

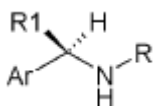
**ЗАКЛЮЧЕНИЕ**  
**коллегии по результатам рассмотрения  возражения**

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 1 января 2008 г. Федеральным законом от 18 декабря 2006 г. № 231-ФЗ, в редакции, действующей на дату подачи возражения, и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности (далее - Роспатент) споров в административном порядке, утвержденными приказом Министерства науки и высшего образования Российской Федерации и Министерства экономического развития Российской Федерации от 30.04.2020, № 644/261, зарегистрированным в Министерстве юстиции Российской Федерации 25.08.2020, регистрационный № 59454, дата вступления в силу 06.09.2020, с изменениями, внесенными приказом Минобрнауки России и Минэкономразвития России от 23.11.2022 № 1140/646 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение компании ДОМПЕ' ФАРМАЧЕУТИЧИ С.П.А., Италия (далее – заявитель), поступившее 11.08.2023 на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее – Роспатент) от 23.01.2023 об отказе в выдаче патента на изобретение по заявке № 2020122678/04, при этом установлено следующее.

Заявка № 2020122678/04 на изобретение «ИНГИБИТОРЫ C5aR ДЛЯ ПРИМЕНЕНИЯ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ИНДУЦИРОВАННОЙ ХИМИОТЕРАПИЕЙ ЯТРОГЕННОЙ БОЛИ» была подана 11.12.2018 (дата подачи заявки) по процедуре PCT/EP 2018/084277 (номер и дата публикации: WO 2019/115493, 20.06.2019) и переведена на национальную фазу 13.07.2020. Приоритет установлен по дате (12.12.2017) подачи первой заявки EP 17206813.2 в государстве-участнике Парижской конвенции.

Совокупность признаков заявленного решения изложена в формуле изобретения, представленной 15.12.2022 в корреспонденции заявителя в следующей редакции:

«1. Применение ингибитора C5aR для предупреждения или лечения индуцированной химиотерапией ятрогенной боли, где ингибитор C5aR выбран из соединения формулы (I)



(I)

или его фармацевтически приемлемой соли, где:

**R** выбран из:

- 2-тиазолила или 2-оксазолила, незамещенного или замещенного группой, выбранной из метильной, трет-бутильной или трифторметильной группы;

- C(Ra)=N-W, где W представляет собой линейный или разветвленный C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил,

- CORa, SORa, SO<sub>2</sub>Ra, PORa, PO<sub>2</sub>Ra,

где

**Ra** выбран из

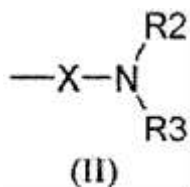
- C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкила, C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-алкенила, незамещенного или замещенного фенила с группой, выбранной из галогена, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, галоген-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, гидроксид, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ацилокси, фенокси, циано, нитро, amino;

- гетероарильной группы, выбранной из пиридина, пиримидина, пиррола, тиофена, фурана, индола, тиазола, оксазола, причем такой гетероарил является незамещенным или замещен группой, выбранной из галогена, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, галоген-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, гидроксид, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ацилокси, фенокси, циано, нитро, amino;

- α- или β-карбоксилалкильного остатка, состоящего из прямого или разветвленного C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкила, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенила, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-

фенилалкила, необязательно замещенного дополнительной карбокси(COOH)- группой;

- ω-аминоалкиламиногруппы формулы II:



где

**X** обозначает:

- линейный или разветвленный C1-C6 алкилен, C4-C6 алкенилен, C4-C6 алкинилен, необязательно замещенный группой CO<sub>2</sub>R<sub>4</sub> или группой CONHR<sub>5</sub>, где R<sub>4</sub> обозначает водород или линейную или разветвленную C1-C6 алкильную группу или линейную или разветвленную C2-C6 алкенильную группу, где R<sub>5</sub> обозначает водород, линейный или разветвленный C2-C6 алкил или группу OR<sub>4</sub>, где R<sub>4</sub> определен выше;

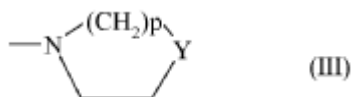
- группу (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-B-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>, необязательно замещенную группой CO<sub>2</sub>R<sub>4</sub> или CONHR<sub>5</sub>, как определено выше, где B представляет собой атом кислорода, или атом серы, или азота, необязательно замещенный C1-C4 алкильной группой, m представляет собой ноль или целое число от 2 до 3 и n представляет собой целое число от 2 до 3, или B представляет собой группу CO, SO или CONH, m представляет собой целое число от 1 до 3 и n представляет собой целое число от 2 до 3;

- или X вместе с атомом азота, к которому он присоединен, и с группой R<sub>2</sub> образует азотсодержащее 3-7-членное гетероциклическое, моноциклическое или полициклическое кольцо, и R<sub>3</sub> обозначает водород, C1-C4 алкил, C1-C4 ацил, незамещенный или замещенный фенил с группой, выбранной из галогена, C1-C4-алкила, C1-C4-алкокси, гидрокси, C1-C4- ацилокси, фенокси, циано, нитро, amino;

