

**100%LIFE**

 **aidsfonds**

 **ITPC**  
INTERNATIONAL TREATMENT  
PREPAREDNESS COALITION

  
SCIENTIFIC-RESEARCH INSTITUTE  
OF INTELLECTUAL PROPERTY  
NATIONAL ACADEMY OF LAW  
SCIENCES OF UKRAINE

# ДОСЛІДЖЕННЯ

## вічнозелених патентів в Україні

---

**2020**

## /ЗМІСТ

- /2      Методологія дослідження
- /6      Препарати для лікування ВІЛ
- /14     Препарати для лікування туберкульозу
- /18     Препарати для лікування вірусних гепатитів
- /23     Препарати для лікування онкологічних захворювань
- /31     Препарати для лікування ревматоїдних артритів
- /37     Препарати для лікування інших захворювань
- /53     Резюме дослідження

## /МЕТОДОЛОГІЯ ДОСЛІДЖЕННЯ

**Однією з проблемних сфер системи охорони здоров'я України є висока ціна на лікарські засоби. У багатьох випадках причиною цього є те, що законодавство України дозволяє фармацевтичним компаніям одержувати так звані вічнозелені патенти, які дають їм монополію на імпортування (виробництво) лікарського засобу. «Вічнозелені патенти» – термін, який використовується щодо патентів на фармацевтичні вироби для позначення штучного продовження дії виключних прав, які гарантуються патентом на діючу речовину фармацевтичного засобу, шляхом подання нової заявки та отримання нового патенту на різноманітні додаткові форми й нові властивості діючої речовини, а також діагностичних, терапевтичних та хірургічних методів лікування людини й тварин із застосуванням зазначеної діючої речовини. Таким чином, фармацевтичні компанії штучно подовжують монополію на препарат в Україні завдяки патентам, які формально відповідають вимогам законодавства, однак на практиці не мають суттєвих переваг над існуючими аналогами.**

На небезпечний вплив «вічнозелених патентів» звертають увагу і міжнародні організації, зокрема, Всесвітня організація охорони здоров'я (ВООЗ) та Програма розвитку ООН (ПРООН). Міжнародними організаціями було розроблено два важливі документи із рекомендаціями щодо вдосконалення законодавства про інтелектуальну власність:

*Методичні рекомендації для проведення експертизи фармацевтичних патентів (січень 2007 року), розроблені за підтримки ВООЗ, УНКТАД та ICTSD;*

*Керівництво з проведення експертизи патентних заявок, які відносяться до лікарських засобів (червень 2016 року), розроблене за підтримки ПРООН.*

Ці документи міжнародних організацій стали основою для даного дослідження. Для визначення того, чи відноситься заявка на видачу патенту України на винахід чи виданий патент України до категорії «вічнозелених патентів», необхідно спочатку класифікувати об'єкт (об'єкти) патентування. Об'єктом патентування може бути речовина, представлена як індивідуальна хімічна сполука або композиція або нове застосування відомої речовини, або об'єктом може бути спосіб застосування речовини чи її отримання чи отримання проміжних сполук тощо.

Для характеристики індивідуальних хімічних сполук, зокрема, використовують:

- для низькомолекулярних сполук: якісний склад (атоми певних елементів), кількісний склад (число атомів кожного елемента); зв'язок між атомами, взаємне розташування їх у молекулі, виражене хімічною структурною формулою, чи в кристалічній решітці;
- для високомолекулярних сполук: хімічний склад і структуру однієї ланки макромолекули, структуру макромолекули в цілому (лінійну, розгалужену), періодичність ланок, молекулярну масу, молекулярно-масовий розподіл, геометрію та стереометрію макромолекули, її кінцеві та бокові групи;
- для індивідуальних сполук з невизначеною структурою: фізико-хімічні та інші характеристики, у тому числі ознаки способу одержання, що дають змогу їх ідентифікувати;
- для індивідуальних сполук, що належать до об'єктів генетичної інженерії: послідовність нуклеотидів (для фрагментів нуклеїнових кислот) або фізичну карту (для рекомбінантних нуклеїнових кислот і векторів), а також послідовність амінокислот, фізико-хімічні та інші характеристики, що дають змогу їх ідентифікувати.

Для характеристики композицій, зокрема, використовують:

- якісний (інгредієнти) склад;
- кількісний (вміст інгредієнтів) склад;
- структуру композиції;
- структуру інгредієнтів.

Патенти та патентні заявки з ознаками «вічнозеленості» відносять до категорії «вторинних» патентів/патентних заявок, адже за своєю суттю вони базуються на первинному патенті, який захищає або захищав конкретну інноваційну хімічну сполуку. При цьому слід усвідомлювати, що не кожен «вторинний» патент автоматично є «вічнозеленим». Із метою визначення «вічнозеленого» патенту щодо індивідуальної хімічної сполуки або композиції на її основі рекомендується здійснювати перевірку заявленої хімічної сполуки за наведеними нижче критеріями з урахуванням наявності/відсутності відмінностей у технічних результатах:

1. \_\_\_\_\_

Чи підпадає хімічна сполука під загальну формулу Маркуша раніше поданої заявки?

2. \_\_\_\_\_

Чи була вона раніше описана як спеціально отримана?

3. \_\_\_\_\_

Чи є відмінним при цьому технічний результат?

4. \_\_\_\_\_

Чи відрізняється нова хімічна сполука від відомих за формулою Маркуша однотипних замісників у межах однієї групи (класу)? Чи є фармацевтична композиція за новою заявкою чи патентом поліморфною формою раніше відомої композиції?

5. \_\_\_\_\_

Чи є активно діюча речовина за новою заявкою та/або патентом результатом перекристалізації раніше відомої речовини (у менш стійкий та стабільний поліморф, псевдополіморф або аморфні форми, або ж її складним та простим ефіром, ізомером, включаючи її гідрати та сольвати)?

Для характеристики нового застосування відомої речовини використовують ідентифікуючі ознаки відомої речовини та ознаки її нового застосування, призначення.

6. \_\_\_\_\_

Чи є хімічна сполука фармацевтичної композиції за новою заявкою чи патентом енантіомером або оптичним ізомером активно діючої речовини раніше відомої композиції з однаковою молекулярною формулою та однакоvim терапевтичним ефектом?

7. \_\_\_\_\_

Чи є фармацевтична композиція за новою заявкою чи патентом відмінною від раніше відомої композиції лише дозуванням, тобто є новою дозованою формою раніше відомої речовини, або має нову форму застосування (наприклад, ін'єкція при існуючій пероральній таблетованій формі)?

8. \_\_\_\_\_

Чи є фармацевтична композиція за новою заявкою чи патентом відмінною від раніше відомої композиції лише за складом нових солей відомих інгредієнтів, складних та простих ефірів, ізомерів відомих молекул, включаючи гідрати та сольвати?

9. \_\_\_\_\_

Чи є фармацевтична композиція за новою заявкою чи патентом новою комбінацією відомих раніше активних речовин?

10. \_\_\_\_\_

Чи є фармацевтична композиція за новою заявкою чи патентом метаболітом активно діючої речовини раніше відомої композиції (крім випадків, коли активні метаболіти мають відмінні профілі безпеки та ефективності у факторах вихідної молекули, що спричиняє відмінний покращений терапевтичний ефект), або її проліком?

**Оскільки кількість біотехнологічних препаратів, які виходять на український ринок, кожен рік зростає, дане дослідження не могло оминути їх своєю увагою. Підхід до аналізу патентів на винаходи для об'єктів біотехнології в цілому схожий із підходом, описаним у Методичних рекомендаціях, які застосовуються для інших винаходів на хімічні сполуки, речовини, композиції тощо. Окремої методики, яка би стосувалась саме об'єктів біотехнології, поки що немає.**

**У дослідженні щодо даної категорії лікарських засобів застосовувались такі методологічні підходи:**

1. Під час здійснення аналізу композиції, одним із активних елементів якої є об'єкт біотехнології, основним критерієм для віднесення винаходу до «вічнозелених» є технічний результат та відомість цього об'єкту раніше. Якщо технічний результат полягає в нових якостях композиції, які не впливають на її лікувальну ефективність (біологічну активність), а наприклад, впливають на стабільність, то можна зробити висновок про те, що винахід є «вічнозеленим» (якщо тільки проблема стабільності не була відома як основний бар'єр для застосування об'єкту біотехнології). Також до уваги беруться дані опису, які повинні підтверджувати зазначений технічний результат.
2. Аналогічний зазначеному вище підхід здійснюється і для винаходу, який стосується способу виготовлення або очищення чи введення об'єкту біотехнології в організм людини. Тобто спосіб, направлений на підвищення біологічної активності, можна визнати таким, що не є «вічнозеленим», а спосіб, направлений на вирішення іншої проблеми, може бути визнаний «вічнозеленим».
3. У випадку, якщо об'єкт охарактеризовано тільки параметрами важкого та легкого ланцюгів (переліком послідовностей), то робиться висновок про те, що винахід не є «вічнозеленим». Якщо об'єкт (речовина або спосіб) характеризується додатковими ознаками (розмірами молекул, параметрами процесу тощо), можна зробити висновок про те, що винахід «вічнозелений», але у кожному конкретному випадку.
4. У разі, якщо об'єкт є новим застосуванням відомого раніше об'єкту біотехнології, у більшій частині випадків робиться висновок про те, що такий винахід не є «вічнозеленим».
5. Якщо власником патенту для аналізу є компанія – виробник генеричних версій, а не оригінатор, і об'єктом винаходу є суттєве вдосконалення, навіть яке не впливає на біологічну активність, робиться висновок про те, що патент не є «вічнозеленим», тому що метою патентування в даному випадку є захист нової розробки, а не потреба продовжити строк патентного захисту вже давно відомої сполуки.

Також важливим є те, які проблеми супроводжували конкретний препарат протягом його використання і як вони були вирішені чи не вирішені, про що можна дізнатися з наукових публікацій у відкритих і доступних джерелах. Ця інформація використовується при здійсненні аналізу «вічнозеленості», у тому числі й для об'єктів біотехнології.

На підставі даних критеріїв БО «100 Відсотків Життя» за експертної підтримки НДІ Інтелектуальної власності НА-ПрН України та юридичної компанії «Боровик та Партнери» проаналізувала 132 патенти. Основу дослідження склали запатентовані односторонні препарати, частка яких у централізованих закупівлях за результатами 2017 року перевищила 100 000 доларів США, а також препарати, частка яких у рамках госпітальних та аптечних закупівель перевищила 50 млн гривень за підсумками 2017 року.

Додатково в дослідження увійшли деякі препарати, де наявність патенту є або була перешкодою в доступі до лікування. Це можуть бути препарати, які тривалий час закуповувалися в одного виробника через наявність патентної монополії, лікарські засоби, які або не закуповуються (тривалий час не закуповувались), чи їх закупівля в майбутньому є під питанням у зв'язку з наявністю патентних монополій тощо.

Основною дослідження стали запатентовані препарати, якщо:

132

патенти проаналізували

> 100 000 \$

частка у централізованих закупівлях запатентованих односторонніх препаратів

> 50 млн грн

частка у рамках госпітальних та аптечних закупівель

препарати, де наявність патенту є або була перешкодою в доступі до лікування

## /ПРЕПАРАТИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ВІЛ/СНІДУ

### ЛОПІНАВІР / РИТОНАВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
1	UA 85564 «ТВЕРДА ФАРМАЦЕВТИЧНА ДОЗОВАНА ФОРМА, ЩО МІСТИТЬ ІНГІБІТОР ВІЛ-ПРОТЕАЗИ, СПОСІБ ЇЇ ОДЕРЖАННЯ» / 23.08.2004	Так	Відома раніше комбінація відомих активних сполук (лопінавір та ритонавір) з конкретними фізико-хімічними параметрами фармацевтично-прийнятних речовин, а саме температурою склування T <sub>g</sub> та масовою часткою водорозчинного полімеру та гідрофільно-ліпофільного балансу (ГЛБ) і масовою часткою ПАВ. Винахід направлений на отримання поліпшеної оральної твердої дозованої форм для інгібіторів ВІЛ-протеази, які мають відповідну оральну біодоступність та стабільність, і які не відчувають необхідності у високих об'ємах наповнювача. Документ WO 2004/032903 розкриває композицію з лопінавіром та зазначеними вище фармацевтично-прийнятними речовинами, документ WO 01/34119 розкриває композицію з ритонавіром та фармацевтично-прийнятними речовинами. Має місце доповнення ознак відомих композицій конкретними параметрами їхніх складових.
2	UA 89220 «СПОСІБ ЛІКУВАННЯ ВІЛ/СНІДУ ШЛЯХОМ ПРИЙОМУ БЕЗ ЇЖІ АБО В УМОВАХ ГОЛОДУВАННЯ ТВЕРДОГО ФАРМАЦЕВТИЧНОГО ДОЗОВАНОГО СКЛАДУ ІНГІБІТОРА ВІЛ-ПРОТЕАЗИ» / 21.02.2006	Так	Спосіб застосування відомих сполук. Спосіб лікування ВІЛ/СНІДУ, який включає введення твердої фармацевтичної дозованої форми, яка містить лопінавір і ритонавір у вигляді твердого розчину або твердої дисперсії з конкретними параметрами фармацевтично-прийнятних речовин (температури склування T <sub>g</sub> водорозчинного полімеру та гідрофільно-ліпофільного балансу ПАВ). Застосування комбінації лопінавіру і ритонавіру як інгібіторів ВІЛ-протеази є відомим із рівня техніки. Конкретні параметри складових дозованої форми є очевидними, і переваги їх не доведені. Усі ознаки винаходу є очевидними для фахівців, і їхній вибір є стандартним.

### ДАРУНАВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
3	UA 100835 «СПОСІБ СИНТЕЗУ (3R,3aS,6aR)-ГЕКСАГІДРО-ФУРО[2,3-b]ФУРАН-3-ОЛУ, ПРОМІЖНА СПОЛУКА ТА СПОСІБ ЇЇ ОДЕРЖАННЯ» / 31.03.2005	Ні	Спосіб синтезу проміжної сполуки формули (6) (3R,3aS,6aR)-hexahydrofuro [2,3-b]furan-3-yl), яка використовується, зокрема, і при синтезі дарунавіру етанолу ((3aS,4R,6aR)-2,3,3a,4,5,6a-hexahydrofuro[2,3-b]furan-4-yl] N-[(2S,3R)-4-[(4-aminophenyl)sulfonyl-(2-methylpropyl)amino]-3-hydroxy-1-phenylbutan-2-yl]carbamate) та проміжна сполука формули α-(4) для синтезу сполуки (1). Відомий синтез дарунавіру етанолу без застосування проміжної сполуки формули (6) або сполуки формули α-(4), які, з іншого боку, можуть бути використані для синтезу інших речовин, ніж дарунавіру етанол. Винахід не відноситься тільки до дарунавіру і тому не є «вічнозеленим».

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
4	UA 85567 «СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ (3R,3AS,6AR)-ГЕКСА-ГІДРОФУРО[2,3-b]ФУРАН-3-ІЛ(1S,2R)-3-[[[4-АМІНОФЕНІЛ]СУЛЬФОНІЛ] (ІЗОБУТИЛ)АМІНО]-1-БЕН-ЗИЛ-2-ГІДРОКСИПРОПІЛ-КАРБАМАТУ» / 31.03.2005	Так	Спосіб синтезу відомої сполуки (дарунавіру етанолу) та проміжні сполуки для такого синтезу, направлені на підвищення виходу сполуки і ступеню чистоти, спрощення та підвищення ефективності витрат. Дарунавіру етанол та деякі проміжні сполуки розкриті у US6248775B1. Спосіб не дозволяє поліпшити фармакологічну або біологічну активність дарунавіру етанолу.

**ТЕНОФОВІР / ЕМТРИЦИТАБІН / ЕФАВІРЕНЦ**

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
5	UA 108594 «ОДИНИЧНА ДОЗОВАНА ФАРМАЦЕВТИЧНА ФОРМА» / 13.06.2006	Так	Потрібна комбінована дозована форма відомих антивірусних сполук (теніфовір, емтрицитабін та ефавіренц), яка дозволяє забезпечити їх біосумісність та розмір комбінованого продукту. Винахід не дозволяє поліпшити фармакологічну або біологічну активність відомих сполук, а тільки споживчу якість продукту, яку можна досягнути й іншим шляхом.

**ТЕНОФОВІР АЛАФЕНАМІД ФУМАРАТ (ТАФ)**

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
6	UA 75889 «ПРОЛІКИ АНАЛОГІВ ФОСФОНАТНУКЛЕОТИДУ, СПОСІБ ЇХ СЕЛЕКЦІЇ ТА ОДЕРЖАННЯ» / 20.07.2001	Так	ТАФ (GS-7340) є одними із проліків відомої сполуки – теніфовіру (TFV), утворених на основі іншого ефіру порівняно з відомою формою теніфовіру дезопроксилу (TD). ТАФ містить фумарат, аналогічний тому, що використовується у TD. Використання саме фумарату є очевидним при виготовленні АРВ-препаратів. У результаті розпаду проліків у організмі утворюються активні речовини, аналогічні при розпаді TDF. Тому ТАФ не є новою сполукою, незважаючи на певні переваги перед TDF.
7	UA 115311 «ГЕМІФУМАРАТ ТЕНО-ФОВІРУ АЛАФЕНАМІДУ» / 15.08.2012	Так	Патентна заявка захищає геміфумарат відомої сполуки, який має переваги перед монофумаратом у вигляді зменшення побічних ефектів. Сполука не має достатньої ефективності, яка могла би свідчити про її неочевидність або несподівану ефективність. Відсутність побічних ефектів може бути пояснена зменшенням дози геміфумарата порівняно з відомим монофумаратом. Винахід має ознаки «вічнозеленого».

**АБАКАВІР**

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
8	UA 29382 /«КАРБОЦИКЛІЧНІ НУКЛЕ-ОЗИДИ 6-ЗАМІЩЕНОГО ПУРИНУ» / 21.12.1990	Ні	Патент захищає низькомолекулярну терапевтичну сполуку загальної структури та її енантіомери. Винахід вперше розкриває антивірусну активність отриманої сполуки через механізм її розщеплення in vivo у раніше відому активну частину карбонового трифосфату. Проте сполука раніше не була описана як спеціально отримана. Тому цей винахід відповідає умовам патентоздатності і є первісним патентом на абакавір.
9	UA 56231 «ГЕМІСУЛЬФАТ (1S, 4R)-ЦИС-4-[2-АМІНО-6-(ЦИКЛОПРОПІЛАМІНО)-9Н-ПУРИН-9-ІЛ]-2-ЦИ-КЛОПЕНТЕН-1-МЕТАНОЛУ АБО ЙОГО СОЛЬВАТ ТА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ» / 14.05.1998	Так	Патент захищає гемісульфатну сіль абакавіру, яка має терапевтичну активність, аналогічну абакавіру, проте має більшу оптичну чистоту, що надає перевагу в її застосуванні при виготовленні препаратів (спрощення етапів підготовки та очищення). Винахід є очевидним і не має достатнього винахідницького рівня порівняно із розкритим раніше, зокрема патентом на сполуку абакавіру або заявкою на сіль абакавіру у вигляді сукцинату.
10	UA 60293 «СПОСІБ ЛІКУВАННЯ АБО ПОПЕРЕДЖЕННЯ СИМПТОМІВ АБО ДІЇ ВІЛ-ІНФЕКЦІЇ ТА ВИКО-РИСТОВУВАНІ В НЬОМУ КОМБІНАЦІЯ СПОЛУК (ВАРІАНТИ), ФАРМАЦЕВ-ТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ ТА ПРОДУКТ (ВАРІАНТИ)» / 28.03.1996	Ні	Комбінація відомих сполук: абакавіру, ламівудину (ЗТС) та емтрицитабіну (або азидотимідину (зидовудину)). Навіть із урахуванням відомості кожного з компонентів комбінації та його дії винахід декларує новий неочікуваний синергетичний ефект (більш подовжену пригнічуючу дію, контроль токсичності та обмеження мутацій), який продемонстровано в заявці та який не впливає прямо із відомої дії кожної зі сполук. Патент не захищає кожну зі сполук окремо, а тільки їх комбінацію або комбінацію їх функціональних похідних. Патент не є «вічнозеленим».

**РІЛПІВІРІН**

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
11	UA 78221 «ПОХІДНІ ПІРИМІДИНІВ, ЩО ІНГІБУЮТЬ ВІЛ» / 09.08.2002	Ні	Об'єктами винаходу є: - нові піримідинових похідних, що мають інгібуючі властивості щодо реплікації ВІЛ (вірусу імунодефіциту людини), які відрізняються за структурою, фармакологічною активністю та/або фармакологічною ефективністю від відомих аналогів, що вказані в описанні винаходу; - нові фармацевтичні композиції на їх основі; - способи одержання та використання нових піримідинових похідних, що мають інгібуючі властивості щодо реплікації ВІЛ та композицій на їх основі. Рілпівірін є одним з об'єктів винаходу за п. 20 формули винаходу, що підтверджується Прикладом В1, В6а (див. також таблицю 3) з описання винаходу, який не був раніше описаний як спеціально отриманий.



