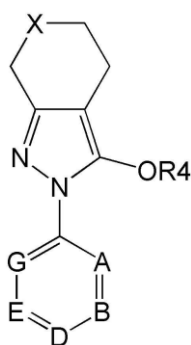


ЗАКЛЮЧЕНИЕ
коллегии палаты по патентным спорам
по результатам рассмотрения возражения заявления

Коллегия в порядке, установленном пунктом 3 статьи 1248 части четвертой Гражданского кодекса Российской Федерации, введенной в действие с 01.01.2008 Федеральным законом от 18.12.2006 № 231-ФЗ, в редакции Федерального закона от 12.03.2014 № 35-ФЗ «О внесении изменений в части первую, вторую и четвертую Гражданского кодекса Российской Федерации и отдельные законодательные акты Российской Федерации» (далее-Кодекс), и Правилами рассмотрения и разрешения федеральным органом исполнительной власти по интеллектуальной собственности 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 № 59454 с изменениями, внесенными приказом Минобрнауки России и Минэкономразвития России от 23.11.2022 № 1140/646 (далее – Правила ППС), рассмотрела возражение компании АПТАБИО ТЕРАПЬЮТИКС ИНК., Республика Корея (далее – заявитель), поступившее 05.03.2025, на решение Федеральной службы по интеллектуальной собственности (далее Роспатент) от 07.08.2024 об отказе в выдаче патента Российской Федерации на изобретение по заявке № 2022120028, при этом установлено следующее.

Заявлена группа изобретений «Новое производное пиразола», охарактеризованная в формуле, представленной в корреспонденции от 24.06.2023, в следующей редакции:

1. Соединение приведенной ниже химической формулы I-1 или его фармацевтически приемлемая соль
химическая формула I-1



в которой

X представляет собой NR₃; и

R₃ выбран из Ra-L-, Ra-L-CO-, Ra-L-NHCO-, Ra-L-OCO- и Ra-L-SO₂-; и

Ra выбран из циано, галогена, замещенного или незамещенного C₁-C₅ прямого или разветвленного алкила, C₂-Сбалкинила, C₂-Сбалкенила, незамещенного C₃-C₈циклоалкила, замещенного или незамещенного C₆-C₂₀арила, или замещенного или незамещенного C₅-C₂₀гетероарила, и гетероарил содержит 1, 2 или 3 гетероатома из O, N и S; и

L выбран из прямой связи, C₁-C₅алкилена или замещенного или незамещенного

C₆-C₁₀арилена; и

R₄ выбран из водорода или незамещенного C₁-C₅алкила; и

A представляет собой CR₅ или N, и B представляет собой CR₆, и D представляет собой CR₇, и E представляет собой CR₈, и G представляет собой CR₉ или N, где количество N в A, B, D, E и G равно 0 или 1; и

радикалы с R₅ по R₉ являются одинаковыми или разными, и каждый независимо выбран из водорода, циано, галогена, карбонила, нитро, карбоксила, C₁-C₅алкокси, замещенного или незамещенного C₁-C₅ прямого или разветвленного алкила, незамещенной аминогруппы, и две или более группы, смежные друг с другом, могут быть объединены друг с другом с образованием незамещенного C₅-C₁₀гетероарильного кольца, содержащего 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N и S; и

замещенный C₁-C₅ прямой или разветвленный алкил может быть независимо замещен одним или более чем одним заместителем, выбранным из

галогена, замещенного или незамещенного C₆-C₂₀арила или C₅-C₂₀гетероарила, содержащего 1 гетероатом, выбранный из N и O; и

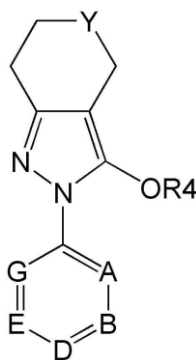
замещенный C₆-C₂₀арил или замещенный C₅-C₂₀гетероарил может быть независимо замещен одним или более чем одним заместителем, выбранным из галогена, циано, нитро, замещенной аминогруппы, C₁-C₅алкокси, C₁-C₅галогеналкила, C₁-C₁₀алкила, C₃-C₈циклоалкила; и

замещенная аминогруппа может быть замещена одной или двумя C₁-C₅алкильными группами; и

замещенный C₆-C₁₀арилен может быть замещен одним или более чем одним заместителем, выбранным из C₁-C₃алкила, галогена.