**R<sub>2</sub>** и **R<sub>3</sub>** независимо представляют собой:

водород, линейный или разветвленный С1-С6 алкил, в который необязательно встроены атом кислорода или серы, С3-С7 циклоалкильную, С3-С6 алкенильную, С3-С6-алкинильную, арил-С1-С3-алкильную, гидрокси-С2-С3-алкильную группу;

или R2 и R3 вместе с атомом N, к которому они присоединены, образуют 3-7-членное азотсодержащее гетероциклическое кольцо формулы (III)



где

**Y** обозначает:

- одинарную связь, CH<sub>2</sub>, O, S или группу N-R<sub>6</sub>, где R<sub>6</sub> обозначает водород, С1-С4 алкил, С1-С4 ацил, незамещенный или замещенный фенил с группой, выбранной из галогена, С1-С4-алкила, С1-С4-алкокси, гидрокси, С1-С4-ацилокси, фенокси, циано, нитро, амина,

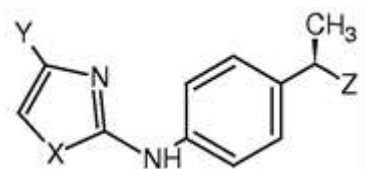
и p обозначает целое число от 0 до 3;

- остаток формулы SO<sub>2</sub>R<sub>7</sub>, где R<sub>7</sub> представляет собой С1-С6-алкил, С3-С6-циклоалкил, С2-С6-алкенил, арил и гетероарил;

**R1** представляет собой линейный или разветвленный С1-С5 алкил, С3-С5 циклоалкил;

**Ar** представляет собой фенильную группу, незамещенную или замещенную одной или несколькими группами, независимо выбранными из галогена, С1-С4-алкила, С1-С4-алкокси, гидрокси, С1-С4-ацилокси, фенокси, циано, нитро, амина, С1-С4-ациламина, галоген-С1-С3-алкила, галоген-С1-С3-алкокси, бензоила, гетероарила карбонила, гетероарила, линейного или разветвленного С1-С8-алкансульфоната, линейных или разветвленных С1-С8-алкансульфонамидов, линейного или разветвленного С1-С8-алкилсульфонилметила;

или Ar представляет собой гетероарильное кольцо, выбранное из пиридина, пиррола, тиофена, фурана, индола; и соединения формулы (II)



(II)

или его фармацевтически приемлемой соли,

где

**X** представляет собой гетероатом, выбранный из

- S, O и N

**Y** представляет собой H или остаток, выбранный из группы, состоящей из:

- галогена, линейного или разветвленного C1-C4-алкила, C2-C4-алкенила, C1-C4-алкокси, гидрокси, -COOH, C1-C4-ацилокси, фенокси, циано, нитро, -NH<sub>2</sub>, C1-C4-ациламино, галоген-C1-C3-алкила, бензоила, линейного или разветвленного C1-C8-алкансульфоната, линейных или разветвленных C1-C8-алкансульфонамидов, линейного или разветвленного C1-C8-алкилсульфонилметила;

**Z** представляет собой гетероарильное кольцо, выбранное из группы, состоящей из:

незамещенного тетразола и триазола, пиразола, оксазола, тиазола, изооксазола, изотиазола, тиadiaзола и оксадиазола, замещенного одной гидроксигруппой и необязательно дополнительно замещенного одной или несколькими группами, выбранными из

группы, состоящей из галогена, линейного или разветвленного C1-C4-алкила, C2-C4-алкенила, C1-C4-алкиламино, C1-C4-алкокси, C1-C4-алкилтио, C1-C4-ацилокси, циано, нитро, NH<sub>2</sub>, C1-C4-ациламино, галоген-C1-C3-алкила, галоген-C1-C3-алкокси, линейного или разветвленного C1-C8-алкансульфоната и линейных или разветвленных C1-C8-алкансульфонамидов.

2. Применение по п.1 для предупреждения или лечения аллодинии, ассоциированной с индуцированной химиотерапией ятрогенной болью.