#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
12	UA 92469 «ФУМАРАТ 4-[[4-[[4-(2-ЦИАНО-ЕТЕНІЛ)-2,6-ДИМЕТИЛФЕНІЛ]АМІНО]-2-ПІРИМІДИНІЛ]АМІНО]БЕНЗОНІТРИЛУ» / 02.09.2005	Так	Об'єктом винаходу є, зокрема: - сіль рілпівіріну; її N-оксид або стереохімічно ізомерна форма, представлена у вигляді «E»-, або «Z»-ізомеру, або суміші ізомерів; - фармацевтичні композиції на їх основі; - способи отримання та застосування сполук та композицій на їх основі. Вільна основа заявленої солі рілпівіріну підпадає під загальну формулу Маркуша винаходу за патентом України №78221. Із позиції фармакологічних (фармацевтичних) властивостей технічний результат такий самий, як і в об'єкта винаходу (сполуки) за патентом України №78221. Водночас сіль рілпівіріну відрізняється від вільної основи лише хімічною і фізичною стабільністю в різних умовах вологості й температури та має кращу біодоступність, що пояснюється наявністю форми у вигляді конкретної солі.
13	UA 92467 «ГІДРОХЛОРИД 4-[[4-[[4-(2-ЦИАНО-ЕТЕНІЛ)-2,6-ДИМЕТИЛФЕНІЛ]АМІНО]-2-ПІРИМІДИНІЛ]АМІНО]БЕНЗОНІТРИЛУ» / 02.09.2005	Так	Об'єктом винаходу є, зокрема: - фармацевтична композиція на основі солі рілпівіріну, поліморфної форми солі рілпівіріну або поліморфної форми рілпівіріну, її N-оксиду або стереохімічно ізомерної форми, представленою у вигляді «E»-, або «Z»-ізомеру, або суміші ізомерів; - способи отримання та застосування активних діючих сполук, що входять до складу композицій. Водночас вільна основа солі рілпівіріну заявленої композиції підпадає під загальну формулу Маркуша винаходу за патентом України №78221. Із позиції фармакологічних (фармацевтичних) властивостей технічний результат такий самий, як і в об'єкта винаходу (сполука, композиція) за патентом України №78221. Водночас сіль рілпівіріну відрізняється від вільної основи лише хімічною та фізичною стабільністю в різних умовах вологості й температури та має кращу біодоступність, що пояснюється наявністю форми у вигляді конкретної солі.

## АТАЗАНАВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
14	UA 59432 «МОНОСУЛЬФАТ АЗАПЕПТИДНОГО ПОХІДНОГО ТА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПЗИЦІЯ НА ЙОГО ОСНОВІ» /22.12.1998	Так	Об'єктом винаходу є моносульфат атаназавіру, на відомість вільної основи якого є посилення в описанні винаходу, та фармацевтична композиція на його основі. Із позиції фармакологічних (фармацевтичних) властивостей моносульфат атаназавіру має такий самий технічний результат, як і його вільна основа. Водночас сіль атаназавіру відрізняється від вільної основи лише фізичною стабільністю, покращеною розчинністю у воді порівняно з іншими солями і значно покращеною біодоступністю при пероральному введенні.

## ВАЛГАНЦИКЛОВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
15	UA 93599 «ПОРОШКОПОДІБНИЙ ПРЕПАРАТ ВАЛГАНЦИКЛОВІРУ» / 03.12.2007	Так	Об'єктами винаходу є тверда фармацевтична дозована форма, призначена для перорального введення після відновлення у воді, на основі терапевтично ефективної кількості валганцикловіргідрохлориду та її застосування для приготування лікарського засобу, призначеного для лікування простого герпесу і захворювань, опосередкованих цитомегаловірусом. Валганцикловіргідрохлорид детально описаний в патенті США №6083953, тобто є відомою сполукою з визначеними фармацевтичними властивостями. Технічним результатом винаходу UA 93599 є одержання препарату валганцикловіргідрохлориду, призначеного для застосування в педіатрії та для пацієнтів, яким необхідно міняти дозування препарату. Це досягається за допомогою твердих фармацевтичних дозованих форм валганцикловіргідрохлориду, призначених для перорального введення після відновлення у воді. Водночас відомо, що у твердому стані при зберіганні в умовах навколишнього середовища валганцикловіргідрохлорид має прийнятну фізичну та хімічну стабільність і світлостійкість. Таким чином, об'єктом патентування є композиція, відмінна від раніше відомої композиції новою формою застосування.

## РАЛТЕГРАВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
16	UA 77454 «N-ЗАМІЩЕНІ ГІДРОКСИПІРИМІДИНОН КАРБОКСАМІДНІ ІНГІБІТОРИ ВІЛ-ІНТЕГРАЗИ» / 21.10.2002	Ні	Об'єктами винаходу є: - нові гідрокси-піримідинонові карбоксаміди, які відрізняються за структурою, фармакологічною активністю та/або фармакологічною ефективністю від відомих аналогів, що вказані в описанні винаходу, їх фармацевтично прийнятні солі; - композиції на основі вищезазначених сполук; - їх застосування як інгібіторів ферменту ВІЛ-інтегрази. Ралтегравір як вільна основа описана як спеціально отримана у Прикладі 19 (див. також п. 24 таблиці 2) описання винаходу за патентом України №77454. У описанні винаходу зазначається, що «практичне здійснення винаходу охоплює всі звичайні варіанти, пристосування і/або модифікації», тобто й фармацевтично прийнятну сіль ралтегравіру.
17	UA 87884 «БЕЗВОДНА КРИСТАЛІЧНА КАЛІЄВА СІЛЬ ІНГІБІТОРА ВІЛ-ІНТЕГРАЗИ» / 02.12.2005	Так	Об'єктом винаходу є: - безводна кристалічна калієва сіль ралтегравіру; - фармацевтична композиція на основі ефективної кількості безводної кристалічної калієвої солі ралтегравіру; - застосування безводної кристалічної калієвої солі ралтегравіру для приготування лікарського препарату для лікування/профілактики ВІЛ-інфекції/СНІДу. Ралтегравір як вільна основа безводної кристалічної калієвої солі ралтегравіру підпадає під загальну формулу Маркуша винаходу за патентом України №77454, була описана в описанні цього винаходу як спеціально отримана. Із позиції фармакологічних властивостей технічний результат такий самий, як і в об'єкта винаходу за патентом України №77454. При цьому наявний додатковий технічний результат, який пояснюється виключно кристалічною формою калієвої солі, а саме: 1) покращена розчинність у воді; 2) покращена фармакінетика. Фармацевтична композиція на основі безводної кристалічної калієвої солі ралтегравіру з позиції фармакологічних (фармацевтичних) властивостей має такий самий технічний результат, що й фармацевтична композиція на основі ралтегравіру за патентом України на винахід №77454.

## ДОРАВІРИН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
18	UA 108495 «НЕНУКЛЕОЗИДНІ ІНГІБІТОРИ ЗВОРотної ТРАНСКРИПТАЗИ» / 28.03.2011	Ні	Об'єктами винаходу є деякі 3-(необов'язковий заміщений фенокси)-1-[[5-оксо-4,5-дигідро-1Н-1,2,4-триазол-3-іл)метил]]піридин-2(1Н)-онових сполуки та фармацевтичні композиції на їх основі. Технічним результатом винаходу UA 108495 є нові 3-(необов'язково заміщені фенокси)-1-[[5-оксо-4,5-дигідро-1Н-1,2,4-триазол-3-іл)метил]]піридин-2(1Н)-онових сполуки та їх використання для інгібування ВІЛ-зворотної транскриптази, профілактики ВІЛ-інфекції, лікування ВІЛ-інфекції та профілактики, лікування і для перешкоджання виникнення або розвитку СНІДу і/або АРС. Отже, об'єктом патентування є нові хімічні сполуки та фармацевтичні композиції на їх основі, призначені для інгібування ВІЛ-зворотної транскриптази, профілактики ВІЛ-інфекції, лікування ВІЛ-інфекції та профілактики, лікування і для перешкоджання виникнення або розвитку СНІДу і/або АРС.

## КОБІЦИСТАТ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
19	UA 97112 «МОДУЛЯТОРИ ФАРМАКОКІНЕТИЧНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ» / 06.07.2007	Ні	Об'єктами винаходу є: - нові сполуки, які модифікують фармакокінетику лікарського засобу; - фармацевтичні композиції на основі зазначених вище сполук; - спосіб покращення фармакокінетики лікарського засобу.
20	UA 101193 «ЗАСТОСУВАННЯ ЧАСТИНОК ТВЕРДОГО НОСІЯ ДЛЯ ПОЛІПШЕННЯ ТЕХНОЛОГІЧНИХ ХАРАКТЕРИСТИК ФАРМАЦЕВТИЧНОГО АГЕНТА» / 01.05.2009	Так	Об'єктами винаходу є: - фармацевтичні композиції на основі кобіцистату; - способи отримання зазначених вище фармацевтичних композицій. Технічна задача, яку вирішує винахід, – це створення нової фармацевтичної форми фармацевтичної композиції на основі відомої сполуки – кобіцистат. Нова фармацевтична форма композиції на основі кобіцистату не змінює її фармацевтичні властивості. Отже, винаходом за патентом UA 101193 фактично охороняється нова фармацевтична форма застосування композицій на основі відомої сполуки кобіцистат.
21	UA 101312 «МОДУЛЯТОРИ ФАРМАКОКІНЕТИЧНИХ ВЛАСТИВОСТЕЙ ТЕРАПЕВТИЧНИХ ПРЕПАРАТІВ» / 22.02.2008	Ні	Об'єктами винаходу є: - нові сполуки, які модифікують фармакокінетику лікарського засобу; - фармацевтичні композиції на основі зазначених вище сполук. Заявка на винахід за патентом UA 101312 подана у період, що не перевищує 12 місяців від дати пріоритету заявки на винахід за патентом UA 97112. Отже, одним із об'єктів патентування винаходу UA 74797 є нові сполуки, які модифікують фармакокінетику лікарського засобу.
22	UA 103224 «ТАБЛЕТКИ ДЛЯ КОМБІНОВАНОЇ ТЕРАПІЇ» / 04.02.2010	Так	Об'єктами винаходу є фармацевтичні композиції у формі таблеток та спосіб одержання таких таблеток. Технічна задача, яку вирішує винахід, – поліпшення твердих дозованих форм (наприклад, таблеток) для доставки композицій, що містять декілька відомих агентів, зокрема, кобіцистат. Нова тверда дозована форма фармацевтичної композиції відрізняється від відомих фактично тим, що АФІ розташовуються в ній шарами. Водночас не заявлено про синергетичний ефект у фармацевтичних властивостях таких композицій порівняно із сукупним фармацевтичним ефектом від окремого прийняття таких самих АФІ. Отже, винаходом за патентом UA 103224 фактично охороняється нова тверда дозована фармацевтична форма застосування композицій на основі відомих сполук.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
23	UA 108738 «СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ІНГІБІТОРА ЦИТОХРОМ Р450 МОНООКСИГЕНАЗИ ТА ЗАЛУЧЕНІ ПРОМІЖНІ СПОЛУКИ» / 01.04.2010	Ні	Об'єктами винаходу є нові способи одержання кобіцистату та проміжних сполук, які використовуються у цих способах.

## ЕТРАВІРИН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
24	UA 70966 «ПІРИМІДИНИ, ЩО ІНГІБУЮТЬ РЕПЛІКАЦІЮ ВІЛ» / 24.09.1999	Ні	Об'єктами винаходу є: - піримідинові сполуки; - спосіб одержання зазначених вище сполук; - фармацевтичні композиції на основі зазначених вище сполук. Етравірин підпадає під загальну формулу Маркуша винаходу за патентом UA 70966. Є сполукою, яка спеціально отримана та досліджена (сполука 46, приклад В14 описання винаходу). У EP-0834507 розкрито заміщені діаміно 1,3,5-триазинові похідні, що мають властивості інгібувати реплікацію ВІЛ. Однак Етравірин та інші піримідини за патентом UA 70966 не підпадають під загальну формулу Маркуша винаходу за патентом EP 0834507. Таким чином, одним з об'єктів патентування винаходу UA 70966 є нові хімічні сполуки, які інгібують реплікацію ВІЛ.
25	UA 74797 «АНТИВІРУСНА КОМПОЗИЦІЯ» / 31.08.2000	Ні	Об'єктами винаходу є: - сполуки з антивірусними властивостями; - фармацевтичні антивірусні композиції на основі визначених вище сполук; - способи отримання фармацевтичних антивірусних композицій. Етравірин підпадає під загальну формулу Маркуша винаходу за патентом UA 74797. Є сполукою, яка спеціально отримана та досліджена (сполука 26, приклад 2В14 описання винаходу). Водночас, як зазначалося вище, Етравірин розкритий у патенті UA 70966. Однак заявка на винахід за патентом UA 74797 подана у період, що не перевищує 12 місяців від дати пріоритету заявки на винахід за патентом UA 70966. Таким чином, одним із об'єктів патентування винаходу UA 74797 є нові хімічні сполуки, які інгібують реплікацію ВІЛ.

## РОВАФОВІР ЕТАЛАФЕНАМІД

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
26	UA 88313 «ФОСФОНАТНІ АНАЛОГИ СПОЛУК ІНГІБІТОРІВ ВІЛ» / 26.07.2005	Ні	Об'єктами винаходу є: - нові сполуки із властивостями інгібіторів ВІЛ; - фармацевтичні композиції на основі вищезазначених сполук; - спосіб лікування порушень, пов'язаних із ВІЛ, із застосуванням вищезазначених сполук. Формулою винаходу охоплюється Ровафовір еталафенамід.
27	UA 103329 «СОЛІ СПОЛУК-ІНГІБІТОРІВ ВІЛ» / 07.07.2009	Так	Об'єктами винаходу є: - нові солі відомої сполуки, що мають антивірусну активність, зокрема, мають активність проти ВІЛ; - фармацевтичні композиції на основі зазначених вище солей сполук. Отже, одним із об'єктів винаходу є сіль відомої сполуки, іншим – фармацевтична композиція за новою заявкою, відмінна від раніше відомої композиції лише за складом нових солей відомих інгредієнтів.

## /ПРЕПАРАТИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ТУБЕРКУЛЬОЗУ

## МОКСИФЛОКСАЦИН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
28	UA 35554 «ПОХІДНІ ХІНОЛОН- І НАФТИРИДОНКАРБОНОВОЇ КИСЛОТИ У ВИГЛЯДІ СУМІШІ ІЗОМЕРІВ АБО ОКРЕМИХ ІЗОМЕРІВ, ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПЗИЦІЯ, ЩО МАЄ АНТИБАКТЕРІАЛЬНУ АКТИВНІСТЬ, ТА ПРОМІЖНІ СПОЛУКИ» / 16.04.1993	Так	Об'єктом винаходу є: - похідних хінолон- і нафтиридонкарбонОВОЇ кислоти, які підпадають під відомі загальні структурні формули Маркуша, але відрізняються від відомих сполук новою сукупністю радикалів суміші ізомерів або окремих ізомерів; - фармацевтичні композиції на їх основі. Водночас нові похідні хінолон- і нафтиридонкарбонОВОЇ кислоти мають кращу фармакологічну активність та/або фармакологічну ефективність порівняно з відомими аналогами, але не були раніше описані як спеціально отримані. В окремих випадках (наприклад, для моксифлоксацину) нові похідні хінолон- і нафтиридонкарбонОВОЇ кислоти є оптичними ізомерами, енантіомерами активнодіючих речовин раніше відомих композицій з однаковою молекулярною формулою та однаковим терапевтичним ефектом.
29	UA 52952 «Комплект антибактеріального лікарського засобу» / 22.06.2010	Так	Об'єктом корисної моделі є комплект антибактеріального лікарського засобу на основі моксифлоксацину. Технічним результатом є комплект антибактеріального лікарського засобу, який би мав високі антибактеріальні властивості (за рахунок моксифлоксацину) та поліпшував кислотно-лужний баланс крові (за рахунок ізотонічного розчину Рінгера). Таким чином, об'єктом патентування є композиція, яка по суті є новою комбінацією відомих раніше активних речовин.
30	UA 56286 «СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ПОХІДНИХ 8-МЕТОКСИ-3-ХІНОЛОНКАРБОНОВОЇ КИСЛОТИ» / 12.11.1998	Ні	Об'єктом винаходу є спосіб одержання похідних 8-метокси-3-хінолонкарбонОВОЇ кислоти загальної формули (I). Технічним результатом винаходу є спосіб одержання похідних 8-метокси- хінолонкарбонОВИХ кислот, що дозволяє скоротити час реакції, проводити роботу при атмосферному тиску, що забезпечує повне перетворення, а також просту підготовку реакційної суміші. Таким чином, патент не перешкоджає отримувати моксифлоксацин іншим, відмінним від патенту способом та використовувати його.
31	UA 66812 «ПРЕПАРАТИВНА ФОРМА ЛІКАРСЬКОГО ЗАСОБУ ІЗ РЕГУЛЬОВАНИМ ВИВІЛЬНЕННЯМ АКТИВНОЇ РЕЧОВИНИ» / 15.09.1998	Ні	Об'єктом винаходу є препаративна форма лікарського засобу на основі моксифлоксацину. Технічним результатом винаходу є препаративна форма лікарського засобу з контрольованим вивільненням моксифлоксацину в заданих межах. В той же час моксифлоксацин, його фармацевтично прийнятні солі, його виготовлення, таблетовані форми описано в EP-A-0305733, EP-A-0550903, JP-A-0780390. Таким чином, об'єктом патентування є препаративна форма відомого лікарського засобу, але з новими, невідомими раніше, властивостями щодо вивільнення діючої речовини.



#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
32	UA 72268 «ВОДНА КОМПОЗИЦІЯ МОКСИФЛОКСАЦИНУ, ЩО МІСТИТЬ ХЛОРИД НАТРІЮ» / 25.07.2000	Ні	Об'єктом винаходу є водна композиція моксифлоксацину гідрохлориду та хлориду натрію. Технічним результатом є водна композиція, що містить моксифлоксацин-гідрохлорид і хлорид натрію для застосування в якості лікарського засобу для профілактики чи лікування бактеріальних інфекцій у людей чи тварин. Моксифлоксацин як високоефективний протиінфекційний засіб еперше описаний у заявці до європейського патенту EP-A-0350733. Однак у цій заявці не описуються фармацевтичні препарати, придатні для парентерального введення. Лікарська композиція моксифлоксацин-хлориду, який ізотонізують хлоридом натрію, з одного боку, не має чутливості до іонів заліза, з іншого – розчинність активної речовини моксифлоксацину у формі його гідрохлориду в присутності хлориду натрію справді надзвичайно погана. Проте випадково було знайдено, що прийнятні композиції моксифлоксацин-хлориду при ізотонізуванні хлоридом натрію можуть бути отримані, якщо дотримуватися визначених вузьких областей концентрацій для активної речовини та ізотонізуючого агента. Таким чином, об'єктом патентування є водна композиція моксифлоксацину гідрохлориду та хлориду натрію у вузькому інтервалі їх концентрацій.
33	UA 72483 «ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ ПРЕПАРАТ МОКСИФЛОКСАЦИНУ ТА СПОСІБ ЙОГО ОДЕРЖАННЯ» / 29.10.1999	Ні	Об'єктами винаходу є: - фармацевтична композиція на основі моксифлоксацину, яка додатково містить лактозу у кількості 2,5–25 мас.%; - спосіб одержання такої композиції. Технічним результатом є фармацевтична форма для виробництва таблеток з достатньою твердістю і відповідною механічною міцністю, які у той же час мають відмінні властивості вивільнення моксифлоксацину. Моксифлоксацин як високоефективний протиінфекційний засіб вперше описаний у заявці до європейського патенту EP-A-0350733. У цій же заявці згадується фармацевтичний препарат на основі моксифлоксацину з додатковими речовинами, серед яких відсутня лактоза.