2. Соединение приведенной ниже химической формулы I-2 или его фармацевтически приемлемая соль

химическая формула I-2



в которой

Y представляет собой NR₃, и

R₃ выбран из Ra-L-; и

Ra выбран из замещенного или незамещенного C₆-C₁₀арила, или незамещенного C₅-C₁₀гетероарила, и гетероарил содержит 1, 2 или 3 гетероатома N; и

L представляет собой C₁-C₅алкилен; и

R₄ представляет собой водород; и

A представляет собой CR₅ или N, и B представляет собой CR₆, и D представляет собой CR₇, и E представляет собой CR₈, и G представляет собой CR₉ или N, где количество N в A, B, D, E и G равно 0 или 1; и

радикалы с R5 по R9 являются одинаковыми или разными, и каждый независимо выбран из водорода, циано, галогена, карбоксила, замещенного или незамещенного C1-C5 прямого или разветвленного алкила, и две или более группы, смежные друг с другом, могут быть объединены друг с другом с образованием незамещенного ароматического углеводородного кольца, где ароматическое углеводородное кольцо может образовывать C5-C10 гетероарильное кольцо, содержащее 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N и S; и

замещенный C1-C5 прямой или разветвленный алкил может быть независимо замещен одним или более чем одним заместителем, выбранным из галогена; и

замещенный C6-C10 арил может быть независимо замещен одним или более чем одним заместителем, выбранным из галогена, циано, замещенной аминогруппы, и C1-C5 галогеналкила; и

замещенная аминогруппа может быть замещена одной или двумя C1-C5 алкильными группами.

3. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по п. 1,

где R3 выбран из Ra-L-, Ra-L-CO-, Ra-L-NHCO-, Ra-L-OCO- и Ra-L-SO₂-; и

L выбран из прямой связи, и C1-C3 алкилена, и замещенного или незамещенного фенилена; и

A представляет собой CR5 или N, и B представляет собой CR6, и D представляет собой CR7, и E представляет собой CR8, и G представляет собой CR9 или N, где A или G представляет собой N.

4. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по п. 2, где R3 представляет собой Ra-L-;

L представляет собой C1-C3 алкилен; и

A представляет собой CR5 или N, и B представляет собой CR6, и D представляет

собой CR7, и E представляет собой CR8, и G представляет собой CR9 или N, где A или

G представляет собой N.

5. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по п. 1, где R3 выбран из Ra-L-, Ra-L-CO-, Ra-L-NHCO-, Ra-L-OCO- и Ra-L-SO₂-; и L выбран из прямой связи, и C1-C3алкилена, и замещенного или незамещенного фенилена; и

A представляет собой CR5, и B представляет собой CR6, и D представляет собой CR7, и E представляет собой CR8, и G представляет собой CR9.

6. Соединение или его соль,

где указанное соединение выбрано из следующих соединений:

2-(5-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-индазол-3-ола;

6-бензил-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-2-(5-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-(4-фторбензил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-(4-метилбензил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

4-((3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6H-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-ил)метил)бензонитрила;

6-(3,5-дифторбензил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

2-(пиридин-2-ил)-6-(3-(трифторметил)бензил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-(нафталин-2-илметил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

1-(4,5-дигидро-3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-6(7H)-ил)бутан-1-она;

1-(3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-ил)этан-1-она;

6-(4-метоксибензил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-этил-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-(проп-2-ин-1-ил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-пропил-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-аллил-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

(3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-ил)(фенил)метанона;

бензил-3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-карбоксилата;

(4-хлорфенил)(3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-5-ил)метанона;

этил-3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-карбоксилата;

N-циклогексил-3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-карбоксамид;

фуран-2-ил(3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-ил)метанона;

6-(метилсульфонил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-(фенилсульфонил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

N-(4-фторфенил)-3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-карбоксамид;

N-(4-фторбензил)-3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-карбоксамид;

N-(фуран-2-илметил)-3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6H-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-карбоксамид;

N-(4-хлорфенетил)-3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6H-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-карбоксамид;

6-(нафталин-2-илсульфонил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

4-нитробензил-3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,5,7-тетрагидро-6H-пиразоло[3,4-с]пиридин-6-карбоксилата;

5-бензил-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-2-(5-хлорпиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

4-(6-бензил-3-гидрокси-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-2-ил)бензойной кислоты;

6-бензил-2-(4-бромфенил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-2-фенил-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(5-трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(4-бромфенил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(2-хлорфенил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-2-(2-хлорфенил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-2-(2-метоксифенил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(5-хлорпиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(6-метил-4-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(тиено[3,2-с]пиридин-4-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-(нафталин-2-илметил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-(нафталин-2-илметил)-2-(5-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-(3-(трифторметил)бензил)-2-(5-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-(3,5-дифторбензил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-(3,5-дифторбензил)-2-(5-трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-3-метокси-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридина;

6-(6-бензил-3-гидрокси-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-2-ил)никотинонитрила;

6-бензил-2-(6-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-2-(3-фторпиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-2-(6-метилпиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-2-(6-метил-4-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(6-метилпиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(6-трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