3. Применение по п. 1 или 2, где ингибитор C5aR представляет собой соединение формулы (I), где

**R** выбран из:

- 2-тиазолила или 2-оксазолила, не замещенного или замещенного группой, выбранной из метильной, трет-бутильной или трифторметильной группы;

- C(Ra)=N-W, где W представляет собой линейный или разветвленный C1-C4 алкил,

- CORa, SORa или SO2Ra,

где Ra является таким, как определено выше;

**Ar** выбран из:

3'-бензоилфенила, 3'-(4-хлорбензоил)фенила, 3'-(4-метилбензоил)фенила, 3'-ацетилфенила, 3'-пропионилфенила, 3'-изобутаноилфенила, 4'-изобутилфенила, 4'-трифторметансульфонилоксифенила, 4'-бензолсульфонилоксифенила, 4'-трифторметансульфониламинофенила, 4'-бензолсульфониламинофенила, 4'-бензолсульфонилметилфенила, 4'-ацетоксифенила, 4'-пропионилоксифенила, 4'-бензоилоксифенила, 4'-ацетиламинофенила, 4'-пропиониламинофенила, 4'-бензоиламинофенила, 3'-(фуран-2-карбонил)фенила, 3'-(бензофуран-2-карбонил)фенила, 3'-(тиофен-2-карбонил)фенила, 3'-(пиридин-2-карбонил)фенила, 3'-(тиазол-2-карбонил)фенила, 3'-(оксазол-2-карбонил)фенила, 3'-(2-фурил)фенила, 3'-(2-оксазолил)фенила, 3'-(3-изоксазолил)фенила, 3'-(2-бензоксазолил)фенила, 3'-(3-бензоизоксазолил)фенила, 3'-(2-тиазолил)фенила, 3'-(2-пиридил)фенила, 3'-(2-тиофенил)фенила;

или Ar представляет собой гетероарильное кольцо, выбранное из пиридина, пиррола, тиофена, фурана или индола.

4. Применение по п.1 или 2, где ингибитор C5aR представляет собой соединение формулы (I), где

**R** представляет собой

- 2-тиазолил, незамещенный или замещенный группой, выбранной из метильной или трифторметильной группы;

- CORa, SO2Ra, SORa;

где

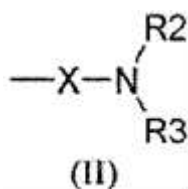
**Ra** выбран из:

- C1-C5-алкила, C3-C5-циклоалкила;

- фенильной, 2-пиридильной, 2-тиазолильной, 2-фурильной, 2-пирролильной, 2-тиофенильной, 2-индолильной групп;

- карбоксилалкильной группы, состоящей из прямой или разветвленной C1-C6-алкильной, C1-C6-фенилалкильной группы;

- ω-алкиламиногруппы формулы II,



(II)

где

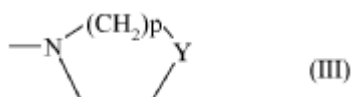
**X** обозначает:

линейный или разветвленный C1-C6 алкилен, C4-C6 алкенилен, C4-C6 алкинилен;

или X вместе с атомом азота, к которому он присоединен и с группой R2 образует азотсодержащее 3-7-членное гетероциклическое моноциклическое кольцо и R3 обозначает водород или C1-C4 алкил;

**R2** и **R3** независимо представляют собой водород, линейный или разветвленный C1-C6 алкил, C3-C7 циклоалкил, C3-C6 алкенил, C3-C6-алкинил;

или R2 и R3 вместе с атомом N к которому они присоединены, образуют 4-6-членное азотсодержащее гетероциклическое кольцо формулы (III)



где **Y** обозначает CH2, O, S, или группу N-R6, где R6 обозначает водород, C1-C4 алкил, C1-C4 ацил, и p обозначает целое число от 0 до 2;

**R1** представляет собой метил;

**Ar** выбран из:

3'-бензоилфенила, 3'-(4-хлорбензоил)фенила, 3'-(4-метилбензоил)фенила, 3'-ацетилфенила, 3'-пропионилфенила, 3'-изобутаноилфенила, 4'-изобутилфенила, 4'-трифторметансульфонилоксифенила, 4'-бензолсульфонилоксифенила, 4'-трифторметансульфониламинофенила, 4'-бензолсульфониламинофенила, 4'-бензолсульфонилметилфенила, 4'-ацетоксифенила, 4'-пропионилоксифенила, 4'-бензоилоксифенила, 4'-ацетиламинофенила, 4'-пропиониламинофенила, 4'-бензоиламинофенила; 3'-(фуран-2-карбонил)фенила; 3'-(бензофуран-2-карбонил)фенила; 3'-(тиофен-2-карбонил)фенила; 3'-(пиридин-2-карбонил)фенила, 3'-(тиазол-2-карбонил)фенила, 3'-(оксазол-2-карбонил)фенила; 3'-(2-фурил)фенила, 3'-(2-оксазолил)фенила, 3'-(3-изоксазолил)фенила, 3'-(2-бензоксазолил)фенила, 3'-(3-бензоизоксазолил)фенила, 3'-(2-тиазолил)фенила, 3'-(2-пиридил)фенила, 3'-(2-тиофенил)фенила.