## БЕДАКВІЛІН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
34	UA 82198 «ХІНОЛІНОВІ ПОХІДНІ ТА ЇХ ВИКОРИСТАННЯ ЯК МІКОБАКТЕРІАЛЬНИХ ІНГІБІТОРІВ, СПОСІБ ЇХ ОДЕРЖАННЯ, ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ НА ЇХ ОСНОВІ, ПРОМІЖНА СПОЛУКА» / 18.07.2003	Ні	Об'єктом винаходу є: - нові заміщені хінолінові похідні, придатні для лікування мікобактеріальних захворювань, особливо захворювань, спричинених патогенними мікобактеріями, такими як <i>Mycobacterium tuberculosis</i> , <i>M.bovis</i> , <i>M.avium</i> та <i>M.marinum</i> , які відрізняються за структурою, фармакологічною активністю та/або фармакологічною ефективністю від відомих аналогів, що вказані в описі винаходу, їх фармацевтично прийнятні кислотно-адитивні або основно-адитивні солі, стереохімічно ізомерні форми або N-оксидна форма; - фармацевтичні композиції на основі вище зазначених сполук; - способи одержання та застосування зазначених сполук та композицій на їх основі. Бедаквілін є одним з об'єктів винаходу за п. 26 формули винаходу, що підтверджується Прикладом В7, В6а (див. також таблицю 3) з описання винаходу, який не був раніше описаний як спеціально отриманий.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
35	UA 97813 «ФУМАРАТНА СІЛЬ (АЛЬФА S, БЕТА R)-6-БРОМ-АЛЬФА-[2-(ДИМЕТИЛАМІНО) ЕТИЛ]-2-МЕТОКСИ-АЛЬФА-1-НАФТАЛЕНІЛ-БЕТА-ФЕНІЛ-3-ХІНОЛІНІТА-НОЛУ» / 03.12.2007	Так	Об'єктом винаходу є, зокрема: - фумаратна сіль, вільна основа якої за п. 1,2,3 формули винаходу підпадає під загальну формулу Маркуша винаходу за патентом України № 82198; - фармацевтичні композиції на їх основі; - способи отримання та застосування сполук та композицій на їх основі. Із позиції фармакологічних (фармацевтичних) властивостей технічний результат такий самий, як і в об'єкта винаходу (сполуки, композиції) за патентом України №82198. Водночас порівняно з описом фармацевтичної композиції, що міститься у описанні винаходу за патентом України № 82198, композиція має різні дозовані форми та різні форми застосування за рахунок конкретизації якісного та кількісного складу активної речовини та допоміжних речовин.
36	UA 90267 «ЗАСТОСУВАННЯ ЗАМІЩЕНИХ ХІНОЛІНОВИХ ПОХІДНИХ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЗАХВОРЮВАНЬ, ЯКІ ВИКЛИКАНІ МІКОБАКТЕРІЯМИ, РЕЗИСТЕНТНИМИ ДО ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ» / 24.05.2005	Ні	Об'єктами винаходу є: - композиція, продукт на основі заміщених хінолінових похідних для лікування захворювань, які викликані мікобактеріями, резистентними до лікарських засобів, їх фармацевтично прийнятних кислотно-адитивних або основно-адитивних солей, стереохімічно ізомерних форм, таутомерних форм або N-оксидних форм; - застосування зазначених вище композицій, продуктів для інгібування розмноження штамів <i>Mycobacterium tuberculosis</i> , резистентних до лікарського засобу, зокрема, штаму <i>Mycobacterium tuberculosis</i> . Заміщені хінолінові похідні, до яких належить бедаквілін, описані в Міжнародній публікації WO 2004/011436 як такі, що мають антимікобактеріальну властивість проти чутливих, сприйнятливих штамів мікобактерій, але ці сполуки не були описані як такі, що є ефективними проти штамів мікобактерій, резистентних до лікарського засобу, зокрема, штамів мікобактерій, резистентних до декількох лікарських засобів. Описання винаходу UA 90267 містить підтвердження отримання, дослідження бедаквіліну, а також його властивостей щодо інгібування штамів мікобактерій, резистентних до лікарського засобу. Таким чином, об'єктом патентування є хімічні сполуки, які підпадають під загальну формулу Маркуша раніше поданої заявки і були описані як спеціально отримані. Однак не було відомо застосування цих сполук для досягнення нового технічного результату.
37	UA 92484 «СПОСІБ ОТРИМАННЯ (АЛЬФА-S, БЕТА-R)-6-БРОМО-АЛЬФА-[2-(ДИМЕТИЛАМІНО) ЕТИЛ]-2-МЕТОКСИ-АЛЬФА-1-НАФТАЛЕНІЛ-БЕТА-ФЕНІЛ-3-ХІНОЛІНІТА-НОЛУ» / 22.05.2006	Ні	Об'єктами винаходу є: - спосіб виділення бедаквіліну із суміші стереоізомерних форм 6-бром--[2-(діметиламіно)етил]-2-метоксі-1-нафталеніл--феніл-3-хінолінетанолу; - сіль, що має таку формулу: (αS,βR)-6-бром-α-[2-(діметиламіно)етил]-2-метоксі-α-1-нафталеніл-β-феніл-3-хінолінетанол*(11bR)-4-гідроксицинафто[2,1-d:1,2'-f][1,3,2]діоксафосфепін-4-оксид. 6-бром-[2-(діметиламіно)етил]-2-метоксі-1-нафталеніл-феніл-3-хінолінетанол і його стерео-ізомерні форми розкриті в WO2004/011436 як протимікробні агенти, що застосовуються для лікування мікобактеріальних захворювань, зокрема захворювань, що спричиняються патогенними мікобактеріями, такими як <i>Mycobacterium(M.) tuberculosis</i> , <i>M.bovis</i> , <i>M.avium</i> та <i>M.marinum</i> . При цьому енантіомер (S, R)-6-бром-[2-(діметиламіно)етил]-2-метоксі-1-нафталеніл-феніл-3-хінолінетанол відповідає сполуці 12 (енантіомер A1) у WO2004/011436 і є бажаною сполукою для лікування мікобактеріальних захворювань, зокрема туберкульозу. Таким чином, об'єктом патентування є новий спосіб виділення бедаквіліну із суміші стереоізомерних форм 6-бром-[2-(діметиламіно)етил]-2-метоксі-1-нафталеніл-феніл-3-хінолінетанолу, який може застосовуватися в промислових масштабах і давати високий відсоток виходу. Згадувана у п. 46 формули винаходу UA 92484 сіль є проміжною сполукою у технологічному процесі виділення бедаквіліну із суміші стереоізомерних форм 6-бром--[2-(діметиламіно)етил]-2-метоксі-1-нафталеніл-феніл-3-хінолінетанолу.

## ДЕЛАМАНІД

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
38	UA 83200 «СПОЛУКА 2,3-ДІГІ-ДРО-6-НІТРОІМІДАЗО[2,1-b]ОКСАЗОЛУ» / 10.10.2003	Ні	Сполуки, які є об'єктом патентування, не підпадають під загальну структуру формули Маркуша аналогів та прототипів. Конкретні сполуки за патентом України на винахід № 83200 не відомі як такі, що раніше були спеціально отримані та досліджені. Об'єктом патентування є: - зазначені вище сполуки, їх оптичні активні форми (ізомери); - фармацевтичні композиції на їх основі; - способи отримання згадуваних сполук. Фармацевтичні композиції за патентом базуються на нових, раніше спеціально не отриманих та не досліджених речовинах, їх оптичних активних формах (ізомерах) та їх фармацевтично придатних солях.
39	UA 95251 «ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО МІСТИТЬ ПОХІДНІ 2,3-ДИГІДРО-6-НІТРОІМІДАЗО[2,1-b]ОКСАЗОЛУ» / 19.07.2006	Ні	Об'єктами винаходу є фармацевтична композиція, що містить похідні 2,3-дигідро-6-нітроїмідазо[2,1-b]оксазолу. Відомо, що 2,3-дигідро-6-нітро[2,1-b]оксазолні сполуки, представлені нижченаведеною загальною формулою (1), їх оптично активні ізомери та їх фармацевтично прийнятні солі проявляють чудову бактерицидну дію проти туберкульозної мікробактерії, мультирезистентної туберкульозної мікробактерії й атипової кислотостійкої бактерії (див. публікацію не минулої експертизи заявки на патент Японії №2004-149527 і WO 2005-042542). Технічним результатом винаходу UA 95251 є створення фармацевтичної композиції з поліпшеною розчинністю у воді представленої у формулі винаходу оксазолної сполуки. Водночас фармацевтичні властивості композиції порівняно з аналогами залишаються незмінними. Таким чином, об'єктом патентування є композиція, відмінна від раніше відомої композиції за складом допоміжних інгредієнтів, що приводить до нових властивостей щодо розчинності у воді.

/ПРЕПАРАТИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ  
ВІРУСНИХ ГЕПАТИТІВ

## СОФОСБУВІР / ЛЕДІПАСВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
40	UA 108610 «АНТИВІРУСНІ СПОЛУКИ ТА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО МІСТИТЬ ЦІ АНТИВІРУСНІ СПОЛУКИ» / 12.05.2010	Ні	Сполуки за патентом України на винахід № 108610 не відомі як такі, що були спеціально отримані та досліджені раніше за дату подання заявки та дату пріоритету. Вони також не підпадають під загальну формулу Маркуша, яка б була відома раніше за дату подання заявки та дату пріоритету. Також не були відомі фармацевтичні композиції на їх основі.

## СОФОСБУВІР/ВЕЛПАТАСВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
41	UA 110354 «ПРОТИВІРУСНІ СПОЛУКИ» / 16.11.2012	Так	Об'єктами винаходу є раніше не отримані й не досліджені сполуки, їх солі, фармацевтичні композиції на їх основі та способи лікування. Сполуки відповідно до даного винаходу підпадають під загальну формулу Маркуша винаходу за патентом України № 108610, яка була відома раніше за дату подання заявки та дату пріоритету, але не були відомі як такі, що були спеціально отримані та досліджені раніше за дату подання заявки та дату пріоритету. Також не були відомі фармацевтичні композиції на їх основі. Основний технічний результат із позиції фармакологічних властивостей є такий самий, як і у винаходу за патентом України 108610: отримання нових сполук для застосування у профілактичному або терапевтичному лікуванні гепатиту С або порушення, пов'язаного з гепатитом С. Водночас в окремих випадках нові сполуки відрізняються від раніше відомих за формулою Маркуша однотипними замісниками в межах однієї групи (класу).

## ГЛЕКАПРИВІР/ПІБРЕНТАСВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
42	UA 113048 «ПРОТИВІРУСНІ СПОЛУКИ» / 12.10.2011	Ні	Об'єктами винаходу є раніше не отримана і не досліджена сполука, її солі, та фармацевтична композиції на їх основі. Сполуки відповідно до даного винаходу не підпадають під загальну формулу Маркуша, яка була би відома раніше за дату подання заявки та дату пріоритету, та не відомі як такі, що були спеціально отримані та дослідженні раніше за дату подання заявки та дату пріоритету. Фармацевтичні композиції за патентом базуються на нових, раніше спеціально не отриманих та не досліджених речовинах, їх фармацевтично придатних солях.

## ПАРІТАПРЕВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
43	UA 103054 «МАКРОЦИКЛІЧНІ ІНГІБІТОРИ СЕРІНОВИХ ПРОТЕАЗ ГЕПАТИТУ С» / 10.09.2009	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є: - низькомолекулярні сполуки або їх фармацевтично прийнятні солі, які характеризуються якісним та кількісним складом, зв'язком між атомами та взаємним розташуванням їх у молекулі відповідно до родової хімічної структурної формули (I) або (I'), окремим випадком яких є парітапревір, та оснований на використанні сполук (I) або (I'): - фармацевтичні композиції, які характеризуються якісним складом інгредієнтів; - спосіб лікування вірусної інфекції, викликаної гепатитом С в індивідуума, та - способи одержання сполуки формули I або її фармацевтично прийнятної солі. Сполуки (I) або (I') не є такими, що спеціально описані раніше, їх терапевтична активність не є відомою, і способи їх отримання не є відомими, про що свідчить звіт про міжнародний пошук за заявою PCT/US2009/005082, навіть з огляду на те, що сполуки, схожі за структурою та терапевтичним ефектом, були описані раніше у заявці WO 2004/093798 A2 від 04.11.2004 (ENANTA PHARMACEUTICALS, INC.). Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
44	UA 109532 «МАКРОЦИКЛІЧНІ ІНГІБІТОРИ СЕРІНОВИХ ПРОТЕАЗ ГЕПАТИТУ С» / 10.09.2009	Ні	Патент отриманий за заявою, виділеною із заявки на патент, та захищає сполуки або їх фармацевтично прийнятну сіль для лікування інфекції HCV у пацієнта, охарактеризовані конкретними структурними формулами, які відповідають сполукам, наведеним у заявці PCT/US2009/005082, а саме: - п. 1 формули винаходу за патентом → сполука (25) заявки PCT/US2009/005082, - п. 2 формули винаходу за патентом → сполука (28); - п. 3 формули винаходу за патентом → сполука (29); - п. 4 формули винаходу за патентом → сполука (30); - п. 5 формули винаходу за патентом → сполука (32); - п. 6 формули винаходу за патентом → сполука (36); - п. 7 формули винаходу за патентом → сполука (19). Враховуючи висновок за патентом, ці сполуки не були раніше описані та їх терапевтична активність не була відомою на дату подання заявки. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
45	UA 104517 «ТВЕРДА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО Є КОРИСНОЮ В ЛІКУВАННІ ІНФЕКЦІЇ ВІРУСУ ГЕПАТИТУ С, ТА СПОСОБИ ЇЇ ОДЕРЖАННЯ» / 08.03.2011	Так	Об'єктом винаходу за патентом є: - композиція у твердій формі, яка містить сполуку парітапревір або її фармацевтично прийнятну сіль у аморфній формі (тверда дисперсія), гідрофільний полімер та поверхнево-активну речовину (ПАВ) для зменшення поверхневого натягу води, тобто характеризується тільки якісним складом та структурою; - зазначена композиція + рітонавір, та - спосіб отримання зазначеної композиції, що полягає у висушуванні розчинника в рідкому розчині або отвердженні розплаву, який містить зазначені сполуку парітапревір, полімер та ПАВ. Сполука парітапревіру, зазначена у патенті, була описана, зокрема і в твердій формі, у заявці PCT/US2009/005082 від 10.09.2009 (сполука (29) у описі та формулі винаходу), на підставі якої було отримано вищезазначені патенти. Технічний результат при застосуванні сполук за патентами є однаковим – лікування інфекції вірусу гепатиту С. Патент захищає фармацевтичну композицію, яка є конкретною лікарською формою описаної раніше композиції, тому може бути віднесений до категорії «вічнозелених патентів», навіть з огляду на те, що способи отримання такої композиції раніше не були описані. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## ОМБІТАСВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
46	UA 103052 «ПРОТИВІРУСНІ СПОЛУКИ» / 10.06.2010	Ні	Згідно формули винаходу (далі – «формула») патент захищає три високомолекулярні противірусні сполуки загальної структури: - сполука за пунктом 1 формули (відповідає сполуці за прикладом 1 із публікації міжнародної заявки WO2010/144646 A2); - сполука за пунктом 3 формули (відповідає 1-й сполуці за прикладом 34 із публікації міжнародної заявки WO2010/144646 A2); - сполука за пунктом 5 формули (відповідає 2-й сполуці за прикладом 34 із публікації міжнародної заявки WO2010/144646 A2) та - фармацевтичні сполуки на їх основі або на основі їх фармацевтично прийнятних солей (пункти 2, 4, 6 формули). Зазначені сполуки є новими і не описані раніше як спеціально отримані, тобто не є відомими з рівня техніки. Від відомих з рівня техніки найближчих сполук, наприклад, сполуки, відомої з JP2007/320925, зазначені сполуки відрізняються наявністю піролідинів та складних ефірів по обидва боки від бензольного ядра, пептидних зв'язків та амінокислот (пролін, валін). При цьому рівень техніки не містить інформації, яка може свідчити про очевидність таких відмінностей. Винахід містить інформацію про наявність антивірусної активності зазначених сполук, отриману при визначенні EC50 (напівмаксимальна ефективна концентрація) шляхом тестування з використанням HCV-аналізу з репліконом 1b-con1 у присутності 5%FBS (фетальної бичої сироватки). Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
47	UA 108904 «ПРОТИВІРУСНІ СПОЛУКИ» / 10.06.2010	Ні	Патент отриманий за заявкою, виділеною із заявки на попередній патент, та захищає сполуки загальної формули Ів, зазначеної у описі винаходу. Зазначені сполуки є новими і не описані раніше як спеціально отримані, зокрема, не є відомими з документів WO2008021936 та WO2010017401, що є найближчими з рівня техніки. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
48	UA 105434 «ТВЕРДА КОМПОЗИЦІЯ ТА СПОСІБ ЛІКУВАННЯ ВІРУСУ ГЕПАТИТУ С» / 09.06.2011	Так	Патент захищає препарат проти HCV у формі твердої композиції, яка містить одне з чотирьох похідних піролідину в аморфній формі (замісники OMBITASVIR), а також фармацевтично прийнятний гідрофільний полімер та необов'язково фармацевтично прийнятну поверхнево-активну речовину та спосіб отримання зазначеної композиції. Композиція охарактеризована якісним складом та структурою композиції, а також структурою інгредієнтів: сполуки формул ІА, ІВ, ІС або ІD або їх фармацевтично прийнятні солі, що мають противірусну активність. Зазначені сполуки описані у міжнародній заявці WO2010/144646 А2, на базі якої було отримано два вищенаведені патенти. Противірусна активність сполуки формул ІА, ІВ, ІС або ІD аналогічна описаній у міжнародній заявці WO2010/144646 А2. Міжнародна заявка WO2010/144646 А2 була опублікована після дати подання заявки WO2011156578А2, на базі якої було отримано патент, і тому не входить до рівня техніки для винаходу за патентом. Тобто патент захищає конкретну форму застосування сполук, раніше описаних у заявці WO2010/144646 А2. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
49	UA 118080 «ПРОТИВІРУСНІ СПОЛУКИ» /10.06.2010	Yes	Об'єктом патенту є індивідуальна хімічна сполука, охарактеризована загальною структурною формулою Маркуша, за якою ідентифіковано основну сполуку омбітасвіру (сполука формули ІВ) або її фармацевтично прийнятну сіль. Сполука є NSSA-інгібітором реплікації вірусу гепатиту С. Не знайдено відомостей, що зазначена хімічна сполука формули ІВ підпадає під загальну формулу Маркуша раніше поданої заявки, та що вона раніше описана як спеціально отримана. При цьому в описі до патенту міститься підтвердження поліпшення противірусної дії сполуки формули ІВ. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

## ДАСАБУВІР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
50	UA 117800 «ПОХІДНІ УРАЦИЛУ АБО ТИМІНУ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ГЕПАТИТУ С» / 17.09.2008	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є індивідуальна хімічна комплексна сполука або її сіль, охарактеризована якісним та кількісним складом у вигляді молекулярної формули, за якою ідентифіковано конкретну сполуку дасабувіра згідно з одним із її варіантів. Сполука призначена для гальмування реплікації вірусу гепатиту С. Іншими об'єктами патенту UA 117800 є фармацевтична композиція на основі зазначеної сполуки, а також конкретна кристалічна форма дасабувіру. Не знайдено відомостей, що зазначена хімічна сполука підпадає під загальну формулу Маркуша раніше поданої заявки, та що вона раніше описана як спеціально отримана (Публікація WO2009039127 міжнародної заявки «URACIL OR THYMINE DERIVATIVE FOR TREATING HEPATITIS C», International Preliminary Report on Patentability, стор. 3, <a href="https://bit.ly/2YVNMqMa">https://bit.ly/2YVNMqMa</a> ). Патент є виділеним з раніше виданого патенту UA104995 і повторює його в меншому обсязі для додаткового захисту DASABUVIR в тій формі, в якій він повинен бути використаний в лікувальних комбінаціях. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
51	UA 115025 «СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ПРОТИВІРУСНИХ СПОЛУК» / 15.07.2011	Так	Об'єктом винаходу за патентом є спосіб отримання сполуки за патентом або її солі, тобто патент на відому сполуку (описану, наприклад, у публікації WO2009039127), охарактеризовану способом її отримання (product by process). Процес отримання сполуки за патентом відрізняється від процесу, описаного у WO2009039127. Технічним результатом у патенті є отримання композиції з відсутніми побічними ефектами, проте порівняно з інтерфероном або рибавірином, а не порівняно зі способом, описаним у WO2009039127, тобто технічний результат не відрізняється від зазначеного у WO2009039127. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
52	UA 113498 «ФОСФІНОВІ ЛІГАНДИ ДЛЯ КАТАЛІТИЧНИХ РЕАКЦІЙ» / 15.07.2011	Так	Об'єктом винаходу за патентом є сполуки (фосфінові ліганди) або їх солі, що використовуються у каталітичних реакціях у складі каталітичних комплексів, зокрема, і для отримання дасабувіру. Сполуки охарактеризовані загальною структурною формулою (I), яка раніше описана як спеціально отримана, а також відоме її застосування в органічних реакціях з утворення зв'язку C-C, C-O, C-N. Винахідницький рівень і новий технічний результат не підтверджені в описі до патенту. Тому патент захищає дасабувір через процес його отримання, описаний у відомих джерелах (Публікація WO2012009698 міжнародної заявки «PHOSPHINE LIGANDS FOR CATALYTIC REACTIONS», International Preliminary Report on Patentability, стор. 9, <a href="https://bit.ly/2UJYnj">https://bit.ly/2UJYnj</a> ). Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## ПЕГІНТЕРФЕРОН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
53	UA 56989 «ФІЗІОЛОГІЧНО АКТИВНИЙ ПЕГ-КОН'ЮГАТ $\alpha$ -ІНТЕРФЕРОНУ, СПОСІБ ЙОГО ОДЕРЖАННЯ, ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ НА ЙОГО ОСНОВІ ТА СПОСІБ ЛІКУВАННЯ АБО ПРОФІЛАКТИКИ ІМУНОМОДУЛЯТОРНИХ ЗАХВОРОЯВАНЬ» / 30.05.1997	Так	Об'єктом винаходу є специфічна розгалужена структура кон'югату пегінтерферону, фізіологічно активного пегільованого кон'югату $\alpha$ -інтерферону з поліетиленгіколем (ПЕГ) з визначеними межами середньої молекулярної маси молекули ПЕГ у зазначеному кон'югаті. Перевагою винаходу є збільшення циркуляції та часу напівжиття і плазми перебування, скорочення імуногенності, зниження кліренсу і підвищення антипроліферативної активності порівняно з немодифікованим $\alpha$ -інтерфероном і збільшення антипроліферативної активності й практично зникнення імуногенності порівняно з іншими пегільованими кон'югантами $\alpha$ -інтерферону. Для винаходу використано звичайні методи пегілювання інтерферону, який є попередньою версією сполуки, і отримано передбачувані результати, що робить його очевидним для фахівця в даній області та не обіцяє підвищення ефективності сполуки порівняно з непегільованою версією (Roche's Indian patent on Pegasys® revoked, 10.4155/PPA.12.89 © 2013 Future Science Ltd Pharm. Pat. Analyst (2013) 2(1), 13-16, <a href="https://www.future-science.com/doi/pdf/10.4155/ppa.12.89">https://www.future-science.com/doi/pdf/10.4155/ppa.12.89</a> ). Винахід описує модифіковану відомим способом форму відомої раніше сполуки, яка має певні переваги у зменшенні ниркового кліренсу та значному збільшенні періоду напіввиведення, проте не має підвищення ефективності у лікуванні гепатитів. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».