6-(5-бензил-3-гидрокси-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил)никотинонитрила;

5-бензил-2-(3-фторпиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(тиено[3,2-с]пиридин-4-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-бензил-2-(6-метил-4-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

6-бензил-2-(тиено[3,2-с]пиридин-4-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

2-(пиридин-2-ил)-6-(пиридин-2-илметил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

2-(пиридин-2-ил)-6-(пиридин-4-илметил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-(4-(диметиламино)бензил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-(3-(диметиламино)бензил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

2-(6-аминопиридин-2-ил)-6-бензил-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

5-(4-(диметиламино)бензил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-(3-(диметиламино)бензил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

2-(пиридин-2-ил)-6-(хинолин-6-илметил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

6-(изохинолин-3-илметил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[3,4-с]пиридин-3-ола;

4-((3-гидрокси-2-(пиридин-2-ил)-2,4,6,7-тетрагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил)метил)бензонитрила;

4-((3-гидрокси-2-(5-(трифторметил)пиридин-2-ил)-2,4,6,7-тетрагидро-5Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-5-ил)метил)бензонитрила;

2-(пиридин-2-ил)-5-(3-(трифторметил)бензил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-(3-(трифторметил)бензил)-2-(5-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-(изохинолин-3-илметил)-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

5-(изохинолин-3-илметил)-2-(5-(трифторметил)пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-3-ола;

4-(5-бензил-3-гидрокси-4,5,6,7-тетрагидро-2Н-пиразоло[4,3-с]пиридин-2-ил)бензойной кислоты.

7. Фармацевтическая композиция для предупреждения или лечения заболевания, связанного с окислительным стрессом, содержащая эффективную дозу соединения по любому из п. 1 или п. 2 или его фармацевтически приемлемую соль в качестве активного ингредиента и фармацевтически приемлемый носитель.

8. Фармацевтическая композиция по п. 7, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой один или более чем один, выбранный из группы, состоящей из эксципиентов, разбавителей, разрыхлителей, связующих веществ, смазывающих веществ, поверхностно-активных веществ, эмульгаторов, суспендирующих агентов и разбавителей.

9. Фармацевтическая композиция по п. 7, где заболевание, связанное с окислительным стрессом, выбрано из рака, неалкогольного стеатогепатита, фиброза печени, фиброза легких и болезни Паркинсона, где рак выбран из группы, состоящей из рака печени, гепатоцеллюлярной карциномы, рака желудочно-кишечного тракта, рака желудка, менингиомы, ассоциированной с нейрофиброматозом, рака поджелудочной железы, лейкоза, миелопролиферативного/миелодиспластического заболевания, фибросаркомы кожи, рака молочной железы, рака легких, рака щитовидной железы, колоректального рака, рака предстательной железы, рака молочной железы, рака яичников, опухоли головного мозга, рака головы и шеи, и глиобластомы.

- в н.п.1 формулы изобретения заявлено соединение формулы I-1 или его фармацевтически приемлемая соль;

- в н.п.2 формулы изобретения заявлено соединение формулы I-2 или его фармацевтически приемлемая соль;

- в н.п.6 заявлены индивидуальные соединения или их соли;

- в н.п.7 заявлена фармацевтическая композиция, содержащая соединение по любому из п.1 или п.2.

По результатам проведения экспертизы по существу Роспатентом было принято решение об отказе в выдаче патента ввиду несоответствия изобретения по пункту 1 формулы условию патентоспособности «новизна», изобретений по пунктам 1, 2, 6, 7 формулы (частично) условию патентоспособности «изобретательский уровень».

В подтверждение данного мнения в решении указаны следующие источники информации:

- Database REGISTRY [Online], RN 1785186-32-4, 21.06.2015, Retrieved from STN (источник Д16) (далее [1]);

- патентный документ WO 2011101804 A1, дата публикации 25.08.2011, (источник Д1) (далее [2]);

- патентный документ WO 2011101805 A1, дата публикации 25.08.2011 (источник Д26) (далее [3]).

Данное решение мотивировано тем, что изобретение, охарактеризованное в независимом пункте 1 вышеприведенной формулы, не соответствует условию патентоспособности «новизна», поскольку включает известное из источника информации (источник Д16) [1] соединение, соответствующее формуле I-1.

Кроме того, соединения по пунктам 1 и 6 (частично) формулы подпадают под общую формулу группы известных из патентного документа (источник Д26) [3] соединений.

Соединения по пунктам 2 и 6 (частично) формулы подпадают под общую формулу группы известных из патентного документа (источник Д1) [2] соединений.