5. Применение по п. 1 или 2, где ингибитор C5aR представляет собой соединение формулы (I), где

**R** представляет собой

- 2-тиазолил, незамещенный или замещенный группой, выбранной из метила или трифторметила;

- CORa, SO2Ra

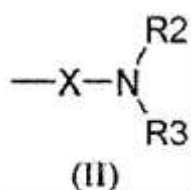
где

**Ra** выбран из:

- C1-C5-алкила, C3-C5-циклоалкила;

- фенильной, 2-пиридильной, 2-фурильной, 2-тиофенильной групп;

- группы формулы II,



где

**X** обозначает:



линейный или разветвленный C1-C6 алкилен,

R2 и R3 вместе с атомом N, к которому они присоединены, образуют 4-6-членное азотсодержащее гетероциклическое кольцо формулы (III)

где Y обозначает CH<sub>2</sub>, и p обозначает целое число от 0 до 2;

R1 представляет собой метил;

Ar выбран из:

3'-бензоилфенила, 3'-(4-хлорбензоил)фенила, 3'-(4-метилбензоил)фенила, 4'-трифторметансульфонилоксифенила, 4'-бензолсульфонилоксифенила, 3'-(фуран-2-карбонил)фенила.

6. Применение по любому из предшествующих пунктов, где ингибитор C5aR выбран из:

4-{(1R)-1-[(фенилсульфонил)амино]этил}фенилтрифторметансульфоната

N-[(1R)-1-(3-бензоилфенил)этил]бензолсульфонамида

4-{(1R)-1-[(пиридин-3-

илсульфонил)амино]этил}фенилтрифторметансульфоната

N-[(1R)-1-(3-бензоилфенил)этил]метансульфонамида

N-{(1R)-1-[3-(2-фууроил)фенил]этил}тиофен-2-сульфонамида

N-{(1R)-1-[3-(2-фууроил)фенил]этил}метансульфонамида

4-{(1R)-1-[(тиен-2-

илсульфонил)амино]этил}фенилтрифторметансульфоната

N-[(1R)-1-(3-бензоилфенил)этил]тиофен-2-сульфонамида

N-[(1R)-1-(3-бензоилфенил)этил]-3-пирролидин-1-илпропан-1-

сульфонамида

метил 5-({[(1R)-1-(3-бензоилфенил)этил]амино}сульфонил)-2-фууроата

5-({[(1R)-1-(3-бензоилфенил)этил]амино}сульфонил)-2-фуранкарбоновой

кислоты

4-{(1R)-2-метил-1-

[(метилсульфонил)амино]пропил}фенилтрифторметансульфоната

N-((1R)-1-{4-[1-метил-1-(фенилсульфонил)этил]фенил}этил)метансульфонамида  
4-[(1R)-1-(изобутириламино)этил]фенилтрифторметансульфоната  
4-[(1R)-1-(пиридин-3-илкарбонил)амино]этил]} фенилтрифторметансульфоната  
N-[(1R)-1-(3-бензоилфенил)этил]бензамида  
N-[(1R)-1-(3-бензоилфенил)этил]-2-фурамида  
N-[(1R)-1-(3-бензоилфенил)этил]циклобутанкарбоксамида  
N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамида  
4-[(1R)-1-[(4-пирролидин-1-илбутаноил)амино]этил]} фенилтрифторметансульфоната  
3-[(1R)-1-[4-(4-трифторметил-1,3-тиазол-2-ил)амино]этил} фенил)(фенил)метанола и их фармацевтически приемлемых солей, предпочтительно выбранный из N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамида и его хлорида.

7. Применение по п. 1 или 2, где:

**X** представляет собой гетероатом, выбранный из

- S и O

**Y** представляет собой H или остаток, выбранный из группы, состоящей из:

- галогена, линейного или разветвленного C1-C4-алкила и галогена-C1-C3-алкила; предпочтительно выбранного из группы, состоящей из трифторметила, хлора, метила и трет-бутила;

**Z** представляет собой гетероарильное кольцо, выбранное из группы, состоящей из:

незамещенного тетразола и триазола, пиразола, изооксазола, изотиазола, тиadiaзола и оксадиазола, замещенного одной гидроксигруппой и необязательно дополнительно замещенного одной или несколькими группами, выбранными из

группы, состоящей из галогена, линейного или разветвленного С1-С4-алкила, С1-С4-алкилтио и галоген-С1-С3-алкила; предпочтительно выбранными из группы, состоящей из метила, трифторметила и хлора.

8. Применение по пп. 1, 2 или 7, где ингибитор С5aR выбран из:

N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-амин;

4-метил-N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-1,3-тиазол-2-амин;

4-трет-бутил-N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-1,3-тиазол-2-амин;

N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-1,3-тиазол-2-амин;

N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-4-(трифторметил)-1,3-оксазол-2-амин;

4-метил-N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-1,3-оксазол-2-амин;

5-[(1R)-1-(4-{[4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]амино}фенил)этил]-1H-пирозол-1-ол;

4-метил-5-[(1R)-1-(4-{[4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]амино}фенил)этил]-1H-пирозол-1-ол;

5-[(1R)-1-(4-{[4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]амино}фенил)этил]-1H-1,2,3-триазол-1-ол;