# /ПРЕПАРАТИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ОНКОЛОГІЧНИХ ЗАХВОРЮВАНЬ

## ТРАСТУЗУМАБ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
54	UA 92913 «ЕКСПРЕСІЙНИЙ ВЕКТОР ТА СПОСОБИ ПРОДУКУВАННЯ ВИСОКИХ РІВНІВ БІЛКІВ» / 19.06.2006	Ні	Патент захищає індивідуальні сполуки, що належать до об'єктів генетичної інженерії, які характеризуються послідовністю ДНК, та їх застосування для отримання високої експресії білків та моноклональних антитіл, зокрема, яким є трастузумаб до рецептора HER2, використовуваних у рекомбінантних біологічних препаратах. Завданням винаходу є створення вектору експресії генів еукаріотів, який забезпечує підвищення вираженості білку в трансфікованих таким вектором клітинах-господарях і тим самим робить біопрепарати на основі моноклональних антитіл більш доступними. Підвищення експресії гену еритропоєтину (EPO) та злитого білку (TNFR-IgGFc) при використанні вектору за винаходом підтверджується описом. Використання промотору CMV не є відомим і не є очевидним з урахуванням рівня техніки. Винахід направлений на отримання вектору експресії переліку біопрепаратів, альтернативний відомим аналогам, і надає переваги порівняно з ними. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
55	UA 102166 «КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ ПІДШКІРНОГО ВВЕДЕННЯ, ЯКА МІСТИТЬ АНТИТІЛО ДО HER2» / 28.07.2010	Так	Патент захищає фармацевтичну композицію моноклонального антитіла до рецептора HER2 (трастузумаб), застосування такої композиції для лікування раку шлунку, метастатичного раку молочної залози або раннього раку молочної залози, пристрій для ін'єкції зазначеної композиції і набір, який містить пляшечки з композицією та пристрій. Композиція характеризується структурою та якісним і кількісним складом інгредієнтів: антитіла до HER2 (трастузумаб), забуферювального агента, стабілізатору, ПАР та ферменту гуалуронідазу, відомого як регулятор дифузійного транспорту речовин між кров'ю, лімфою і клітинами тканин. При цьому антитіло до HER2 (трастузумаб) вже є відомим і розкритим, зокрема, у заявці W08906692, опублікованій 27.07.1989 (ДЖЕНЕНТЕК, ІНК., як підрозділ Ф. ХОФФМАНН-ЛЯ РОШ АГ), де також згадані й композиції на основі цього антитіла для інгібування росту пухлинних клітин, таких як карцинома, зокрема, карцинома молочної залози людини, нирок, шлунку і слинних залоз людини або інших типів пухлинних клітин, що експресують рецептор HER2. Тобто винахід захищає фармацевтичну композицію, відмінну від раніше відомої композиції лише дозуванням та якісним складом допоміжних стандартних інгредієнтів. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
56	UA 104254 «КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ ПІДШКІРНОГО ВВЕДЕННЯ, ЯКА МІСТИТЬ АНТИТІЛО ДО HER2» / 28.07.2010	Так	Патент отриманий за заявкою, виділеною із заявки на інший патент щодо даного препарату. Як і попередній патент, даний патент захищає композицію, що характеризується структурою та якісним і кількісним складом інгредієнтів: антитіла до HER2, забуферювального агента, стабілізатору та ПАР. Композиція відповідно до формули винаходу відрізняється від композиції за попереднім патентом тільки відсутністю ферменту гуалуронідазу та чітким визначенням трастузумаба, пертузумаба або T-DM1 (трастузумаб ентанзин) в якості антитіла до HER2. Тобто, винахід за даним патентом, аналогічно із попереднім патентом, захищає фармацевтичну композицію, відмінну від описаної раніше композиції лише дозуванням та якісним складом допоміжних стандартних інгредієнтів. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
57	UA 108832 «КОМБІНАЦІЯ КОН'ЮГАТА АНТИ-HER2-АНТИТІЛО-ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ І ХІМІО-ТЕРАПЕВТИЧНИХ ЗАСОБІВ І СПОСОБИ ЗАСТОСУВАННЯ» / 10.03.2009	Так	Патент захищає спосіб лікування гіперпроліферативного порушення, яким є, зокрема, злоякісна пухлина, яка експресує ErbB2, шляхом введення терапевтичної комбінації трастузумабу-МСС-DM1 та хіміотерапевтичного засобу, вибраного з GDC-0941 (піктілісіб) та GNE-390 (апітолісіб). Залежні пункти формули винаходу стосуються певних форм та послідовностей введення зазначеної терапевтичної комбінації та фармацевтичної композиції, яка містить зазначену комбінацію та стандартні допоміжні речовини (фармацевтично прийнятні носії, регулятори сипкості, розріджувачі або наповнювачі). Опис винаходу декларує синергетичний ефект від використання саме комбінації вказаних моноклонального антитіла та хіміотерапевтичного засобу, який полягає у пригніченні росту пухлинних клітин в умовах in vitro та in vivo, проілюстрованих результатами кількісного аналізу за принципом медіанного ефекту Chou&Talalay та ізоболограмами, за допомогою яких визначають значення комбінаційного індексу (CI) для встановлення синергізму, антагонізму або адитивного ефекту. Згадана первинна заявка W08906692 (ДЖЕНЕНТЕК, ІНК., як підрозділ Ф. ХОФФМАНН-ЛЯ РОШ АГ) на трастузумаб також містить інформацію про можливість синергетичного ефекту при комбінації його з хіміотерапевтичними засобами. При цьому патент не розкриває вперше жодну з речовин, і вони є відомими раніше. Тобто фармацевтична композиція за патентом є новою комбінацією відомих раніше активних речовин. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## РИТУКСИМАБ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
58	UA 27946 «СПОСІБ ЛІКУВАННЯ ЛІМФОМИ В-КЛІТИН, ІМУНОЛОГІЧНО АКТИВНЕ ХИМЕРНЕ АНТИТІЛО АНТИ-CD20» / 12.11.1993	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є імунологічно активне химерне антитіло анти-CD20, що виробляється трансфектомою, яка включає анти-CD20 у векторі TCAE8 з депозитним номером 69119 АТСС, а також спосіб лікування лімфоми В-клітин з використанням зазначеного антитіла. Антитіло виражене через гібридому – штучну гібридну клітинну лінію, створену для отримання моноклональних антитіл у великих кількостях шляхом злиття В-лімфоцитів людини і клітин меланоми. Винахід не обмежується захистом тільки ритуксимабу та розповсюджується на інші речовини, молекули яких мають антитіла анти-CD20, наприклад, ibritumomab tiuxetan. Патент UA 27946 відноситься до «first-generation patent family» (Ulrich Storz, Rituximab How approval history is reflected by a corresponding patent filing strategy, <a href="https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC4171018/">https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC4171018/</a> ) відносно ритуксимабу, тому не може бути віднесений до «вічнозелених» патентів. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.



#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
59	<b>UA 91961</b> «ЛІКУВАННЯ АУТОІМУННИХ ЗАХВОРЮВАНЬ У ПАЦІЄНТА З НЕАДЕКВАТНОЮ ВІДПОВІДДЮ НА ІНГІБІТОР TNF-АЛЬФА» / 06.04.2004	Так	Об'єктом винаходу за патентом є спосіб лікування ревматоїдного артриту з використанням ритуксимабу за визначеним дозуванням. Об'єкт охарактеризований застосуванням відомої раніше речовини (молекули з антитіла, яке зв'язується із CD20 і яке, будучи зв'язаним із CD20, знищує або зменшує В-клітини в організмі ссавця), відмінною від відомого лише дозуванням. Кореспондуючий патент EP1613350 є відкликаним внаслідок апеляції. Патент UA 91961 належить до «secondary patent» і є типовим представником «вічнозелених» патентів, у яких сумнівним є ще й їхня патентоздатність Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
60	<b>UA 92913</b> «ЕКСПРЕСІЙНИЙ ВЕКТОР ТА СПОСОБИ ПРОДУКУВАННЯ ВИСОКИХ РІВНІВ БІЛКІВ» / 09.06.2011	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є індивідуальні сполуки, що належать до об'єктів генетичної інженерії, які характеризуються послідовністю ДНК, та їх застосування для отримання високої експресії білків та моноклональних антитіл (зокрема, яким є ритуксимаб відносно TNFR-IgGfс), використовуваних у рекомбінантних біологічних препаратах. Завданням винаходу є створення вектору експресії генів еукаріотів, який забезпечує підвищення вираженості білку в трансфікованих таким вектором клітинах-господарях і тим самим робить біопрепарати на основі моноклональних антитіл більш доступними. Підвищення експресії гену еритропоєтину (EPO) та злитого білку (TNFR-IgGfс) при використанні вектору за винаходом підтверджується описом. Використання промотору CMV не є відомим і не є очевидним з урахування рівня техніки. Винахід направлений на отримання вектору експресії переліку біопрепаратів, який альтернативний відомим і надає переваги порівняно з ними, тому винахід не може бути віднесений до «вічнозелених» патентів. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
61	<b>UA 94726</b> «СПОСІБ ЛІКУВАННЯ УШКОДЖЕННЯ СУГЛОБІВ» / 14.11.2006	Так	Об'єктом винаходу за патентом є спосіб лікування ушкодження суглоба в індивіда з ревматоїдним артритом (RA) із використанням ритуксимабу, який відрізняється від відомого додатковим курсом лікування ритуксимабом з певним дозуванням та періодичністю. Із погляду віднесення до «вічнозелених» патентів цей патент – повний аналог патенту UA 92913 і стосується дозування відомої раніше речовини під час лікування. Кореспондуючий патент EP1951304 є виданим, проте на даний момент ЕПВ розглядає опозицію щодо даного патенту. Патент UA 94726 належить до «secondary patent» і є типовим представником «вічнозелених» патентів. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
62	<b>UA 99933</b> «ЛІКУВАННЯ АУТОІМУННИХ ЗАХВОРЮВАНЬ У ПАЦІЄНТА З НЕАДЕКВАТНОЮ ВІДПОВІДДЮ НА ІНГІБІТОР TNF-АЛЬФА» / 06.04.2004	Так	Об'єктом винаходу за патентом є застосування ритуксимабу для приготування лікарського засобу і характеризується дозами та послідовністю введення ритуксимабу та додатковим введенням метотрексату (аметоптерин, синтетичний лікарський препарат, аналог фолієвої кислоти, який належить до групи імуносупресантів та цитостатиків). Тобто патент стосується дозування відомої раніше речовини під час лікування та її комбінації з іншими відомими речовинами з відомим ефектом для отримання розкритої раніше сприятливої клінічної відповіді. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
63	<b>UA 104579</b> «СПОСІБ ЛІКУВАННЯ РАКУ КРОВОТВОРНОЇ СИСТЕМИ ІЗ ЗАСТОСУВАННЯМ ФОРОДЕЗИНУ В КОМБІНАЦІЇ З РИТУКСИМАБОМ» / 10.12.2008	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є спосіб лікування раку кровотворної системи з використанням ритуксимабу та фородезину (інгібітор пуринонуклеозидфосфорилази, сполука, яка блокує один із ферментів, відповідальний за розвиток Т-клітинних неоплазій, ВСХ-1777), а також фармацевтична композиція і комплект для доставки ритуксимабу та фородезину суб'єкту, якого лікують (Alonso R., Forodesine has high antitumor activity in chronic lymphocytic leukemia and activates p53-independent mitochondrial apoptosis by induction of p73 and BIM, <a href="https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/19541822">https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/19541822</a> ). Винахід передбачає отримання синергетичного ефекту від застосування інгібітору PNP (фородезин) разом з агентом проти CD20 (ритуксимаб), який може бути продемонстрований через розвиток комбінаційного індексу (CI), оцінку коефіцієнтної взаємодії для різних пропорцій відмирання клітин. Тобто об'єктом винаходу є фармацевтична композиція з новою комбінацією відомих раніше активних речовин, проте їх синергетичний ефект від сумісного застосування є невідомим раніше при лікуванні лейкемії і спеціально не описаний. При цьому об'єм прав за патентом обмежений обов'язковим поєднанням ритуксимабу та фородезину та сферою застосування такої комбінації – для лікування лейкемії. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
64	<b>UA 104909</b> «ВИСОКОКОНЦЕНТРОВАНА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО МІСТИТЬ АНТИТІЛО ДО CD20» / 10.09.2010	Так	Об'єктом винаходу за патентом є фармацевтична композиція, яка містить ритуксимаб як активний інгредієнт з антитілом до CD20 та відомі фармацевтично прийнятні речовини (буфер, стібілізатор, ПАВ, фермент глікозаміногліканазу для збільшення інтерстиціального простору та, відповідно, обсягу та терапевтичної дози, яка є безпечною та яку зручно вводити підшкірно), а також застосування такої композиції для лікування захворювання або порушення, яке можна лікувати за допомогою антитіла до CD20, переважно раку або незлоякісного захворювання. Патент UA 104909 захищає відому фармацевтичну композицію з відомими інгредієнтами, які застосовані за своїм прямим значенням, і відрізняється від раніше відомого тільки дозуванням, тобто концентрацією інгредієнтів. Також самим заявником розкрито і ефективність застосування композиції для лікування зазначених вище захворювань. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## КАПЕЦИТАБІН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
65	<b>UA 39158</b> «ПОХІДНІ N4-ОКСИКАРБОНІЛ-5'-ДЕЗОКСИ-5-ФТОРЦИТИДИНУ ТА ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ ПРЕПАРАТ НА ЇХ ОСНОВІ» / 17.12.1993	Ні	Патент отриманий із пріоритетом по заявці EP19920121538 від 18.12.1992, яка разом із заявкою EP19870116926 від 17.11.1987 захищає хімічну сполуку капецитабіну, яка раніше не була описана або отримана. Патенти США, отримані за вказаними заявками, зазначені Food and Drug Administration як первинні патенти, які відповідають препарату XELODA (Capecitabine). Сполука є проліками відомого протипухлинного засобу 5-фторурацила, які ферментативно перетворюються на 5-фторурацил у пухлині та пригнічують її ріст. Тобто патент UA 39158 описує нову сполуку, яка не є відомою з іншої заявки, тому патент UA 39158 не належить до категорії «вічнозелених» патентів. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

## ПЕМБРОЛІЗУМАБ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
66	UA 118453 «СПОСІБ ЛІКУВАННЯ ПУХЛИН У ПАЦІЄНТА» / 18.08.2014	Так	Об'єктом винаходу за патентом є: - спосіб лікування пухлини у пацієнта; - фармацевтична комбінація для цього, яка базуються на застосуванні комбінації двох відомих раніше моноклональних антитіл: антагоніста PD-1 (МК-3475, Pembrolizumab) та агоніста GITR (TRX518 компанії Leap Therapeutics®, або TRX518 компанії Tolerx®). Pembrolizumab захищений більш ранніми патентами, наприклад, US8,168,757B2 від 01.05.2012 або US8,354,509B2 від 15.01.2013. Тобто фармацевтична композиція, на якій базується винахід за патентом UA 118453, є новою комбінацією відомих раніше антитіл. Також відома їх терапевтична протипухлинна дія. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## БЕНДАМУСТИН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
67	UA 94036 «ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ БЕНДАМУСТИНУ, ПРИЗНАЧЕНА ДЛЯ ЛІОФІЛІЗАЦІЇ» / 13.01.2006	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є спосіб виробництва ліофілизованого препарату бендамустину, преліофілізаційний розчин або дисперсія бендамустину, ліофілізований порошок, склад для ліофілізації, преліофілізована фармацевтична композиції бендамустину та ліофілізований препарат бендамустин. Сполука бендамустину в якості протипухлинного агенту була розроблена іншою компанією, ніж СЕФАЛОН, ІНК. (власник патенту UA 94036). Компанія СЕФАЛОН є компанією, якою виведено бендамустин на ринок США під торгівельною маркою Treanda у 2008 році. Відомо, що бендамустин отримують у вигляді готового продукту шляхом ліофілізації, що забезпечує його кращу стабільність і довготривале зберігання. Тому патент UA 94036 захищає один з багатьох процесів ліофілізації бендамустину, складники цього процесу та результати застосування процесу у вигляді готового продукту. Проте такий спосіб ліофілізації бендамустину не є єдиним, і патентом UA 94036 захищено процес, який використовує саме СЕФАЛОН. Тому UA 94036 не належить до категорії «вічнозелених» патентів, а захищає продукт конкретної компанії наряду з аналогічними продуктами інших компаній. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
68	UA 102120 «ПЕРОРАЛЬНА ФОРМА ДОЗУВАННЯ БЕНДАМУСТИНУ» / 03.12.2009	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є бендамустин у складі конкретної фармацевтичної композиції, яка охарактеризована структурою та якісним складом інгредієнтів. Фармацевтична композиція відрізняється від відомих раніше застосуванням фармацевтично прийнятого наповнювача, яким є фармацевтично прийнятний неіонний сурфактант, вибраний з групи: макрогіль-гліцерин-гідроксистеарат, поліоксил-35-рицинова олія та блок-кополімер етилен-оксиду/пропілен-оксид (Pluronic® L44 NF або Poloxamer® 124), що дозволяє отримати поліпшений профіль розчинення. Тобто фармацевтична композиція за патентом є новою комбінацією відомих раніше активних речовин і захищає конкретне рішення для отримання поліпшеного профілю розчинення бендамустину, яке не застосовують інші виробники бендамустину або препаратів на його основі. Тому UA 102120 не належить до категорії «вічнозелених» патентів, а захищає продукт конкретної компанії наряду з аналогічними продуктами інших компаній. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

## НІЛОТИНІБ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
69	UA 94234 «КРИСТАЛІЧНА ФОРМА 4-МЕТИЛ-Н-[3-(4-МЕТИЛІМІДАЗОЛ-1-ІЛ)-5-ТРИФТОРМЕТИЛФЕНІЛ]-3-(4-ПІРИДИН-3-ІЛПІРИМІДИН-2-ІЛАМІНО)-БЕНЗАМІДУ» / 18.07.2006	Так	Об'єктом винаходу за патентом є індивідуальна хімічна сполука нілотинібу, охарактеризована взаємним розташуванням атомів, вираженим у вигляді параметрів кристалічної форми вільної основи, гідрохлориду та сульфату нілотинібу. Первинною заявкою на сполуку нілотинібу є заявка WO2004005281 із пріоритетом від 05.07.2002, за якою в Україні патент не отримано. Кристалічні форми за патентом UA 94234 не описані у заявці WO2004005281 як спеціально отримані, проте в описі WO2004005281 наведено приклади отримання сполуки нілотинібу саме в кристалічній формі і зазначено параметри її отримання (температура, тиск та інше потрібне). Технічним результатом винаходу за патентом UA 94234 є отримання кристалічних форм нілотинібу для більш активного, більш стабільного або більш дешевого у виробництві лікарського засобу, проте патент UA 94234 не містить доказів досягнення такого результату порівняно з іншими кристалічними формами нілотинібу. Це свідчить про те, що патентом UA 94234 захищено ті ж самі форми нілотинібу, що і у первинній заявці WO2004005281, проте охарактеризовано параметрами, які у первинній заявці не розкриті. Тобто об'єктом патенту UA 94234 є поліморфна форма відомої раніше сполуки нілотинібу, яка, зокрема, є результатом перекристалізації раніше відомої сполуки у більш стабільний поліморф. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## ТРИПТОРЕЛІН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
70	UA 99830 «ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ З ПРОЛОНГОВАНИМ ВИВІЛЬНЕННЯМ, ВИГОТОВЛЕНА З МІКРОЧАСТИНОК» / 06.06.2008	Ні	Об'єктом винаходу є фармацевтична композиція, виготовлена з мікрочастинок, для пролонгованого вивільнення агоніста LHRH. Така композиція містить співполімер молочної та гліколевої кислот (PLGA), що включає як діючу речовину водонерозчинну пептидну сіль і розкрита у патенті Швейцарії CH 679207 A5. Технічним результатом винаходу UA 99830 є забезпечення тривалого та ефективного вповільненого вивільнення діючої речовини протягом періоду, що охоплює щонайменше 6-й місяць після ін'єкції композиції. Отже, об'єктом патентування є фармацевтичні композиції на основі відомої діючої речовини, але з іншими фізико-хімічними параметрами, які досягаються завдяки розподілу мікрочастинок за розміром.

