 711,00	\$321
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + ралтеграви́р 400 мг	3TC+TDF+RAL	155 544,75	\$1 681
ламивудин/зидовудин 150/300 мг + лопинавир/ритонавир 200/50 мг	AZT/3TC+LPV/r	73 146,00	\$791
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + лопинавир/ритонавир 200/50 мг	3TC+TDF+LPV/r	59 476,75	\$643
ламивудин 300 мг + абакавир 600 мг + лопинавир/ритонавир 200/50 мг	3TC+ABC+LPV/r	66 167,20	\$715
эмтрицитабин/рилпивирин/тенофовир 200/25/300 мг	RPV/TDF/FTC	304 778,65	\$3 294
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + этрави́рин 200 мг	3TC+TDF+ETR	99 831,15	\$1 079
биктеграви́р/тенофовир алафенамид/эмтрицитабин	BIC/FTC/TAF	191 373,15	\$2 068
кобицистат/тенофовира	EVG/C/FTC/TAF	191 373,15	\$2 068
алафенамид/элвитеграви́р/эмтрицитабин 150/10/150/200 мг			
доравирин/ламивудин/тенофовир 100/300/245 мг (ФКД)	DOR/3TC/TDF	151 186,65	\$1 634
ламивудин 300 мг + тенофовир 300 мг + доравирин 100 мг	DOR+3TC+TDF	145 886,85	\$1 577
<b>Упрощенный режим</b>			
ламивудин 300 мг + долутеграви́р 50 мг	3TC+DTG	54 111,25	\$585
ламивудин 300 мг/долутеграви́р 50 мг (ФКД)	3TC/DTG	82 632,35	\$893

\* стоимость в рамках одной схемы может незначительно варьироваться из-за разных дозировок НИОТ.

<sup>7</sup> Среднегодовой курс \$ 2024 = 92,5212 руб. <https://www.kursvaliut.ru/>