5-[(1R)-1-(4-{[4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]амино}фенил)этил]изоксазол-3-ол;

4-метил-5-[(1R)-1-(4-{[4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]амино}фенил)этил]изоксазол-3-ол;

5-[(1R)-1-(4-{[4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]амино}фенил)этил]изотиазол-3-ол;

4-[(1R)-1-(4-{[4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]амино}фенил)этил]-1,2,5-оксадиазол-3-ол;

4-[(1R)-1-(4-{[4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]амино}фенил)этил]-1,2,5-тиадиазол-3-ол;

5-[(1R)-1-(4-{[4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-ил]амино}фенил)этил]-1H 1,2,4-триазол-1-ола и их фармацевтически приемлемых солей, предпочтительно выбранный из 1-N-[4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил]-4-(трифторметил)-1H-1,3-тиазол-2-амина и его соли натрия.

9. Применение по любому из предшествующих пунктов, где указанная индуцированная химиотерапией ятрогенная боль индуцирована химиотерапевтическим средством, выбранным из лекарственных средств на основе платины, таксанов, эпотилонов, растительных алкалоидов, талидомида, леналидомида и помалидомида, карфилзомиба, бортезомиба и эрибулина, предпочтительно таксанов и лекарственных средств на основе платины.

10. Применение по п.9, где указанное химиотерапевтическое средство выбрано из цисплатина, карбоплатина, оксалиплатина, паклитаксела, кабазитаксела, доцетаксела, иксабепилона, винбластина, винкристина, винорелбина, этопозиды, талидомида, леналидомида, помалидомида, карфилзомиба, бортезомиба и эрибулина, предпочтительно паклитаксела».

При вынесении решения Роспатентом от 23.01.2023 об отказе в выдаче патента на изобретение к рассмотрению была принята вышеприведенная формула изобретения.

В решении Роспатента от 23.01.2023 сделан вывод о том, что изобретение, охарактеризованное в вышеприведенной формуле, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», в свете выявленных в уровне техники сведений и при техническом результате, который заключается в реализации изобретением указанного назначения.

Вывод о несоответствии заявленного изобретения, охарактеризованного в вышеприведенной формуле условию патентоспособности «изобретательский уровень», сделан на основании сведений, известных из следующих источников информации:

- XU J. Et al. Role of Complement in Paclitaxel-induced Peripheral Neuropathy // American Society of Anesthesiologists Abstracts, дата публикации 22.10.2017 (далее –[1]);

- международная публикация WO 2017121838 A1, дата публикации 20.07.2017 (далее –[2]);

- международная публикация WO 2007060215 A2, дата публикации 31.05.2007 (далее –[3]);

- международная публикация WO 2009050258 A1, дата публикации 23.04.2009 (далее –[4]).

На решение об отказе в выдаче патента на изобретение, в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 указанного выше Гражданского кодекса, поступило возражение, в котором лицо, подавшее возражение (далее – заявитель), выразило несогласие с данным решением.

Суть доводов заявителя сводится к тому, что на дату приоритета заявленного изобретения специалисту в данной области техники применение ингибитора C5aR для лечения индуцированной химиотерапией ятрогенной боли не является очевидным на основании сведений, содержащихся в источниках информации [1]-[4].

Заявитель также обратился с просьбой принять к рассмотрению скорректированную формулу изобретения, уточненную путем ограничения притязаний, и «выдать патент с измененной формулой изобретения, включающей пункты 1- 6», в которой независимый пункт 1 и зависимые пункты 2-6 представлены следующей совокупностью признаков:

«1. Применение ингибитора C5aR для перорального введения для предупреждения или лечения индуцированной химиотерапией ятрогенной боли, где ингибитор C5aR выбран из N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-амин; N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамида и их фармацевтически приемлемых солей.

2. Применение по п.1 для предупреждения или лечения аллодинии, ассоциированной с индуцированной химиотерапией ятрогенной болью.

3. Применение по п.1 или 2, где ингибитор C5aR выбран из N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамида и его хлорида.

4. Применение по п. 1 или 2, где ингибитор C5aR выбран из N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-амин и его соли натрия.

5. Применение по любому из предшествующих пунктов, где указанная индуцированная химиотерапией ятрогенная боль индуцирована химиотерапевтическим средством, выбранным из лекарственных средств на основе платины, таксонов, эпотилонов, растительных алкалоидов, талидомида, леналидомида и помалидомида, карфилзомиба, бортезомиба и эрибулина, предпочтительно таксонов и лекарственных средств на основе платины.

6. Применение по п.5, где указанное химиотерапевтическое средство выбрано из цисплатина, карбоплатина, оксалиплатина, паклитаксела, кабазитаксела, доцетаксела, иксабепилона, винбластина, винкристина, винорелбина, этопозиды, талидомида, леналидомида, помалидомида, карфилзомиба, бортезомиба и эрибулина, предпочтительно паклитаксела».