## МЕЛФАЛАН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
71	UA 107069 «ПРОТИПУХЛИННІ КОМБІНАЦІЇ, ЩО МІСТЯТЬ МЕЛФАЛАН І АНТИТІЛА, ЯКІ СПЕЦИФІЧНО РОЗПІЗНАЮТЬ CD38» / 17.09.2008	Так	Об'єктом винаходу за патентом є фармацевтична комбінація, яка містить гуманізоване антитіло, що специфічно розпізнає CD38, та мелфалан, а також застосування вказаного антитіла для лікування неопластичних захворювань, таких як рак/пухлина (лімфома, мієлома, карцинома тощо) за рахунок здатності антитіла вбивати CD38+ клітини. Зазначена комбінація охарактеризована амінокислотними послідовностями легкого та важкого ланцюгів гуманізованого антитіла. Охарактеризоване такими послідовностями антитіло, що специфічно розпізнає CD38, а також його застосування для лікування раку/пухлин, зокрема і разом з мелфаланом або вінкристином, відоме з документів EP1914242 (SANOFI (FR)), WO2006099875, WO9962526. Тобто SANOFI було отримано патент EP1914242 (аналогічний в Україні – UA114879) з більш ранньою датою подання заявки (16.10.2007), який повністю описує фармацевтичну комбінацію за патентом UA 107069. Переваги застосування вказаного антитіла та мелфалану у вигляді фармацевтичної комбінації, тобто сумісного введення, замість застосування у формі композиції антитіла та мелфалану, як зазначено у більш ранньому патенті SANOFI, не підтверджені описом до патенту UA 107069. Мелфалан (Melphalan, Сарколізин) є відомим синтетичним лікарським препаратом ще з 1964 р. Фармацевтична комбінація за патентом UA 107069 є новою комбінацією відомих раніше активних речовин, без зазначення нового технічного результату. Висновок: є підстави відносити даний патент до «вічнозелених».

## КАСПОФУНГІН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
72	UA 55409 «ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ ВНУТРІШНЬОВЕННОГО ВВЕДЕННЯ, СПОСІБ ЇЇ ОДЕРЖАННЯ ТА СПОСІБ ЛІКУВАННЯ І/АБО ПРОФІЛАКТИКИ ГРИБКОВИХ ЗАХВОРЮВАНЬ (ВАРІАНТИ)» / 15.04.1997	Ні	Об'єктами винаходу є: - фармацевтична композиція на основі каспофунгіну; - спосіб лікування та/або профілактики грибкових інфекцій ссавців за допомогою вищезазначеної композиції; - спосіб одержання фармацевтичної композиції на основі каспофунгіну. Технічним результатом винаходу UA 55409 є композиції у вигляді безпечних, стабільних, ліофілізованих лікарських форм для перестворення, які особливо корисні для доставки антигрибкових засобів пацієнтам, які потребують цього. Такі композиції характеризуються більшою стабільністю, містять менше небажаних продуктів деградації при збільшеному терміні придатності. При цьому каспофунгін описаний у патенті США № 5 378 804. Альтернативні способи його отримання розкриті в патентах США № 5 378 804 та № 5 552 521. Отже, об'єктом патентування є фармацевтичні композиції на основі відомої діючої речовини, але з іншими фізико-хімічними параметрами, способи застосування таких композицій та створення.

## ЕВЕРОЛІМУС

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
73	UA 110961 «КОМБІНАЦІЯ ІНГІБІТОРУ ФОСФАТИДИЛНО-ЗИТ-3-КІНАЗИ (PI3K) І ІНГІБІТОРУ mTOR» / 23.04.2012	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є застосування фармацевтичної комбінації відомих активних сполук компанії NOVARTIS©: алпелісібу (розкритого у публікації WO 2010/029082) та інгібітору mTOR (еверолімум) для лікування раку та спосіб лікування раку. Опис містить дані про синергетичний ефект від використання саме комбінації зазначених сполук, який полягає у поліпшенні терапевтичного ефекту порівняно з монотерапією кожної із зазначених сполук. Поліпшення полягає у взаємодії цих сполук і кращому інгібуванні проліферації клітин, що дає можливість зменшити необхідну дозу кожної сполуки та приводить до зменшення побічних ефектів і збільшення тривалої клінічної ефективності сполук при лікуванні. При цьому патент не обмежує використання кожної із зазначених активних сполук, у тому числі й монотерапію еверолімумом. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
74	UA 118025 «МОДУЛЯТОР АНДРОГЕННИХ РЕЦЕПТОРІВ І ЙОГО ЗАСТОСУВАННЯ» 09.01.2014	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є способи лікування раку передміхурової залози різного типу, зокрема, резистентного до кастрації (РКРПЗ) шляхом перорального введення фармацевтичної комбінації відомих активних сполук або їх солей: анти-андрогенного засобу, який проявляє антагоністичну активність проти поліпептиду AP дикого типу і якими вибрано Апалутамід (Ereleada©), та інгібітору фосфоінозитид-3-кінази (PI3K), інгібітору TORC або подвійного інгібітору PI3K/TORC ( <a href="https://en.wikipedia.org/wiki/Apalutamide">https://en.wikipedia.org/wiki/Apalutamide</a> ). Еверолімум є одним із багатьох варіантів інгібітору TORC. Опис винаходу містить дані про синергетичний ефект від використання саме комбінації зазначених сполук (таблиці 4, 5 опису), який полягає у поліпшенні фармакінетичних властивостей сполук, що призводить до покращення результатів лікування в усьому спектрі РКРПЗ. При цьому патент також не обмежує використання кожної із зазначених активних сполук, у тому числі й монотерапію еверолімумом. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

# /ПРЕПАРАТИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ РЕВМАТОЇДНИХ АРТРИТІВ

## АДАЛІМУМАБ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
75	UA 82823 «СПОСІБ ІНГІБУВАННЯ АКТИВНОСТІ TNFα ЛЮДИНИ, ЗАСТОСУВАННЯ ІЗОЛЬОВАНОГО АНТИТІЛА ЛЮДИНИ У ВИРОБНИЦТВІ МЕДИКАМЕНТІВ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ РОЗЛАДУ, У ЯКОМУ АКТИВНІСТЬ TNFα Є ШКІДЛИВОЮ, ІЗОЛЬОВАНЕ АНТИТІЛО, ЩО СПЕЦІФІЧНО ЗВ'ЯЗУЄТЬСЯ З TNF-α, ТА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО ЙОГО МІСТИТЬ» / 30.09.2002	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є ізольовані моноклональні антитіла людини D2E7 (молекули імуноглобулінів) або їх антиген-зв'язуючі частини (фрагменти антитіл), які зв'язуються з TNFα людини з афінністю, яка є вищою, ніж відома з рівня техніки (дисоціюють з цитокінами TNFα людини з константою швидкості асоціації Koff = 1x10 <sup>-3</sup> с <sup>-1</sup> або менше). Для ідентифікації антитіл та їх фрагментів заявлено послідовність нуклеїнових кислот, векторів рекомбінантної експресії та клітин-господарів. Описано спосіб приготування антитіл або їх антиген-зв'язуючих частин рекомбінантною експресією генів легкого та важкого ланцюгів імуноглобулінів в клітині-господарі, а також методи селекції рекомбінантних антитіл людини (скринінг). Також зазначено фармацевтичні композиції, зручні для уведення суб'єкту, враховуючи поєднання з іншими терапевтичними агентами. Описане використання антитіл та їх частини для лікування хвороб та розладів, у яких активність TNFα є згубною. Надано результати кінетичного аналізу зв'язування антитіл людини з hTNFα (таблиці 1-5), дані нейтралізації цитотоксичності, яка викликана hTNFα (таблиці 7, 8), підтвердження інгібування активності TNFα тварин, у тому числі й приматів (таблиці 9-16). Заявлені антитіла та їх частини не були раніше описані, надано підтвердження заявленого інгібування активності TNFα: це primary patent, що захищає молекулу adalimumab із антитілом D2E7. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
76	UA 99716 «АНТИТІЛО, ЯКЕ СПЕЦИФІЧНО ЗВ'ЯЗУЄ ЛЮДСЬКИЙ IL-17 РЕЦЕПТОР А (IL-17RA)» / 01.10.2007	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є антиген-зв'язувальні білки, які інгібують цитокіни IL-17RA, що можуть бути використані в комбінаціях з інгібіторами TNF. Відома синергетична дія IL-17 та TNF для модуляції експресії цитокінів при придушенні меланогенезу як потенційній причині псоріазу (Claire Q.F. Wang et al, IL-17 and TNF synergistically modulate cytokine expression while suppressing melanogenesis: potential relevance to psoriasis, <a href="https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC3830693/">https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC3830693/</a> ). Патент UA 99716 захищає молекулу речовини із зазначеним антитілом, спосіб її використання для лікування та фармацевтичні препарати на її основі, за допомогою якої досягають підвищення ефективності лікування тих пацієнтів, у який TNF-інгібіторна-терапія виявилася безсилою. Також винахід містить підтвердження додаткового позитивного ефекту саме від комбінування з інгібіторами TNF. Патент UA 99716 не стосується безпосередньо adalimumab, а стосується молекули речовини з антитілом, яке має схожий механізм дії і може бути використане з adalimumab. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
77	UA 102503 «ІНТЕРЛЕЙКІН-13-ЗВ'ЯЗУВАЛЬНИЙ БІЛОК» / 07.09.2007	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є: рекомбінантно сконструйовані антитіла (білки) проти глікопротеїну IL-13 з поліпшеною афінністю та нейтралізацією IL-13 та їх застосування для профілактики та/або лікування різних захворювань, включаючи астму, алергію, хронічне обструктивне захворювання легенів, фіброз та рак. Препарати на основі таких білків передбачають комбінацію терапевтичних агентів, серед яких є антагоністи TNF, такі як химерні, гуманізовані антитіла або TNF-антитіла людини, зокрема D2E7 (Adalimumab). Відомо синергетичний вплив IL-13 на підвищення експресії TNFα (adalimumab – антагоніст TNFα), яка є ключовим фактором розвитку зазначених вище захворювань. Тобто блокування IL-13 впливає і на експресію TNFα (Luttman W1, Matthiesen T, Matthys H, Virchow JC Jr. Synergistic effects of interleukin-4 or interleukin-13 and tumor necrosis factor-alpha on eosinophil activation in vitro, <a href="https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/10030846">https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/10030846</a> ). Патент UA 102503 не стосується безпосередньо adalimumab, а стосується молекули речовини, яка може бути використана з adalimumab для посилення дії. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
78	UA 111340 «АНТИТІЛО, ЯКЕ СПЕЦИФІЧНО ЗВ'ЯЗУЄТЬСЯ З TNF-АЛЬФА ЛЮДИНИ» / 24.10.2011	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є розчинні антитіла-антагоністи TNFα або їх антиген-зв'язуючі фрагменти, або їх одиночний ланцюг. Антитіла оптимізовані у відношенні стабільності, розчинності, in vitro- та in vivo-зв'язування з TNFα та низької імуногенності. Зазначені антитіла призначені для діагностики та/або лікування TNFα-опосередкованих порушень. Також перевагою є те, що антитіла містять щонайменше одну мутацію, що зменшує їх агрегацію. Антитіла з аналогічною активністю проти TNFα та структурою, що включає CDR з антитіла кролика, є відомими з більш ранніх заявок ЄСБАТЕК, зокрема, WO 2006/131013, WO 2009/155723. Відмінністю є заміщення лізину аргініном (R) у положенні 47 та/або у положенні 50 відповідно до системи нумерації АНо варіабельного домену легкого ланцюгу, що призводить до зниження схильності до агрегації модифікованого антитіла порівняно з такою вихідного антитіла. Це є відомим з рівня техніки, а також певним чином розкрито у прикладах опублікованої заявки WO 2009155723. Тобто патент UA 111340 захищає молекулу сполуки, яка містить заміну, зроблену за відомими правилами з досягненням відомого ефекту. Це може бути причиною оспорювання патентоздатності цього винаходу, проте не свідчить про можливість віднесення патенту до «вічнозелених», тому що представляє вдосконалену структуру антитіл-антагоністів TNFα для лікування TNFα-опосередкованих порушень і не розповсюджується на антитіла з аналогічним ефектом та наявністю лігіну замість аргініну. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.



## ТОЦИЛІЗУМАБ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
79	UA 80091 «ЗАСІБ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ДИТЯЧИХ ХРОНІЧНИХ ЗАХВОРЮВАНЬ І ЗАСІБ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ХВОРОБИ СТІЛЛА, ЩО МІСТЯТЬ АНТИТІЛА ДО ІЛ-6 АБО ДО ЙОГО РЕЦЕПТОРА» / 02.04.2002	Так	Об'єктом винаходу за патентом є об'єкт генетичної інженерії, а саме – застосування антитіл проти рецептора інтерлейкіну-6 (IL-6R) або антитіл проти інтерлейкіну-6 (IL-6) для одержання терапевтичного засобу (тоцилізумабу) для лікування дитячих хронічних артритних захворювань. Самі антитіла до рецептора інтерлейкіну-6 (IL-6R) та антитіла до інтерлейкіну-6 (IL-6) як лікувальний засіб проти хронічного ревматоїдного артриту відомі із заявки РСТ95/01144 від 07.06.1995. Ефективність тоцилізумабу при ювенільному ревматоїдному артриті або хворобі Стілла у дітей не була вказана як спеціально визначена у раніше поданій заявці РСТ95/01144, проте таке застосування є очевидним для фахівця з даної області медицини через відомість факту, що зазначені хвороби спричиняються надмірним виробленням інтерлейкіну-6, та для їх лікування необхідне застосування антагоністів інтерлейкіну-6. В описі до патенту зазначено, що антитіла до рецептора ІЛ-6 можна отримати способом, зазначеним у заявці РСТ95/01144. Тобто винахід за патентом UA 80091 використовує раніше відомий терапевтичний засіб. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
80	UA 86587 «ЗАСІБ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ РЕВМАТОЇДНОГО АРТРИТУ ІЗ ЗАСТОСУВАННЯМ АНТИТІЛА ПРОТИ РЕЦЕПТОРА ІЛ-6 І МЕТОТРЕКСАТУ» / 28.04.2004	Так	Об'єктом винаходу за патентом є фармацевтична композиція для лікування ревматоїдного артриту, що включає антитіло проти рецептора ІЛ-6 (антитіло до ІЛ-6R), тобто тоцилізумаб, і Метотрексат (MTX), застосування антитіла до ІЛ-6R і MTX для виробництва фармацевтичної композиції для лікування ревматоїдного артриту та спосіб лікування ревматоїдного артриту. Метотрексат відомий як базисний протизапальний препарат (імуносупресор) при лікуванні ревматоїдного артриту. Синергетичний ефект від його поєднання з тоцилізумабом, що по суті і є досягненням винаходу, зазначено як послаблення чи попередження алергійних реакцій при лікуванні ревматоїдного артриту за допомогою антитіла до ІЛ-6R. Проте опис винаходу не містить підтвердження такого ефекту. Тобто винахід захищає комбінацію відомих раніше індивідуальних сполук, терапевтичний ефект яких підтверджений і не підтверджено поліпшення терапевтичного ефекту від їх комбінації. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
81	UA 85995 «ХИМЕРНЕ АНТИТІЛО, ЩО СПЕЦИФІЧНО ЗВ'ЯЗУЄТЬСЯ З ЛЮДСЬКИМ ІЛ-6, ТА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО ЙОГО МІСТИТЬ» / 26.10.2002	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є химерне антитіло або його фрагмент, що специфічно зв'язується з людським ІЛ-6 з високою афінністю зв'язування, молекула ізолюваної нуклеїнової кислоти, що кодує химерне антитіло або його фрагмент, композиція, вектор експресії та клітина-господар, що містять молекулу ізолюваної нуклеїнової кислоти, п. 6 формули, вектор експресії, який містить молекулу нуклеїнової кислоти, клітина-господар, яка містить молекулу ізолюваної нуклеїнової кислоти, спосіб продукування антитіла або його фрагмента, фармацевтична композиція, яка містить антитіло або його фрагмент, та її застосування при виробництві лікарського засобу, медичний засіб та фармацевтична композиція, яка містить антитіло або його фрагмент та носій, виріб, який містить один контейнер з антитілом або його фрагментом та продукт виробництва, який включає пакувальний матеріал та контейнер з антитілом. Тоцилізумаб є гуманізованим моноклональним антитілом проти рецептора інтерлейкіну-6 (IL-6R), яке зв'язується як з розчинним, так і з мембрано-пов'язаним ІЛ-6R. Об'єктом винаходу за патентом UA 85995 є химерне антитіло або його фрагмент, що специфічно зв'язується з людським ІЛ-6. Патент захищає Siltuximab (CNTO 328, Sylvant), який також є ІЛ-6-інгібітором, але з іншим механізмом дії та побудовою. Тому патент захищає інший препарат. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
82	UA 97231 «ІЗОЛЬОВАНЕ АНТИТІЛО, ЯКЕ СПЕЦИФІЧНО ЗВ'ЯЗУЄТЬСЯ З ІЛ-6, КОМПОЗИЦІЯ, ЩО ЙОГО МІСТИТЬ, ТА ЙОГО ЗАСТОСУВАННЯ» / 28.04.2006	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є ізольоване антитіло, яке специфічно зв'язується з ІЛ-6, а також ізольовані молекула та вектор нуклеїнової кислоти, клітина-господар, що включає ізольовану молекулу нуклеїнової кислоти, спосіб отримання антитіла, композиція, що містить антитіло, антиідіотипічне антитіло або фрагмент, який специфічно зв'язується як мінімум з одним антитілом, спосіб діагностики та лікування пов'язаного з ІЛ-6 стану, медичний пристрій, що містить антитіло, та промисловий виріб із розчином або ліофілізованим антитілом ІЛ-6. Патент базується на ізолюваних, створених людиною антитілах-антагоністах ІЛ-6. Ці антитіла є продуктом CENTOCOR, INC. під назвою infliximab (REMICADE®) і вдосконалені APPLIED MOLECULAR EVOLUTION, INC. з використанням технології AMEsystem™ для зменшення потенціалу імуногенності для поліпшення переносності препарату людиною та збільшення активності для зменшення доз порівняно з антитілами до вдосконалення. Тому патент захищає інший препарат. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
83	UA 96141 «НЕЙТРАЛІЗУЮЧЕ АНТИТІЛО, ЩО МАЄ СПЕЦИФІЧНІСТЬ ДО ЛЮДСЬКОГО ІЛ-6» / 04.12.2006	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є гуманізоване нейтралізуюче антитіло, що має специфічність до людського ІЛ-6, відокремлена послідовність ДНК, що кодує важкий та/або легкий ланцюги такого антитіла, клітина-господар, процес виготовлення антитіла та фармацевтична композиція, яка містить антитіло. Нейтралізуюче антитіло охарактеризоване послідовностями важкого та/або легкого ланцюгів або функціональними параметрами. Дія гуманізованого моноклонального антитіла згідно з винаходом націлена на цитокін інтерлейкіну-6 (IL-6), на відміну від тоцилізумабу, який діє на рецептор ІЛ-6. Такий препарат UCSB PHARMA S.A., як Olokizumab (OKZ, CDP6038), має дію саме на цитокін інтерлейкіну-6. Тому патент захищає інший препарат. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
84	UA 97645 «АНТИТІЛО, ЯКЕ СПЕЦИФІЧНО ЗВ'ЯЗУЄ РЕЦЕПТОР ІНТЕРЛЕЙКІНУ-6 ЛЮДИНИ (hIL-6R)» / 01.06.2007	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є антитіло або його антигензв'язувальний фрагмент, які специфічно зв'язують рецептор інтерлейкіну-6 людини (hIL-6R), виділена молекула нуклеїнової кислоти, яка кодує антитіло або його антигензв'язувальний фрагмент, вектор для експресування антитіла або його антигензв'язувального фрагмента, система «господар-вектор» для одержання антитіла або його антигензв'язувального фрагмента, спосіб одержання антитіла до hIL-6R або його антигензв'язувального фрагмента, застосування антитіла або його антигензв'язувального фрагмента антитіла у виробництві лікарського засобу. Антитіла або його антигензв'язувальні фрагменти як основні об'єкти винаходу охарактеризовані послідовностями, представленими доменами важкого ланцюга та легкого ланцюга. REGENERON (власник патенту) сумісно з Sanofi є розробником препарату Sarilumab, який є повністю людським моноклональним антитілом по відношенню до ІЛ-6R та генерується з використанням технології Velocimmune (розробник – REGENERON). Згідно з винаходом за патентом, нові антитіла також одержують переважно з використанням технології Velocimmune, що свідчить про те, що патент належить до препарату Sarilumab, що є конкурентом тоцилізумабу. Існує думка, що Sarilumab підпадає під дію патентів на тоцилізумаб, проте REGENERON стверджує про відмінність. Тому патент захищає інший препарат. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.