Заявитель обращает внимание на то, что признаки («для перорального введения» и «N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-амин; N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамида и их фармацевтически приемлемых солей»), включенные в независимый пункт 1 уточненной формулы, раскрыты в первоначальных материалах заявки, а «применительно к измененной формуле изобретения технический результат может быть сформулирован, как применение для перорального введения для предупреждения или лечения индуцированной химиотерапией ятрогенной боли».

В возражении отмечено, что предложенное изобретение, охарактеризованное изменённой формулой изобретения, отличается от раскрытого в источнике [1] технического решения тем, что ингибитор C5aR выбран из N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-амин, N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамида и эти соединения «применяют для перорального введения».

Изучив материалы дела и заслушав участников рассмотрения возражения, коллегия установила следующее.

С учетом даты подачи заявки (11.12.2018), правовая база для оценки патентоспособности заявленного решения включает Гражданский кодекс Российской Федерации в редакции, действующей на дату подачи заявки (далее - Кодекс), Правила составления, подачи и рассмотрения документов, являющихся основанием для совершения юридически значимых действий по государственной регистрации изобретений, и их формы (далее – Правила ИЗ), Требования к документам заявки на выдачу патента на изобретение (далее - Требования ИЗ), утвержденные приказом Минэкономразвития Российской Федерации от 25 мая 2016 года № 316, зарегистрированным в Минюсте Российской Федерации 11 июля 2016 г., рег. № 42800.

В соответствии с пунктом 1 статьи 1350 Кодекса в качестве изобретения охраняется техническое решение в любой области, относящееся к продукту (в частности, устройству, веществу, штамму микроорганизма, культуре клеток растений или животных) или способу (процессу осуществления действий над материальным объектом с помощью материальных средств), в том числе к применению продукта или способа по определенному назначению. Изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно пункту 2 статьи 1350 Кодекса изобретение является новым, если оно не известно из уровня техники. Изобретение имеет изобретательский

уровень, если для специалиста оно явным образом не следует из уровня техники. Уровень техники для изобретения включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Согласно пункту 75 Правил ИЗ, в соответствии с пунктом 2 статьи 1350 Кодекса изобретение имеет изобретательский уровень, если оно для специалиста явным образом не следует из уровня техники. Изобретение явным образом следует из уровня техники, если оно может быть признано созданным путем объединения, изменения или совместного использования сведений, содержащихся в уровне техники, и/или общих знаний специалиста.

Согласно пункту 76 Правил ИЗ проверка изобретательского уровня изобретения может быть выполнена по следующей схеме:

- определение наиболее близкого аналога изобретения;
- выявление признаков, которыми заявленное изобретение, охарактеризованное в независимом пункте формулы, отличается от наиболее близкого аналога (отличительных признаков);
- выявление из уровня техники решений, имеющих признаки, совпадающие с отличительными признаками заявленного изобретения;
- анализ уровня техники в целях подтверждения известности влияния признаков, совпадающих с отличительными признаками заявленного изобретения, на указанный заявителем технический результат.

Изобретение признается не следующим для специалиста явным образом из уровня техники, если в ходе проверки не выявлены решения, имеющие признаки, совпадающие с его отличительными признаками, или такие решения выявлены, но не подтверждена известность влияния этих отличительных признаков на указанный заявителем технический результат.

Согласно пункту 77 Правил ИЗ не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные, в частности: на создании средства, состоящего из известных частей, выбор которых и связь между которыми осуществлены на основании известных правил, рекомендаций, а



достигаемый при этом технический результат обусловлен только известными свойствами частей этого средства и связей между ними; на применении продукта по определенному назначению, если новое назначение известного из уровня техники продукта обусловлено его известными свойствами, структурой, выполнением и известно, что именно такие свойства, структура, выполнение необходимы для реализации этого назначения;

Согласно подпункту 6 пункта 52 Требований ИЗ если при создании изобретения решается техническая проблема, состоящая в расширении арсенала технических средств определенного назначения или в создании средства определенного назначения впервые, технический результат состоит в реализации этого назначения.

Согласно подпункту 7 пункта 52 Требований ИЗ сущность изобретения, являющегося решением технической проблемы, состоящей в расширении арсенала технических средств определенного назначения или в создании средства определенного назначения впервые, выражается в совокупности существенных признаков, достаточной для реализации назначения изобретения;

Согласно пункту 52 Требований ИЗ формула изобретения предназначена для определения объема правовой охраны изобретения, предоставляемой на основании патента.

Анализ доводов возражения и доводов, содержащихся в решении Роспатента, показал следующее.

Существо заявленного технического решения изложено в приведенной выше формуле, которая представлена 1 (одним) независимым пунктом и 9 (девятью) зависимыми пунктами (пункты №№ 2-10).

Заявленное изобретение относится к применению ингибитора C5aR у пациентов с ятрогенными болями, вызванными индуцированной химиотерапией.