## ФЛУРБІПРОФЕН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
85	UA 83531 «ФАРМАЦЕВТИЧНА ПЕРОРАЛЬНА ДОЗОВАНА ФОРМА, ЩО МІСТИТЬ НЕСТЕРОЇДНИЙ ПРОТИ-ЗАПАЛЬНИЙ ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ, З ХОРОШОЮ СМАКОВОЮ ПРИВАБЛИВІСТЮ» / 16.12.2004	Так	Патент захищає композицію трометаміну та нестероїдного протизапального лікарського засобу (НСПЗЛ), яким є флурбіпрофен як один із представників, та сполуки, вибраної з гліцину, вітаміну В6 або їх суміші. Перевагою композиції за винаходом є краща переносимість НСПЗЛ та смакова привабливість. Винахід не має переваг з підвищення терапевтичного ефекту. Тобто винахід описує нову комбінацію відомих раніше активних речовин без нового біологічного ефекту. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
86	UA 89656 «ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО ДИСПЕРГУЄТЬСЯ ПЕРОРАЛЬНО, І СПОСІБ ЇЇ ПРИГОТУВАННЯ» / 25.11.2005	Так	Патент захищає: - спосіб приготування твердої лікарської форми, що диспергується перорально; - тверду лікарську форму, в якій активний компонент включений в матрикс, що містить принаймні один гідрофільний природний полімер з високою молекулярною масою. Активний компонент вибирається з групи, що включає ібупрофен, напроксен і флурбіпрофен. Перевагою винаходу є маскування смаку або вивільнення зазначених вище активних компонентів з неприємним смаком. Перевага досягається шляхом використання додаткового неактивного компонента – гідрофільного природного полімеру з високою молекулярною масою. Винахід не має переваг з підвищення терапевтичного ефекту. Тобто винахід описує тверду лікарську форму з відомих раніше активних речовин без нового біологічного ефекту та спосіб її отримання. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
87	UA 104159 «КОМПОЗИЦІЯ КОНТРОЛЬОВАНОГО ВИВІЛЬНЕННЯ ДЛЯ ПЕРОРАЛЬНОГО ВВЕДЕННЯ ТА СПОСІБ ЇЇ ВИГОТОВЛЕННЯ» / 08.01.2010	Так	Патент захищає: - фармацевтичну або харчову композицію контрольованого вивільнення, яка включає активний фармацевтичний або харчовий інгредієнт, диспергований у суміші глікогену з полісахаридом; - спосіб одержання такої композиції; - також систему повільного вивільнення, представлену сумішшю глікогену з полісахаридом, - застосування такої системи для виготовлення фармацевтичних або харчових композицій повільного вивільнення. Активним інгредієнтом є серед багатьох інших флурбіпрофен. Перевагою винаходу є здатність композиції вивільнювати активний інгредієнт з кінетикою вивільнення практично нульового порядку, тобто є незмінною в часі й не залежить від концентрації. Досягається така перевага застосуванням певних відомих формоутворювачів. Винахід не має переваг з підвищення терапевтичного ефекту. Тобто винахід описує композицію відомих раніше активних речовин без нового біологічного ефекту. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
88	UA 117200 «ВОДНІ ФАРМАЦЕВТИЧНІ КОМПОЗИЦІЇ ДЛЯ МІСЦЕВОГО ЗАСТОСУВАННЯ У РОТОВІЙ ПОРОЖНИНІ, ЩО МІСТЯТЬ ФЛУРБІПРОФЕН І ДЕКСПАНТЕНОЛ» / 24.12.2015	Так	Патент захищає композицію флурбіпрофену та декспантенолу, або додатково з хлоргексидином, для місцевого застосування у ротовій порожнині. Перевагою винаходу є забезпечення оптимальної доставки цих компонентів через поверхню слизової оболонки порожнини рота шляхом забезпечення необхідного рівня розчинності, поліпшеного смаку і поліпшеного всмоктуванням з поверхні слизової оболонки. Перевага досягається застосуванням у зазначеній композиції гідроксиду натрію для доведення рН розчину до значення від 6 до 7. Винахід не має переваг з підвищення терапевтичного ефекту. Тобто винахід описує композицію відомих раніше активних речовин без нового біологічного ефекту, наприклад, від поєднання двох або більше активних речовин. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## ЕТАНЕРЦЕПТ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
89	UA 113172 «СТІЙКИЙ РІДКИЙ ПРЕПАРАТ ЕТАНЕРЦЕПТУ» / 01.06.2012	Ні	Патент захищає рідку композицію етанерцепту зі стабілізатором (метіонін та лізин), яка має підвищену стійкість. Етанерцепт відомий як біологічний модулятор запалення, зокрема, з US5447851A (Immupex Corp), а також відомі його біологічні аналоги, наприклад, виробництва Sandoz. Тобто винахід описує фармацевтичну композицію, яка містить комбінацією відомих раніше речовин, одна з яких є активною. Проте опис винаходу містить підтвердження того, що метіонін та лізин помітно впливають на стабілізування етанерцепту шляхом зменшення кількості загального вмісту домішок порівняно з вільним від стабілізатора препаратом. При цьому винахід не блокує застосування інших відомих препаратів на основі етанерцепту, наприклад, Енбрел®, який не містить зазначених стабілізаторів тощо. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

# /ПРЕПАРАТИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ІНШИХ ЗАХВОРЮВАНЬ

## АГОМЕЛАТИН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
90	UA 78825 «СПОСІБ СИНТЕЗУ АГОМЕЛАТИНУ, КРИСТАЛІЧНА ФОРМА АГОМЕЛАТИНУ І ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА ЙОГО МІСТИТЬ» / 11.02.2005	Так	Об'єктами винаходу є: - спосіб промислового синтезу агомелатину; - кристалічна II форма агомелатину; - фармацевтична композиція, яка містить як активний інгредієнт кристалічну II форму агомелатину. Таким чином об'єктом патентування є поліморфна форма агомелатину та фармацевтична композиція на її основі. Агомелатин є відомою сполукою, його одержання і терапевтичне застосування були розкриті в Описі Європейської патентної заявки EP 0 447 285 та Youse et al. Journal of Medicinal Chemistry, 1992, 35 (8), 1484-1486], кристалічна форма описана в Tinant et al. Acta Cryst., 1994, C50, 907-910. В описі винаходу зазначено, що нова кристалічна форма виявляє цінні властивості щодо фільтрування й легкості формування. Опис не містить підтвердження даної тези. А також підтвердження якісних та кількісних змін фармацевтичних властивостей.
91	UA 83719 «КРИСТАЛІЧНА ФОРМА III АГОМЕЛАТИНУ, СПОСІБ ЇЇ ОДЕРЖАННЯ І ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА ЇЇ МІСТИТЬ» / 02.08.2006	Так	Об'єктами винаходу є: - кристалічна форма III агомелатину; - спосіб промислового синтезу кристалічної форми III агомелатину; - фармацевтична композиція, яка містить як активний інгредієнт кристалічну форму III агомелатину. Отже, об'єктом патентування є поліморфна форма агомелатину та фармацевтична композиція на її основі. Агомелатин є відомою сполукою, його одержання і терапевтичне застосування були розкриті в Описі Європейської патентної заявки EP 0 447 285. В описі винаходу зазначено, що фармакологічне дослідження кристалічної форми III продемонструвало, що вона володіє значною активністю по відношенню до центральної нервової системи та по відношенню до мікроциркуляції. При цьому опис не містить підтвердження даної тези у контексті якісних та кількісних змін фармацевтичних властивостей порівняно з іншими відомими кристалічними формами агомелатину.
92	UA 83718 «КРИСТАЛІЧНА ФОРМА IV АГОМЕЛАТИНУ, СПОСІБ ЇЇ ОДЕРЖАННЯ І ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА ЇЇ МІСТИТЬ» / 02.08.2006	Так	Об'єктами винаходу є: - кристалічна форма IV агомелатину; - спосіб промислового синтезу кристалічної форми IV агомелатину; - фармацевтична композиція, яка містить як активний інгредієнт кристалічну форму IV агомелатину. Отже, об'єктом патентування є поліморфна форма агомелатину та фармацевтична композиція на її основі. Агомелатин є відомою сполукою, його одержання і терапевтичне застосування були розкриті в Описі Європейської патентної заявки EP 0 447 285. В описі винаходу зазначено, що фармакологічне дослідження кристалічної форми IV продемонструвало, що вона володіє значною активністю по відношенню до центральної нервової системи та по відношенню до мікроциркуляції. При цьому опис не містить підтвердження даної тези у контексті якісних та кількісних змін фармацевтичних властивостей порівняно з іншими відомими кристалічними формами агомелатину.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
93	UA 83720 «КРИСТАЛІЧНА ФОРМА V АГОМЕЛАТИНУ, СПОСІБ ЇЇ ОДЕРЖАННЯ І ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА ЇЇ МІСТИТЬ» / 02.08.2006	Так	Об'єктами винаходу є: - кристалічна форма V агомелатину; - спосіб промислового синтезу кристалічної форми V агомелатину; - фармацевтична композиція, яка містить як активний інгредієнт кристалічну форму V агомелатину. Отже, об'єктом патентування є поліморфна форма агомелатину та фармацевтична композиція на її основі. Агомелатин є відомою сполукою, його одержання і терапевтичне застосування були розкриті в Описі Європейської патентної заявки EP 0 447 285. В описі винаходу зазначено, що фармакологічне дослідження кристалічної форми V продемонструвало, що вона володіє значною активністю по відношенню до центральної нервової системи та по відношенню до мікроциркуляції. При цьому опис не містить підтвердження даної тези у контексті якісних та кількісних змін фармацевтичних властивостей порівняно з іншими відомими кристалічними формами агомелатину.
94	UA 97478 «КРИСТАЛІЧНА ФОРМА VI АГОМЕЛАТИНУ, СПОСІБ ЇЇ ПРИГОТУВАННЯ (ВАРІАНТИ) І ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЦО ЇЇ МІСТИТЬ» / 04.11.2008	Так	Об'єктами винаходу є: - кристалічна форма VI агомелатину; - спосіб промислового синтезу кристалічної форми VI агомелатину; - фармацевтична композиція, яка містить як активний інгредієнт кристалічну форму VI агомелатину. Отже, об'єктом патентування є поліморфна форма агомелатину та фармацевтична композиція на її основі. Агомелатин є відомою сполукою, його одержання і терапевтичне застосування були розкриті в Описі Європейської патентної заявки EP 0 447 285. В описі винаходу зазначено, що фармакологічне дослідження кристалічної форми VI продемонструвало, що вона володіє значною активністю по відношенню до центральної нервової системи та по відношенню до мікроциркуляції. При цьому опис не містить підтвердження даної тези у контексті якісних та кількісних змін фармацевтичних властивостей порівняно з іншими відомими кристалічними формами агомелатину.
95	UA 100476 «КРИСТАЛІЧНА ФОРМА VI АГОМЕЛАТИНУ, СПОСІБ ЇЇ ОДЕРЖАННЯ І ЗАСТОСУВАННЯ» / 09.03.2010	Так	Об'єктами винаходу є: - кристалічна форма VI агомелатину; - спосіб одержання кристалічної форми VI агомелатину; - фармацевтична композиція, яка містить як активний інгредієнт кристалічну форму VI агомелатину. Отже, об'єктом патентування є поліморфна форма агомелатину та фармацевтична композиція на її основі. Агомелатин є відомою сполукою, його одержання і терапевтичне застосування були розкриті в Описі Європейської патентної заявки EP 0 447 285. Патенти КНР CN200510071611.6, CN200610108396.7, CN200610108394.8 і CN200610108395.2 відповідно розкривають кристалічні форми II, III, IV, V агомелатину і способи їх одержання. В описі винаходу зазначено, що кристалічна форма VI агомелатину проявляє цінні характеристики для фармацевтичних складів. При цьому приклади, наведені в описі, вказують на те, що чистота кристалічної форми VI агомелатину до експерименту менша порівняно з іншими відомими кристалічними формами цієї сполуки, а після – знаходиться на рівні аналогічного показника для кристалічної форми IV агомелатину. Аналогічна ситуація і щодо результатів дослідження на розчинність у воді. Фармакологічне дослідження кристалічної форми VI агомелатину відповідно до даного винаходу показало, що кристалічну форму VI агомелатину можуть використовувати у лікуванні захворювань мелатонінергічної системи, порушень сну, стресу, тривожності, сезонного афективного розладу або глибокої депресії, серцево-судинних захворювань, захворювань травної системи, безсоння та втоми внаслідок порушення добового ритму організму, шизофренії, фобії, депресії і подібного. При цьому опис не містить підтвердження якісних та кількісних змін фармацевтичних властивостей порівняно з іншими відомими кристалічними формами агомелатину. Отже, кристалічна форма VI агомелатину є менш стійким та стабільним поліморфом відомих форм агомелатину.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
96	UA 113058 «КРИСТАЛІЧНА ФОРМА VII АГОМЕЛАТИНУ, СПОСІБ ЇЇ ПРИГОТУВАННЯ І ЗАСТОСУВАННЯ І ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА ЇЇ МІСТИТЬ» / 22.03.2012	Так	Об'єктами винаходу є: - спосіб одержання нової кристалічної форми VII агомелатину; - нова кристалічна форма VII агомелатину; - фармацевтична композиція, яка містить як активний інгредієнт нову кристалічну форму VII агомелатину. Отже, об'єктом патентування є поліморфна форма агомелатину та фармацевтична композиція на її основі. Агомелатин є відомою сполукою, його одержання і терапевтичне застосування були розкриті в Описі Європейської патентної заявки EP 0 447 285. Патенти КНР CN200510071611.6, CN200610108396.7, CN200610108394.8 і CN200610108395.2, CN200910047329.2, CN200910245029.5, відповідно, розкривають різні кристалічні форми агомелатину і способи їх одержання. В описі винаходу зазначено, що кристалічна форма VII агомелатину проявляє цінні властивості для фармацевтичних складів. При цьому приклади, наведені в описі, вказують на те, що чистота кристалічної форми VII агомелатину до експерименту та після нього вища щонайменше на 0,1% порівняно з іншими відомими кристалічними формами цієї сполуки. Розчинність у воді знаходиться в межах розчинності інших відомих кристалічних форм агомелатину. Фармакологічне дослідження кристалічної форми VII агомелатину відповідно до даного винаходу показало, що кристалічну форму VII агомелатину можна застосовувати для лікування захворювань мелатонінергічної системи, порушень сну, стресу, тривоги, сезонного афективного розладу, тяжкої депресії, серцево-судинних захворювань, захворювань органів травлення, безсоння і втоми, викликаних зміною часових поясів, шизофренії, фобій і депресії. При цьому опис не містить підтвердження якісних та кількісних змін фармацевтичних властивостей порівняно з іншими відомими кристалічними формами агомелатину.

**РИВАРОКСАБАН**

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
97	UA 73339 «ЗАМІЩЕНІ ОКСАЗОЛІДИНОНИ І ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ ДЛЯ ЗАПОБІГАННЯ ЗГОРТАННЮ КРОВІ» / 11.12.2000	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є індивідуальні хімічні сполуки (похідні 2-оксазолідоно, що є прямими інгібіторами фактору Ха (активатор утворення тромбіну), спосіб їх одержання, лікарський засіб, який містить зазначені індивідуальні хімічні сполуки, їх застосування для лікування та/або профілактики тромбоемболітичних захворювань та спосіб запобігання згортанню крові in vitro у консервованій крові або біологічних пробах за допомогою зазначених індивідуальних хімічних сполук. Індивідуальні хімічні сполуки охарактеризовані загальною хімічною структурною формулою, що підпадає під загальну формулу Маркуша раніше поданої заявки (WO1999/31092, MERCK PATENT GMBH (DE)). Індивідуальні хімічні сполуки за п.п. 1-7 формули відрізняються від сполук у WO1999/31092 однотипним замісником в межах однієї групи (група NR8 заміщена піперазиним кільцем). Проте індивідуальні хімічні сполуки за п.п. 1-7 формули не були раніше описані як спеціально отримані. Також технічний результат – підвищення селективності інгібування фактору згортання крові Ха – є відмінним від WO1999/31092. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
98	UA 82986 «КОМБІНАЦІЯ АКТИВНИХ РЕЧОВИН, СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ КОМБІНАЦІЇ, ЛІКАРСЬКИЙ ЗАСІБ ТА ЗАСТОСУВАННЯ КОМБІНАЦІЇ» / 07.06.2002	Так	Об'єктом винаходу за патентом є комбінація відомих раніше активних речовин: сполуки (А) – оксазолідинонів формули (I) (ривароксабан, описаний у заявці на патент UA 73339 (1-й рядок таблиці), та сполук (Б), вибраних з групи: інгібітори агрегації тромбоцитів, антикоагулянти, фібринолітики, речовини, що знижують рівень ліпідів, засіб для лікування коронарних захворювань та/або судинорозширювальні засоби, а також спосіб отримання такої комбінації, лікарський засіб для профілактики та/або для лікування тромбоемболітичних захворювань, що містить таку комбінацію та застосування комбінації для одержання лікарського засобу. Несподіваний ефект саме від комбінації порівняно з ефектом від окремих сполук обумовлений саме антитромботичною дією ривароксабану та зменшенням ризику повторного утворення тромбу. Тобто безпосереднє призначення ривароксабану, яке вже відоме з рівня техніки, допомагає іншим активним сполукам (Б) більш ефективно здійснювати свою дію після розкриття закупорених у результаті тромбозу судин і зменшити дозу сполук (Б) для досягнення потрібного ефекту. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
99	UA 84591 «СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ 5-ХЛОР-N-((5S)-2-ОКСО-3-[4-(3-ОКСО-4-МОРФОЛІНІЛ)ФЕНІЛ]-1,3-ОКСАЗОЛІДИН-5-ІЛ]МЕТИЛ)-2-ТІОФЕНКАРБОКСАМІДУ» / 31.12.2004	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є спосіб отримання оксазолідинонів формули (I) (ривароксабан). Цей спосіб є вдосконаленням способу, описаного у п. 15 формули винаходу за патентом UA 73339. Вдосконалення полягає у спрощенні способу одержання сполуки (I), придатного для промислового використання, уникнення використання токсичних розчинників або реагентів, особливо на останніх стадіях способу, шляхом усунення побічних компонентів за рахунок застосування амінометилкоксазолідинону (VII) в іншій формі, ніж у патенті UA 73339. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
100	UA 85693 «ТВЕРДА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ ПЕРОРАЛЬНОГО ЗАСТОСУВАННЯ, СПОСІБ ЇЇ ВИРОБНИЦТВА ТА ЇЇ ЗАСТОСУВАННЯ» / 13.11.2004	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є спосіб отримання оксазолідинонів формули (I) (ривароксабан) з використанням активної речовини (I) в гідрофілізованій формі для швидкого вивільнення, фармацевтична композиція з ривароксабаном у гідрофілізованій формі, застосування такої фармацевтичної композиції для профілактики та/або лікування тромбоемболітичних захворювань. Одержання грануляту з активною речовиною (I) в гідрофілізованій формі шляхом зволужувальної грануляції з наступним перетворенням його на фармацевтичну композицію не описане спеціально у UA 73339 та UA 84591 на спосіб одержання активної речовини. Задача, яку вирішує винахід за патентом, – поліпшення пероральної біодоступності активної речовини (I) та підвищення біологічної стабільності швидкості всмоктування речовини – також не є відомою. Інші об'єкти винаходу, отримані за допомогою такого способу, не описані спеціально і не є відомими. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
101	UA 90545 «ТВЕРДА ФАРМАЦЕВТИЧНА ЛІКАРСЬКА ФОРМА ДЛЯ ПЕРОРАЛЬНОГО ВВЕДЕННЯ З ШВИДКИМ ВИВІЛЬНЕННЯМ ІНГІБІТОРА ФАКТОРА ХА ЗГОРТАННЯ КРОВІ» / 21.09.2006	Так	Об'єктом винаходу за патентом є тверда фармацевтична лікарська форма для перорального введення зі швидким вивільненням активної речовини – оксазолідинонів формули (I) (ривароксабан) – в аморфній формі або у термодинамічно метастабільній кристалічній модифікації, п.п. 1–14 формули. Фармацевтична композиція є поліморфною формою раніше відомої композиції, характеристики якої виражені через нову форму застосування активної речовини – аморфну форму або термодинамічно метастабільну кристалічну модифікацію, – що призводить до вивільнення 80% активної речовини (I) протягом менш ніж 2 годин відповідно до методу вивільнення згідно з Фармакопесю США, що швидше порівняно з використанням активної речовини (I) в гідрофілізованій формі (патент UA 90545, 4-й рядок таблиці). Зазначені форми раніше відомої композиції відомі загалом із заявки, за якою отримано патент UA 73339. При цьому патент не містить даних про більш швидке вивільнення активної речовини (I) порівняно саме з винаходом UA 73339. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
102	UA 91355 «СПОСІБ ЛІКУВАННЯ ТРОМБОЕМБОЛІЙНИХ РОЗЛАДІВ» / 19.01.2006	Так	Об'єктом винаходу за патентом є спосіб лікування тромбоемболійного розладу з використанням ривароксабану у формі таблетки швидкого вивільнення різного дозування, п.п. 1–3 формули. Додатково характеристикою способу є схема прийому таблетки, що призводить до підвищення безпеки прийому ривароксабану шляхом досягнення його ефективної цільової концентрації у плазмі крові пацієнта при зменшенні дози прийому. Схема прийому є відомою. Фармацевтична композиція відмінна від раніше відомої композиції лише дозуванням. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
103	UA 94428 «ПОЛІМОРФНА ФОРМА ТА АМОРФНА ФОРМА 5-ХЛОП-N-((5S)-2-ОКСО-3-[4-(3-ОКСО-4-МОРФОЛІНІЛ)ФЕНІЛ]-1,3-ОКСАЗОЛІДИН-5-ІЛ)МЕТИЛ)-2-ТІО-ФЕНКАРБОКСАМІДУ» / 22.09.2006	Так	Об'єктом винаходу за патентом є хімічна сполука формули (I) – ривароксабан – у модифікації II у кристалічній або аморфній формі, що характеризується сигналами в ближній ІЧ-області. Перевагою модифікації II сполуки є підвищення розчинності та біодоступності сполуки. Модифікацію II у кристалічній формі отримують шляхом перекристалізації модифікації I, отриманої способом, відомим з Патенту 1. Хімічна сполука за патентом є поліморфною формою (кристалічна форма модифікації II) раніше відомої сполуки (модифікація I), що має підвищену чистоту. Сигнали в ближній ІЧ-області, що є головним відмінним параметром для об'єкту винаходу, визначаються звичайними базовими методами і не впливають на терапевтичний ефект сполуки. Модифікація II має однаковий терапевтичний ефект порівняно з модифікацією I (в описі винаходу не має відомостей про поліпшення терапевтичного ефекту). Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## ІМІГЛЮЦЕРАЗА

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
104	UA 113840 «СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ВИДІЛЕНОГО ТЕРАПЕВТИЧНОГО РЕКОМБІНАНТНОГО БІОЛОГІЧНОГО ПОЛІПЕПТИДУ» / 03.01.2012	Ні	Об'єктом винаходу є спосіб одержання виділеного терапевтичного рекомбінантного біологічного поліпептиду або білка для лікування захворювання. Технічним результатом винаходу UA 113840 є спосіб одержання поліпептидних та протеїнових продуктів, що мають знижені рівні антигенності у тварин, які підлягають лікуванню даним біологічним продуктом. Отже, об'єктом патентування є спосіб одержання терапевтичного рекомбінантного біологічного поліпептиду або білка для лікування захворювання, що не накладає обмежень на такі сполуки отримані іншим способом.

## ДІДРОГЕСТРОН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
105	UA 75371 «ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ УПОВІЛЬНЕНОЇ ДІЇ ТА СПОСІБ ЇЇ ПРИГОТУВАННЯ» / 28.09.2001	Ні	Об'єктами винаходу є фармацевтична композиція з уповільненим виділенням, діючою речовиною якої можуть бути хімічні сполуки різної фармацевтичної дії, у тому числі й дідрогестерон; спосіб отримання таких композицій. Технічним результатом винаходу UA 75371 є створення композиції уповільненої дії, яка є по суті незалежною від іонної сили розчинювального середовища, що зазвичай представляє собою шлунково-кишкову рідину, навіть за відсутності покриття. Отже, об'єктом патентування є композиція, відмінна від раніше відомих композицій наявністю гідрофільної гелеутворювальної матриці, завдяки якій досягається заявлений технічний результат – повільне вивільнення діючої речовини.

## ЕРТАПЕНЕМ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
106	UA 62920 «КАРБАПЕНЕМОВИЙ АНТИБІОТИК, КОМПОЗИЦІЯ ТА СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ» / 23.05.1997	Ні	Об'єктами винаходу є, зокрема: – карбапенемова сполука; (II) – композиція на основі зазначеної вище сполуки. Зазначена у формулі винаходу сполука (II) може бути синтезована відповідно до способу, описаного в патенті США №5478820, і підпадає під загальну структурну формулу Маркуша, наведену у формулі винаходу за цим патентом. Однак сполука (II) не була відома як спеціально отримана та досліджена. Тобто має місце селективний винахід. Не була відома з рівня техніки і фармацевтична композиція на основі сполуки (II) та кількісні характеристики її властивостей як антибіотику.



#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
107	UA 78524 «СПОСІБ ОТРИМАННЯ КАРБАПЕНЕМОВИХ СПОЛУК» / 20.09.2002	Так	Об'єктами винаходу є: - спосіб очищення карбапенемових сполук від органічних розчинників; - спосіб отримання кристалогідратних форм карбапенемових сполук. Карбапенемова сполука, яка описується у формулі винаходу UA 78524 як така, що має кристалогідратні форми А, В, С, у вигляді рацематної суміші відома з патенту UA 62920. В обох випадках сполуки мають властивості антибіотика. Отже, об'єктом патентування є ізомерна та кристалогідратна форма відомої сполуки.

## ЛЕНОГРАСТИМ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
108	UA 89364 «КОН'ЮГАТ ПЕПТИДУ ГРАНУЛОЦИТАРНОГО КОЛОНІЕСТИМУЛЮЮЧОГО ФАКТОРА (G-CSF)» / 03.12.2004	Ні	Об'єктами винаходу є нові глікопегильовані пептиди G-CSF та способи високоефективного і промислового їх синтезу. Даний винахід був направлений на отримання глікопегильованого G-CSF, який є терапевтично активним і має поліпшені фармакокінетичні параметри і властивості порівняно з ідентичними або близькоспорідненими аналогами неглікопегильованого пептиду G-CSF.
109	UA 98001 «РІДКА ЛІКАРСЬКА ФОРМА КОН'ЮГАТА ПОЛІМЕР-G-CSF» / 27.08.2008	Ні	Об'єктом винаходу є водна композиція, що містить кон'югат полімер-G-CSF. Задача, що лежить в основі даного винаходу, – забезпечити композицію полімер-G-CSF-кон'югату, призначеного для таких кон'югатів, яка при цьому була б стійка при підвищених температурах, тобто вище температури холодильника, яка звичайно знаходиться в межах від 2 до 8 °С. Додатково, мета даного винаходу – забезпечити фармацевтичну композицію, що не вимагає відновлення на жодній зі стадій виготовлення і що спричиняє настільки слабе подразнення при введенні пацієнту, наскільки це можливо. Отже, винаходом за патентом UA 98001 фактично охороняється нова водна композиція, що містить кон'югат полімер-G-CSF, з новими властивостями.
110	UA 99454 «СПОСІБ ЛІКУВАННЯ З ВИКОРИСТАННЯМ ГЛІКО-ПЕГІЛЬОВАНОВОГО G-CSF (ВАРІАНТИ)» / 01.04.2008	Ні	Об'єктами винаходу є: - спосіб лікування із використанням глікопегильованого G-CSF; - дозована форма для перорального введення на основі ковалентного кон'югату пептиду G-CSF і водорозчинного полімеру. У даному винаході представлений поліпшений глікопегильований G-CSF, який має терапевтичну активність, а також поліпшені фармакокінетичні параметри і властивості порівняно з неглікопегильованими ідентичним пептидом G-CSF або його близьким аналогом. Отже, одним з об'єктів патентування винаходу UA 74797 є дозовані форми на основі поліпшеного глікопегильованого G-CSF.

## ТЕНЕКТЕПЛАЗА

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
111	UA 97486 «ЗАСТОСУВАННЯ ТЕНЕК-ТЕПЛАЗИ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ГОСТРОГО ІШЕМІЧНОГО ІНСУЛЬТУ» / 01.08.2007	Так	Патент захищає: - спосіб лікування гострого ішемічного інсульту в людини шляхом введення тенектеплази в певних дозах у певній послідовності; - набір для здійснення такого способу у вигляді контейнера з тенектеплазою та інструкцією з використання набору; - описаний набір додатково з контейнером з іншим лікарським засобом, таким як нейропротективний засіб, тромболітичний засіб, антагоніст глікопротеїну IIb/IIIa або антитіло до CD18. Тенектеплаза відома як засіб для отримання підвищеної специфічності до фібрину, ефективний в якості тромболітичного агента, коли вводиться у вигляді болусу при відносно низькій дозі (B A Keyt et al., A faster-acting and more potent form of tissue plasminogen activator. Proc. Natl. Acad. Sci USA. 1994 Apr 26 91(9): 3670–3674. Режим доступу <a href="https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC43643/">https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC43643/</a> ). Отже, патент захищає застосування раніше відомої сполуки, відмінне лише дозуванням, тобто є новою дозованою формою раніше відомої речовини, а також має нову форму застосування (контейнер). Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## НІТИЗИНОН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
112	UA 110979 «РІДКА ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА ВКЛЮЧАЄ НІТИЗИНОН» / 20.06.2012	Так	Патент захищає рідку фармацевтичну композицію, зокрема, для лікування спадкової тирозинемії типу I (НТ-I), придатну для перорального прийому, яка включає нітизинон як активну речовину та буфер на основі лимонної кислоти для регулювання рН у потрібних межах. Нітизинон як інгібітор 4-гідроксифенілпіруватдіоксигенази (HPPD) відомий з патенту US5550165A від 27.08.1996 (AstraZeneca UK Ltd, Syngenta Ltd). Кислотний буфер також відомий для регулювання кислотності композиції. Перевагою винаходу є більш стабільна композиція нітизинону, також і з погляду утворення вторинних продуктів деградації, проте переваг з підвищення терапевтичного ефекту не зазначено. Тобто фармацевтична композиція за патентом UA 110979 є новою комбінацією відомих раніше речовин, одна з яких є активною, і при цьому не має відмінного технічного результату. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».



## СИЛДЕНАФІЛ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
113	UA 112540 «ПЛІВКОВА ЛІКАРСЬКА ФОРМА, ЯКА МІСТИТЬ ВІЛЬНУ ОСНОВУ СИЛДЕНАФІЛУ, І СПОСІБ ЇЇ ОТРИМАННЯ» / 13.02.2012	Ні	<p>Патент захищає:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>- спосіб виготовлення плівки для оральної лікарської форми з контролем розміру частинок вільної основи силденафілу та вмістом інгредієнтів при диспергуванні вільної основи силденафілу як активного інгредієнта в полімерному розчині;</li> <li>- саму плівку, приготувану в такий спосіб.</li> </ul> <p>Силденафіл відомий раніше як активна сполука у вигляді цитрату для лікарського засобу, що випускається компанією Pfizer під торговою маркою Viagra® та іншими компаніями під іншими торговими марками для лікування чоловічої еректильної дисфункції. Технічним результатом винаходу є підвищення вмісту силденафілу в плівці шляхом диспергування вільної основи силденафілу, яка не має смаку та відрізняється від гіркого цитрату силденафілу, в полімері без істотного розчинення. Технічний результат досягається шляхом керування заздалегідь визначеним діапазоном розміру частинок вільної основи силденафілу. Тобто винахід направлений на спосіб отримання відомої раніше сполуки, але з технічними особливостями, оснований на використанні вільної основи для подолання недоліків цитрату силденафілу або контролю за розміром частинок лікарського засобу для отримання кращої фізичної безпеки або властивостей плівки. Зазначені особливості підтверджені результатами експериментів, описаними в таблицях 6–8 опису винаходу.</p> <p>Відповідно до Попереднього висновку міжнародного пошукового органу, відомі інші способи підготовки плівки з вмістом силденафілу, наприклад, описані у US6552024B1 (власник - Thallium Holding Company LLC). Очевидно, що винахід за патентом UA 112540 не обмежує інших способів виготовлення плівки з вмістом силденафілу, які використовують інші численні виробники лікарських засобів на основі силденафілу.</p> <p>Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.</p>
114	UA 113061 «СИСТЕМА ДОСТАВКИ ЛІКАРСЬКОГО ЗАСОБУ» / 14.05.2012	Ні	<p>Патент захищає:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>- регульовану в часі систему доставки лікарського засобу з негайним вивільненням для перорального введення активного інгредієнта пацієнту, який потребує цього;</li> <li>- пристрій для такої доставки, що включає таку регульовану в часі систему доставки лікарського засобу з негайним вивільненням, в якій перша оболонка системи доставки лікарського засобу оточена другою оболонкою, що включає інший активний інгредієнт.</li> </ul> <p>При цьому силденафіл є окремим випадком активного інгредієнта наряду з багатьма іншими інгібіторами PDE5, агоністами рецептора 5HT<sub>1A</sub> і інгібіторами нейтральної ендопептидази, тому що розробником було випробувано систему і пристрій саме на активних речовинах для лікування сексуальної дисфункції, відсутності бажання або еректильної дисфункції і, переважно, для застосування при лікуванні зниженого статевого потягу. Тобто винахід не стосується безпосередньо силденафілу, а є одним із засобів його введення в організм людини (наряду з багатьма іншими, наприклад, оральною формою, описаною у наступному патенті) разом з іншою активною речовиною. Саме у створенні такої подвійної лікарської форми (дві активних речовини з негайними вивільненнями) і полягає винахід.</p> <p>Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.</p>

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
115	UA 114629 «ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ У ФОРМІ СПРЕЮ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ЕРЕКТИЛЬНОЇ ДИСФУНКЦІЇ ТА ЛЕГЕНЕВОЇ АРТЕРІАЛЬНОЇ ГІПЕРТЕНЗІЇ» /10.10.2016	Ні	<p>Патент захищає фармацевтичну композицію у формі орального спрею, яка містить силденафіл. Завданням корисної моделі є введення силденафілу через ротову порожнину для усунення небажаних побічних ефектів, які супроводжуються прийомом відомих твердих пероральних лікарських форм силденафілу. Тобто корисна модель описує нову форму застосування відомого раніше активного інгредієнту – силденафілу. Проте патент не обмежує інших відомих композицій силденафілу у вигляді спрею, зазначених у описі корисної моделі, як і інших механізмів введення силденафілу, зокрема, у вигляді твердої пероральної лікарської форми.</p> <p>Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.</p>

## ГІДАЗЕПАМ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
116	UA 65257 «СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ЛІКАРСЬКОГО ЗАСОБУ СЕДАТИВНОЇ І СПАЗМАЛІТИЧНОЇ ДІЇ У ФОРМІ СУБЛІНГВАЛЬНОЇ ТАБЛЕТКИ» / 16.06.2011	Ні	<p>Патент захищає спосіб одержання фармацевтичної композиції, яка містить відомі активні сполуки седативної і спазмолітичної дії.</p> <p>Гідазепам є однією з таких сполук наряду з фенобарбіталом або діазепамом або їх похідними. Перевагою такого способу є отримання стабільної композиції цих сполук з бета-циклодекстрином для поліпшеної біодоступності. Спосіб не обмежує інших способів виготовлення композицій з гідазепамом, наприклад, у таблетованій формі виробництва.</p> <p>Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.</p>
117	UA 97777 «СПОСІБ ОДЕРЖАННЯ ЛІКАРСЬКОГО ЗАСОБУ СЕДАТИВНОЇ І СПАЗМОЛІТИЧНОЇ ДІЇ У ФОРМІ СУБЛІНГВАЛЬНОЇ ТАБЛЕТКИ» / 16.06.2011	Ні	<p>Патент (на винахід) аналогічний попередньому патенту (на корисну модель) і тому підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.</p>

## ФЛУТИКАЗОН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
118	UA 77656 «S-ФТОРМЕТИЛОВИЙ ЕТЕР 6-АЛЬФА,9-АЛЬФА-ДИФТОР-17-АЛЬФА-[[2-ФУРАНІЛКАРБОНІЛ)ОКСИ]-11-БЕТА-ГІДРОКСИ-16-АЛЬФА-МЕТИЛ-3-ОКСОАНДРОСТА-1,4-ДІЕН-17-БЕТА-КАРБОТІОКСИЛОТИ ЯК ПРОТИЗАПАЛЬНИЙ АГЕНТ» / 03.08.2001	Ні	<p>Патент захищає:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>- сполуку флутиказону фууроату (FF);</li> <li>- її сольвати та несольватизовані форми, поліморфи;</li> <li>- спосіб отримання такої сполуки.</li> </ul> <p>Флутиказону фууроат є синтетично фторованим кортикостероїдом, проте, на відміну від флутиказону пропionatoу (FP), відомого ще у 90-х роках, затверджений FDA у 2007 році і вперше надійшов у продаж у США в 2009 році. FF відрізняється від FP тим, що має 17α-фууроатний ефір на відміну від 17α-лінійного ефіру у FP, також FF та FP відрізняються хімічними і фармакологічними параметрами. Тобто хімічна сполука за патентом UA 77656 не є описаною раніше як спеціально отримана (цей патент є первинним).</p> <p>Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.</p>

## АМБАЗОН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
119	UA 78470 «СПОСІБ ОЧИЩЕННЯ 1,4-БЕНЗОХІНОНГУАНІЛ-ГІДРАЗОНТІОСЕМІКАРБА-ЗОНУ (АМБАЗОНУ)» / 15.09.2004	Ні	Патент захищає спосіб очищення відомого ще з 1957 року антисептику – амбазону. Спосіб дозволяє отримати амбазон фармацевтичної якості зі зменшенням сірки в якості домішки (до 99,5% чистоти амбазону). З опису відомо інші способи очищення амбазону, які використовувалися раніше і які не дозволяють отримати амбазон потрібної чистоти. Тобто спосіб очищення амбазону за патентом не був описаний раніше і не блокує інші можливі способи очищення амбазону. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

## ЛЕВОСИМЕНДАН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
120	UA 73954 «ВОДНИЙ РОЗЧИН ДЛЯ ВНУТРІШНЬОВЕННОГО ВВЕДЕННЯ ТА ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ РОЗЧИН, ЩО МІСТЯТЬ ЛЕВОСИМЕНДАН» / 08.09.2000	Так	Патент захищає левосимедан у формі розчину, придатного для внутрішньовенного (інфузійного) введення за рахунок використання у вигляді етанольного концентрату (левосимедан або його фармацевтично прийнятна сіль, розчинені у зневодненому етанолі), а також фармацевтичний розчин на його основі. Левосимедан як сполука з гемодинамічним ефектом для людини та його фармакокінетика при внутрішньовенному введенні розкриті раніше: - застосування левосимендану при лікуванні ішемії міокарда описане в WO 93/21921; - застосування левосимендану в лікуванні легеневої гіпертонії описане в WO 99/66912; - застосування левосимендану при лікуванні або профілактиці спазму коронарного трансплантата описане в WO 1/00211. Перевагою винаходу за патентом зазначено підвищену стабільність розчину. Проблеми зі стабільністю хімічних та фізичних факторів левосимендану для його внутрішньовенних розчинів також були відомі, зокрема, чутливість до хімічних факторів, до температури зберігання, нерозчинність у воді та тенденція до осадження при збереженні, що може призвести до закупорювання судин при внутрішньовенному введенні. Тобто раніше був відомий розчин, проблеми його застосування, і очевидно, що були відомі рішення для вирішення таких проблем, оскільки розчин саме у такому виді (для внутрішньовенного введення) був випробуваний. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

## ДАПТОМІЦИН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
121	UA 82824 «КОМПОЗИЦІЯ І СПОСІБ ПОЛІПШЕННЯ ПЕРОРАЛЬНОГО ВСМОКТУВАННЯ ПРОТИМІКРОБНИХ ЗАСОБІВ» / 18.06.2001	Так	Патент захищає фармацевтичну композицію, яка містить даптоміцин, як переважний варіант ліпептидного протимікробного засобу (антибіотику), що входить до композиції. Даптоміцин як ліпептидний антибіотик з активністю проти грампозитивних організмів відомий раніше, наприклад, з US 4,537,717; US 5,912,226 та деяких статей. Перевагою винаходу є поліпшення всмоктування протимікробного засобу з кишкової, для чого композиція додатково містить біополімер, катіон металу, сполучений з протимікробним засобом та біополімером, та кампул, відомий як підсилювач всмоктування. Фармацевтична композиція за патентом є новою комбінацією відомих раніше активних речовин, однією з яких є даптоміцин. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».
122	UA 105785 «СПОСІБ ОЧИЩЕННЯ ЛІПОПЕПТИДІВ» / 19.02.2010	Ні	Патент захищає спосіб очищення даптоміцину. Власником патенту є XELLIA PHARMACEUTICALS APS (DK) як один з виробників генеричної версії даптоміцину, оригінатором якого є CUBIST PHARMACEUTICALS, INC. (US), власник попереднього патенту. Відомо аналогічні способи очищення даптоміцину, наприклад, описані у US 4,885,243, US 4,874,843, US 6,696,412 та інші. Винахід згідно патенту описує поліпшений спосіб очищення даптоміцину, в результаті якого отримують більшу чистоту продукту, при цьому такий спосіб є більш простим і екологічним. Патент 4 не блокує будь-яких інших версій даптоміцину, а захищає продукт, створений саме XELLIA PHARMACEUTICALS APS (DK) в рамках виготовлення генеричної версії даптоміцину. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