Согласно описанию заявки для предупреждения, лечения индуцированной химиотерапией ятрогенной боли в качестве ингибитора C5aR применяют 1-N-[4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил]-4-(трифторметил)-1H-1,3-тиазол-2-амин и

N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамида.

Анализ сведений, представленных в источниках информации [1]-[4], показал следующее.

Из источника информации [1] известно применение ингибитора C5aR для лечения боли, вызванной химиотерапией (например, паклитакселем), а именно, для лечения нейропатии, которая, в свою очередь выражается в болевых ощущениях, то есть, включает в себя боль, например, аллодинию.

Данная информация согласуется также с формулой изобретения, в зависимом пункте 2 которой указано на то, что ингибитор C5aR применяется для предупреждения или лечения аллодинии, ассоциированной с индуцированной химиотерапией ятрогенной болью.

То есть, указанная в зависимом пункте 2 вышеприведенной формулы изобретения аллодиния, ассоциированная с индуцированной химиотерапией болью и известная из ближайшего аналога, описанного в источнике информации [1], является частным случаем индуцированной химиотерапией ятрогенной боли, указанной в независимом пункте 1 вышеприведенной формулы.

Отличие заявленного изобретения от известного из источника информации [1] технического решения заключается в том, что в качестве используемого ингибитора C5aR применяют соединения формулы (I).

С учетом действующего законодательства, материалов заявки и высказанного заявителем мнения о том, что «технический результат может быть сформулирован, как применение для перорального введения для предупреждения или лечения индуцированной химиотерапией ятрогенной боли», в качестве технического результата, на осуществление которого направлено изобретение, рассматривается «реализация изобретением указанного назначения».

При этом из международной публикации [3] уже известно, что соединения формулы (I), указанные заявителем в вышеприведенной формуле изобретения, являются ингибиторами C5aR (см. формулу), а о том, что указанные в

вышеприведенной формуле изобретения соединения формулы (II), также являются ингибиторами C5aR, известно из международной публикации [4] (см. формулу).

Что касается международной публикации [2], то в ней раскрыты аналогичные формуле (I) соединения, используемые для лечения вызванной химиотерапией нейропатии (формула, абз.3, примеры).

То есть, специалисту в данной области техники до даты приоритета заявленного изобретения, уже было известно как о возможности применения ингибиторов C5aR для предупреждения и лечения вызванной индуцированной химиотерапией ятрогенной боли (источник информации [1]), так и о возможности использования известных из международных публикаций [3] и [4] соединений формул (I) и (II), указанных заявителем в вышеприведенной формуле изобретения в качестве ингибиторов C5aR, а также аналогичным формуле (I) соединениям, известным из международной публикации [2].

Таким образом, согласно действующему законодательству, изобретение по независимому пункту 1 вышеприведенной формулы, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку создано путем объединения сведений, содержащихся в уровне техники, и общих знаний специалиста, исходя из сведений, приведенных в источниках информации [1]-[4] (см. пункт 75 Правил ИЗ).

Соответственно, на основании сведений, изложенных в источниках информации [1]-[4], для специалиста в данной области техники явным образом следует возможность применения ингибитора C5aR для предупреждения или лечения индуцированной химиотерапией ятрогенной боли, где ингибитор C5aR выбран из соединения формул (I) или (II), указанных в независимом пункте 1 вышеприведенной формулы изобретения.

Что касается признаков зависимых пунктов 2-10, указанных в вышеприведенной формуле, то они также известны из источников информации [1] (см. стр. 1), [3] (см. формулу), [4] (см. формулу).

Следовательно, в соответствии с действующим законодательством, включение признаков зависимых пунктов 2-10 вышеприведенной формулы в независимый пункт 1 вышеприведенной формулы, не приведет к изменению вывода о несоответствии заявленного изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень» (пункты 75, 77 Правил ИЗ).

Таким образом, можно согласиться с правомерностью представленных в решении Роспатента от 23.01.2023 доводов, о несоответствии изобретения по вышеприведенной формулы условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку оно для специалиста оно явным образом следует из уровня техники (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

На заседании коллегии, состоявшемся 19.10.2023, заявитель обратился с просьбой принять к рассмотрению представленную 11.08.2023 с настоящим возражением уточненную им формулу изобретения, в следующей редакции:

«1. Применение ингибитора C5aR для перорального введения для предупреждения или лечения индуцированной химиотерапией ятрогенной боли, где ингибитор C5aR выбран из N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-амин; N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамида и их фармацевтически приемлемых солей.

2. Применение по п.1 для предупреждения или лечения аллодинии, ассоциированной с индуцированной химиотерапией ятрогенной болью.

3. Применение по п.1 или 2, где ингибитор C5aR выбран из N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамида и его хлорида.

4. Применение по п. 1 или 2, где ингибитор C5aR выбран из N-{4-[(1R)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил}-4-(трифторметил)-1,3-тиазол-2-амин и его соли натрия.