## ПЕГФІЛГРАСТИМ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
123	UA 93581 «ЗАСІБ, ЩО МІСТИТЬ G-CSF, ДЛЯ ПРОФІЛАКТИКИ І ЛІКУВАННЯ ДІАБЕТИЧНОЇ ПЕРИФЕРИЧНОЇ НЕВРОПАТІЇ» / 29.10.2007	Ні	Об'єктом винаходу є нове застосування рекомбінантного пегільованого гранулоцитарного колоніестимулюючого фактору людини (G-CSF) як засобу для лікування діабетичної периферичної невропатії. G-CSF відомий як лікарський засіб для індукування нейтрофілів в протираковій хіміотерапії, терапії мегадозами протиракових лікарських засобів, комбінованій терапії з радіотерапією та після пересадки кісткового мозку за рахунок специфічного впливу на нейтрофільні клітини-прекурсори, сприяння проліферації та диференціації нейтрофілів та підсилення антитіло-залежної клітинної цитотоксичності нейтрофілів. Проте невідоме застосування G-CSF для лікування діабетичної периферичної невропатії, тобто має місце нове застосування відомої речовини, охарактеризоване ідентифікуючими ознаками відомої речовини та ознаками її нового застосування. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
124	UA 97414 «ВИДІЛЕНЕ ЛЮДСЬКЕ АНТИТІЛО, ЯКЕ ЗВ'ЯЗУЄТЬСЯ З GM-CSF» / 18.09.2008	Ні	Патент захищає індивідуальну сполуку, що належить до об'єктів генетичної інженерії, – виділене людське антитіло, яке зв'язується з GM-CSF, а також виділений антигензв'язуючий білок, молекулу нуклеїнової кислоти, вектор, клітину-господаря, спосіб одержання антитіла, фармацевтичну композицію та використання виділеного антитіла. Виділене людське антитіло характеризується ланцюгами CDRH та CDRL, які не були раніше описані як спеціально отримані. Звіт про міжнародний пошук не містить даних про патентні документи на аналогічні сполуки/препарати, де заявником/власником є компанія AMGEN INC. (US). Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

## ІЛОПРОСТ

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
125	UA 113161 «КОМПОЗИЦІЯ, ЩО МІСТИТЬ АНАЛОГ ПРОСТАЦИКЛІНУ ТА ІНГІБІТОР PDE4, ДЛЯ ЛІКУВАННЯ МУКОВІСЦИДОЗУ» / 03.02.2012	Так	Об'єктом винаходу за патентом є застосування композиції, охарактеризованої якісним складом (інгредієнти) для лікування муковісцидозу. Ілопрост є однією з альтернатив простацикліну в складі композиції. Фармацевтична композиція є новою комбінацією відомих раніше активних речовин (простациклін (ілопрост) та PDE4-інгібітор (ядерна фосфодієстераза). Також відомий терапевтичний ефект простацикліну (ілопросту) та PDE4-інгібітора для лікування муковісцидозу (кістозного фіброзу) шляхом підсилення вироблення цАМФ в епітеліальних клітинах легенів (Pierre Tissie res, MD, Laurent Nicod, MD, Constance Barazzone-Argiroffo, MD, Peter C. Rimensberger, MD, and Maurice Beghetti, MD 'Aerosolized iloprost as a bridge to lung transplantation in a patient with cystic fibrosis and pulmonary hypertension', Ann Thorac Surg 2004;78:e48-50) v© 2004 by The Society of Thoracic Surgeons, <a href="https://www.annalsthoracicsurgery.org/article/S0003-4975(04)00754-4/pdf">https://www.annalsthoracicsurgery.org/article/S0003-4975(04)00754-4/pdf</a> та Liu S1, Veilleux A, Zhang L, Young A, Kwok E, Laliberté F, Chung C, Tota MR, Dubé D, Friesen RW, Huang Z. Dynamic activation of cystic fibrosis transmembrane conductance regulator by type 3 and type 4D phosphodiesterase inhibitors, J Pharmacol Exp Ther. 2005 Aug;314(2):846-54. Epub 2005 May 18, <a href="https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/15901792">https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/15901792</a> )

## КАРБЕТОЦИН

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
126	UA 73501 «b-АРИЛ-а-ОКСИЗАМІЩЕНІ АЛКІЛКАРБОНОВІ КИСЛОТИ, СПОСІБ ЇХ ОДЕРЖАННЯ (ВАРІАНТИ), ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ НА ЇХ ОСНОВІ (ВАРІАНТИ), СПОСОБИ ПРОФІЛАКТИКИ ТА ЛІКУВАННЯ З ЇХ ЗАСТОСУВАННЯМ, ПРОМІЖНІ СПОЛУКИ ТА СПОСІБ ЇХ ОДЕРЖАННЯ (ВАРІАНТИ)» / 25.04.2000	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є: – сполука, охарактеризована загальною формулою Маркуша (хімічний склад та розгалужена структура макромолекули в цілому); – спосіб її отримання; – фармацевтична композиція на основі цієї сполуки для лікування або профілактики діабету II типу, нетолерантності до глюкози, стійкості до інсуліну, стійкості до лептину, дисліпідемії, захворювань, пов'язаних із синдромом X, деяких ниркових захворювань. Хімічна сполука не є описаною раніше як спеціально отримана. Хімічна сполука за патентом не стосується карбетоцину (carbetocin). Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

## ТИКАГРЕЛОР

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
127	UA 66801 «ТРИАЗОЛО[4,5-d]ПІРИМІДИНОВІ СПОЛУКИ, СПОСІБ ЇХ ОДЕРЖАННЯ (ВАРІАНТИ), ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ НА ЇХ ОСНОВІ ТА СПОСІБ ЛІКУВАННЯ ПОРУШЕНЬ АГРЕГАЦІЇ ТРОМБОЦИТІВ» / 15.07.1998	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є: – триазоло[4,5-d]піримідинова сполука, охарактеризована загальною формулою Маркуша (хімічний склад та розгалужена структура макромолекули в цілому); – способи її одержання. Сполука є антагоністом P21-рецептора і використовується як протитромботичний агент. Хімічна сполука не є описаною раніше як спеціально отримана. Її терапевтичний ефект не є відомим. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.
128	UA 73181 «КРИСТАЛІЧНА І АМОРФНА ФОРМА ТРИАЗОЛО(4,5-d)ПІРИМІДИНУ, СПОСІБ ЙОГО ОДЕРЖАННЯ, ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ ТА СПОСІБ ЛІКУВАННЯ АБО ПРОФІЛАКТИКИ АРТЕРІАЛЬНИХ ТРОМБОТИЧНИХ УСКЛАДНЕНЬ» / 31.05.2001	Так	Об'єктом винаходу за патентом є: – кристалічна та аморфна форма триазоло[4,5-d]піримідинової сполуки; – зазначена сполука у формі гідрату; – спосіб одержання зазначених сполук; – фармацевтична композиція на їх основі; – спосіб лікування артеріальних тромботичних ускладнень з використанням терапевтично ефективної кількості зазначених вище сполук. Триазоло[4,5-d]піримідинова сполука вже розкрита у попередніх патентних заявках (наприклад, у міжнародних публікаціях WO 99/05143 або WO 00/34283). Тому патент захищає окремі форми раніше відомої сполуки, зокрема, кристалічну, аморфну або у формі гідрату. Такі форми цієї сполуки не були раніше описані як спеціально отримані, проте, як правило, отримані відомими способами без суттєвого винахідницького внеску. Причому поліморфі або окремі форми відомої раніше сполуки не є винайденими спеціально, а тільки встановленими шляхом звичайного дослідження вже існуючої сполуки. При цьому патент не містить даних про наявність нового терапевтичного ефекту в поліморфній чи аморфній формі відомої триазоло[4,5-d]піримідинової сполуки або іншого невідомого раніше ефекту. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
129	UA 99105 «ФАРМАЦЕВТИЧНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО МІСТИТЬ ПОХІДНЕ ТРИАЗОЛО[4,5-d] ПІРИМІДИНУ» / 20.08.2007	Так	Об'єктом винаходу за патентом є фармацевтична композиція, яка містить тікагрелор (в різних формах, переважно у кристалічній) як активний агент та інші компоненти, які є фармацевтично прийнятними компонентами і потрібні для забезпечення перорального застосування агента. Тобто винахід захищає комбінацію відомих раніше речовин, усі з яких застосовані за своїм прямим відомим раніше призначенням. Згідно з описом, винахід направлений на підвищення біодоступності композиції з агентом, проте не містить доказів поліпшення біодоступності порівняно з відомими раніше формами застосування агента. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

**ЕПОЕТИН БЕТА**

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
130	UA 73468 «КОН'ЮГАТ ЕРИТРОПО-ЕТИНУ, КОМПОЗИЦІЇ, ЩО ЙОГО МІСТЯТЬ, ТА СПОСОБИ ПРОФІЛАКТИКИ ТА/АБО ЛІКУВАННЯ ХВОРОБ» / 30.06.2000	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є: - індивідуальна сполука, що належить до об'єктів генетичної інженерії, а саме кон'югант, який включає глікопротеїн еритропоетину з біологічною активністю in vivo для стимулювання продукування еритроцитів; - спосіб отримання сполуки; - фармацевтична композиція та - спосіб лікування або профілактики анемії з використанням такої сполуки
131	UA 73468 «КОН'ЮГАТ ЕРИТРОПО-ЕТИНУ, КОМПОЗИЦІЇ, ЩО ЙОГО МІСТЯТЬ, ТА СПОСОБИ ПРОФІЛАКТИКИ ТА/АБО ЛІКУВАННЯ ХВОРОБ» / 30.06.2000	Ні	Об'єктом винаходу за патентом є водна композиція людського еритропоетину та додаткові фармацевтично прийнятні речовини (стабілізатори, ізотонічні реагенти та буферні реагенти), направлені на підвищення тривалості збереження біологічної активності людського еритропоетину. Винахід може бути застосований до композиції з еритропоетином будь-якої терапевтичної активності та походження (не тільки для епоетин бета компанії F. HOFFMANN LA ROCHE AG). Опис винаходу містить докази ефективності композиції порівняно з іншими тестовими композиціями еритропоетину, зокрема, підвищення чистоти та виходу еритропоетину після тривалого (4 тижні) терміну зберігання. Висновок: підстави відносити патент до «вічнозелених» відсутні.

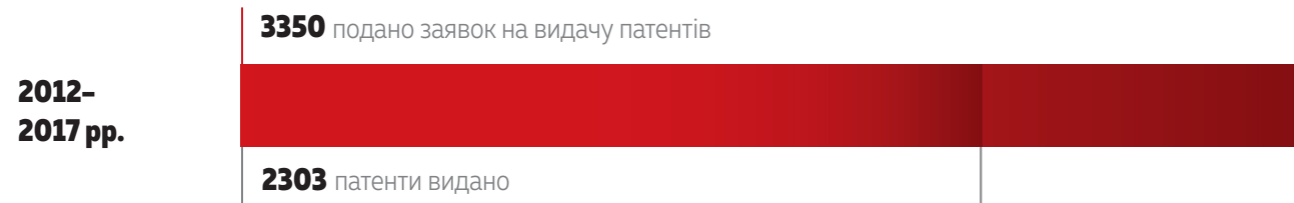
**ІДУРСУЛЬФАЗА**

#	Номер патенту/назва винаходу/дата подання	Віднесення патенту до «вічнозелених» (так/ні)	Підстави віднесення винаходу до «вічнозелених»
132	Заявка a201413826 «PURIFICATION OF IDURONATE-2-SULFATASE» / 28.06.2013	Так	Патент захищає: - використання очищеного спеціальним способом рекомбінантного ферменту (ідуронат-2-сульфатази, I2S), продукту генної інженерії, в складі препарату (Elaprase) для усунення відсутності або дефектності цього ферменту в організмі людини, які призводять до проявлення симптомів синдрому Хантера; - спосіб очищення I2S; - спосіб лікування синдрому Хантера із використанням I2S, очищеного заявленим способом. Об'єкт винаходу охарактеризований нуклеотидною послідовністю для клону компліментарної ДНК повної довжини для отримання I2S з ендотеліальних клітин людини. Застосування рекомбінантного ферменту за вказаним призначенням було вперше описано у патентах US5728381A, US5798239A, US5932211A, US6153188A, US6541254 B1, заявки на які подані в 1994-2000 роках і ексклюзивне право на які було отримано SHIRE HUMAN GENETIC THERAPIES INC. Позитивним ефектом від винаходу заявлено підвищення ступеню очищення відомого раніше рекомбінантного ферменту від необроблених біологічних матеріалів одночасно зі спрощенням способу та підвищенням вмісту FGly, важливого для активності I2S. Тобто об'єктом винаходу є описана раніше білкова сполука з описаною раніше фармацевтичною дією. Нової терапевтичної активності не заявлено. Висновок: є підстави відносити патент до «вічнозелених».

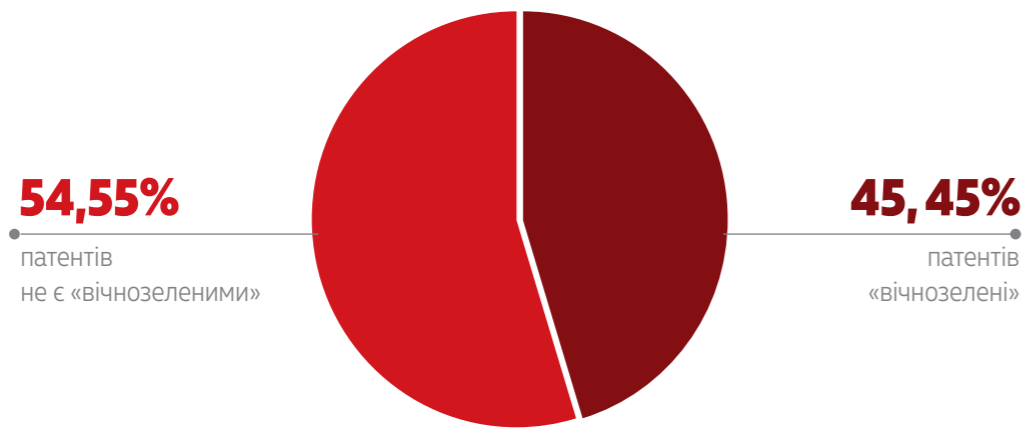


# /РЕЗЮМЕ ДОСЛІДЖЕННЯ

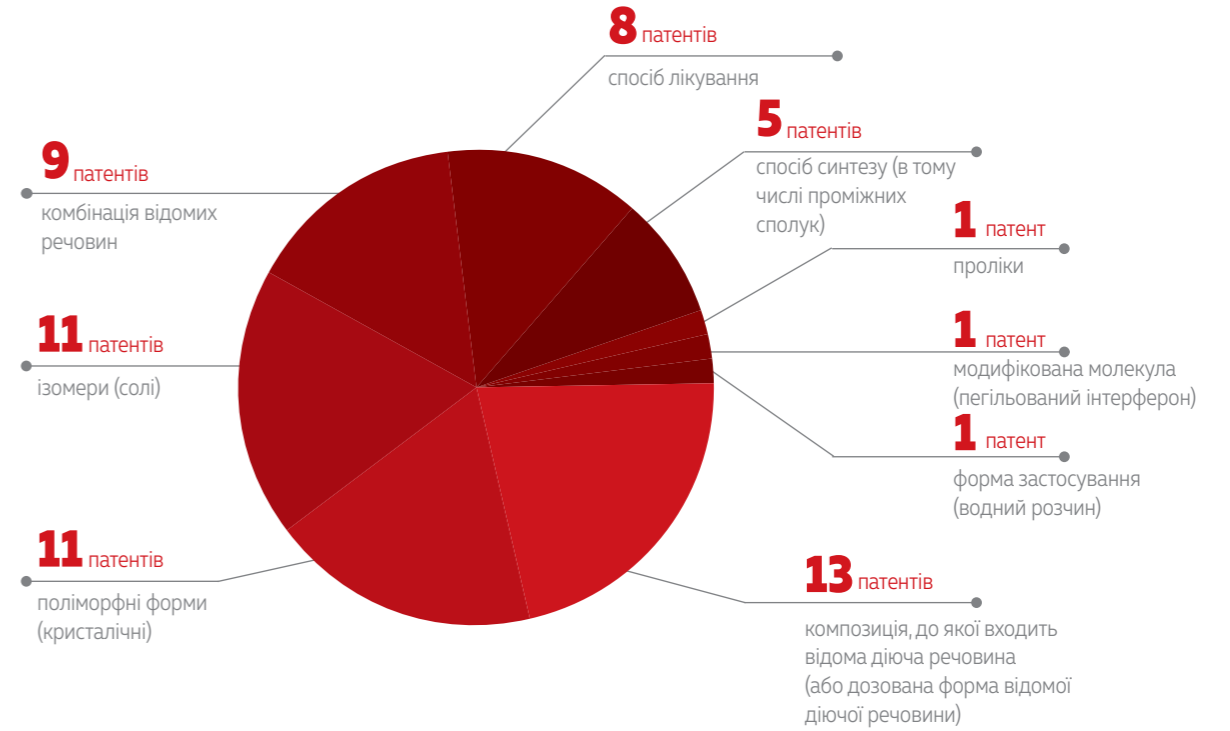
У рамках даного дослідження було проаналізовано 132 патенти, що стосуються лікарських засобів. Слід відзначити, що сфера лікарських засобів є доволі привабливою для заявників: протягом 5 років, що передували початку даного дослідження (2012–2017 рр.) було подано 3350 заявок на видачу патентів за даними напрямками і видано 2303 патенти. За даними проведеного аналізу, до категорії «вічнозелених» можна віднести 60 патентів, решта 72 патенти – до категорії «вічнозелених» не належать. Отже, під дану категорію підпадають трохи більше 45% проаналізованих патентів.



**132** патенти було проаналізовано



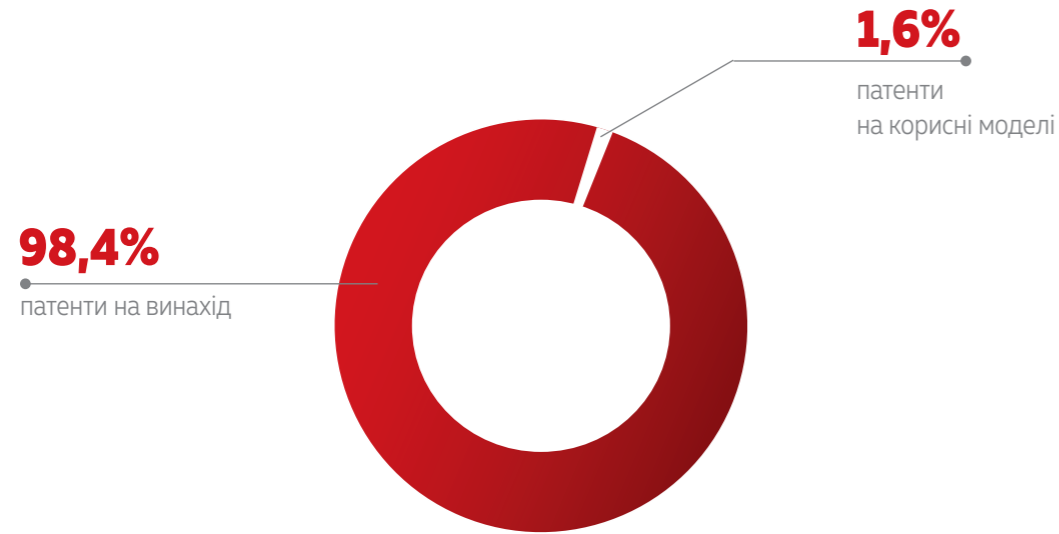
Визначені **60 «вічнозелених»** патентів мають такий розподіл за об'єктами патентування:



Із «вічнозелених» патентів 98,4% було подано зарубіжними заявниками й 1,6% – національними.



Із «вічнозелених» патентів 98,4% є патентами на винахід і 1,6% – патенти на корисні моделі.



Із «вічнозелених» патентів: 15 – ВІЛ, 10 – онкологія, 6 – ревматоїдні артрити, 6 – вірусні гепатити, 3 – туберкульоз, 20 – інше



Той факт, що майже половина з проаналізованих патентів є «вічнозеленими» і була подана майже виключно зарубіжними заявниками, негативно впливає на доступність лікарських засобів і гальмує розвиток вітчизняного фармвиробництва. У зв'язку з цим держава має вжити заходів для попередження видачі «вічнозелених» патентів. Для

цього доцільно дотримуватись кваліфікаційного стандарту для хімічних речовин і фармацевтичних продуктів, а також звернути додаткову увагу на так звані вторинні заявки, при яких охорона надається не на саму діючу речовину, а на метод її виробництва, лікарську форму, склад відповідних препаратів тощо.

Автори:

Петренко Сергій,  
патентний повірений України №374, атестований судовий експерт з питань інтелектуальної власності,  
кандидат юридичних наук, старший науковий співробітник

Жихарєв Олександр,  
Патентний повірений України №410, атестований судовий експерт з питань інтелектуальної власності,  
науковий співробітник Науково-дослідного інституту інтелектуальної власності НАПрН України

Трофименко Микита  
Юрисконсульт, БО «100 Відсотків Життя»