5. Применение по любому из предшествующих пунктов, где указанная индуцированная химиотерапией ятрогенная боль индуцирована

химиотерапевтическим средством, выбранным из лекарственных средств на основе платины, таксонов, эпотилонов, растительных алкалоидов, талидомида, леналидомида и помалидомида, карфилзомиба, бортезомиба и эрибулина, предпочтительно таксонов и лекарственных средств на основе платины.

6. Применение по п.5, где указанное химиотерапевтическое средство выбрано из цисплатина, карбоплатина, оксалиплатина, паклитаксела, кабазитаксела, доцетаксела, иксабепилона, винбластина, винкристина, винорелбина, этопозиды, талидомида, леналидомида, помалидомида, карфилзомиба, бортезомиба и эрибулина, предпочтительно паклитаксела».

Представленная заявителем формула уточнена путем указания, что ингибитор вводится перорально, а также уточнения ингибитора C5aR конкретным соединением.

Представленная заявителем формула изобретения была проверена на предмет включения в нее признаков, не раскрытых в материалах заявки на дату ее подачи.

Нарушений, которые могли бы привести к изменению сущности заявленного изобретения, выявлено не было. Уточненная заявителем формула изобретения была принята к рассмотрению.

На данном основании материалы заявки были направлены на дополнительный информационный поиск.

По результатам проведенного информационного поиска от 16.11.2023 был представлен отчет о поиске и заключение, согласно которым изобретение, охарактеризованное в уточненной формуле, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень» на основании информации, представленной в источниках [1], [3], [4], а также во вновь выявленном патентном документе ЕА 17250 В1, опубликованном 30.11.2012 (далее [5]).

Ознакомившись с результатами дополнительного информационного поиска, заявитель представил 12.12.2023 ответ, в котором выразил свое

несогласие с выводом, сделанном в заключении по результатам дополнительного информационного поиска.

Суть доводов заявителя сводится к тому, что из источников [1], [3], [4], [5] явным образом не следует лечение ятрогенной боли ингибитором C5aR при пероральном его введении.

Анализ сведений, содержащихся в источниках информации [1], [3], [4], [5] показал следующее.

Ближайшим аналогом для изобретения по независимому пункту 1 уточненной заявителем формулы является источник информации [Д1], из которого известно применение ингибитора C5aR для лечения вызванной химиотерапией (например, паклитакселем) нейропатии, которая в том числе включает боль (например, аллодинию) (см. стр. 1).

Как уже сказано в настоящем заключении выше, аллодиния, ассоциированная с индуцированной химиотерапией болью, является частным случаем индуцированной химиотерапией ятрогенной боли.

Отличием изобретения по независимому пункту 1 уточненной заявителем формулы от известного из источника информации [1] технического решения, является используемый ингибитор C5aR и его пероральное введение.

В качестве технического результата, на осуществление которого направлено изобретение, рассматривается «реализация изобретением указанного назначения».

При этом назначение изобретения реализуется ближайшим аналогом, известным из источника информации [1] (см. доводы выше).

Из международной публикации [3] известно, что соединение N-[(1R)-1-(4-трифторметансульфонилокси)фенилэтил]-4-пиперидин-1-илбутанамид является ингибитором C5aR, который вводится перорально (стр.10 строка 28, стр.20, пример 9, соединение 19).

Из международной публикации [4] известно, что соединение 1-N-[4-[(П1)-1-(1H-тетразол-5-ил)этил]фенил]-4-(трифторметил)-И,3-тиазол-2-амин является

ингибитором C5aR, который вводится перорально (стр.7 строка 23, стр.5 (строка 18), пример 2 на стр.12 (соединение 1)).

Из патентного документа [5] известно пероральное введение активного вещества при лечении индуцированной химиотерапией ятрогенной боли (стр.42 абз.3, стр.36 абз.5).

Таким образом, изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 1 уточненной заявителем формулы, не соответствует условию патентоспособности «изобретательский уровень», поскольку создано путем объединения сведений, содержащихся в уровне техники, и общих знаний специалиста, на основании известных из источников информации [1], [3]-[5] сведений (пункт 75 Правил ИЗ).

Что касается признаков зависимых пунктов 2-6 уточненной заявителем формулы, то они также известны из источников информации [1] (см. стр.1), [3] (см. формулу) и [4] (см. формулу).

Таким образом, можно констатировать, что заявителем не представлено доводов, позволяющих признать неправомерным вывод, сделанный как в решении Роспатента от 23.01.2023, так и в заключении по результатам дополнительного информационного поиска от 16.11.2023, о несоответствии заявленного изобретения условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Учитывая вышеизложенное, коллегия пришла к выводу о наличии оснований для принятия Роспатентом следующего решения:

**отказать в удовлетворении возражения, поступившего 11.08.2023, решение Роспатента от 23.01.2023 оставить в силе.**