При этом в решении Роспатента отмечено в патентном документе (источник Д1) [2] и в патентном документе (источник Д26) [3] раскрыто, что соединения могут быть активны в отношении ингибирования NOX и образования АФК.

Вместе с тем в решении Роспатента отмечено, что предложенная в пункте 7 формулы фармацевтическая композиция отличается от известных из патентных документов [2] (пункты 1, 18 формулы изобретения) и [3] (пункты 1,

17 формулы изобретения) тем, что в качестве активного начала содержит соединения по пунктам 1, 2 формулы. Однако заявленные соединения обладают тем же видом биологической активности, что и известные. В материалах заявки отсутствуют сведения о новых неизвестных свойствах для всех заявленных соединений.

Следовательно, заявленные соединения и известные из патентных документов [2] и [3] проявляют одни и те же свойства в качественном отношении, а именно, являются ингибиторами активности в отношении NOX и образования АФК.

В решении Роспатента сделан вывод о том, что пункты 1, 2, 6 и 7 формулы не могут быть признаны соответствующими условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Целесообразно отметить, что в ходе рассмотрения заявки по существу, экспертиза указывала заявителю на данные и аналогичные им обстоятельства, однако не все замечания были учтены заявителем, что повлекло за собой решение об отказе в выдаче патента.

На решение об отказе в выдаче патента на группу изобретений в соответствии с пунктом 3 статьи 1387 Кодекса поступило возражение, к которому приложено ходатайство об изменении испрашиваемого объема правовой охраны и уточненная формула группы изобретений, в которую внесены следующие изменения:

- пункт 1 формулы уточнен путем включения признаков зависимого пункта 3 формулы;
- пункт 2 формулы уточнен путем включения признаков зависимого пункта 3 формулы;
- пункты 3-5 формулы исключены;
- включен новый зависимый пункт 3 на основании пункта 4 первоначальной формулы изобретения;
- нумерация и зависимости остальных пунктов скорректированы соответствующим образом;

- из пункта 6 формулы исключены соединения 34-36, 38-41 и 78, которые, после внесения изменений, не охватываются общими химическими формулами I-1 и I-2 согласно пунктам 1 и 2 уточненной формулы.

При этом заявитель представил доводы в поддержку патентоспособности изобретений по уточненной формуле.

В корреспонденции, поступившей 30.05.2025 заявителем представлены дополнения к возражению, в которых отмечено, что изобретения, предложенные в формуле, имеют структурные различия, что приводит к значительным конформационным вариациям, которые в конечном итоге влияют на фармацевтические эффекты соединений, что обусловлено сложной природой фармакологического действия, присущей химическим соединениям структурной сложностью, а также механизмами действия соединений.

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

С учетом даты подачи заявки (12.01.2021) правовая база для оценки патентоспособности включает Кодекс, действовавший на дату подачи заявки, Правила составления, подачи и рассмотрения документов, являющихся основанием для совершения юридически значимых действий по государственной регистрации изобретений, и их формы (далее – Правила ИЗ), утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 № 42800, с изменениями, внесенными на 10.11.2020 №746, Требования к документам заявки на выдачу патента на изобретение (далее – Требования ИЗ), утвержденные приказом Министерства экономического развития РФ от 25.05.2016 № 316, зарегистрированным в Минюсте РФ 11.07.2016 № 42800 с изменениями, внесенными на 10.11.2020 №746.

Согласно пункту 1 статьи 1350 Кодекса изобретению предоставляется правовая охрана, если оно является новым, имеет изобретательский уровень и промышленно применимо.

Согласно пункту 2 статьи 1350 Кодекса изобретение имеет

изобретательский уровень, если для специалиста оно явным образом не следует из уровня техники.

Уровень техники включает любые сведения, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Согласно пункту 70 Правил ИЗ химическое соединение, подпадающее под общую структурную формулу группы известных соединений, или композиция на его основе признаются соответствующими условию новизны, если химическое соединение как таковое неизвестно из уровня техники и отсутствуют сведения относительно исходных соединений, способа его получения и его свойств, ставшие общедоступными в мире до даты приоритета изобретения.

Согласно пункту 75 Правил ИЗ при проверке изобретательского уровня изобретение признается имеющим изобретательский уровень, если установлено, что 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.

При проверке изобретательского уровня изобретения, относящегося к композиции, признаки, указанные в подпункте 3 пункта 39 Требований к документам заявки, не учитываются.

Согласно пункту 77 Правил ИЗ не признаются соответствующими условию изобретательского уровня изобретения, основанные, в частности:

- на выборе оптимальных или рабочих значений параметров, если подтверждена известность влияния этих параметров на технический результат, а выбор может быть осуществлен обычным методом проб и ошибок или применением обычных технологических методов или методов конструирования.

Согласно пункту 78 Правил ИЗ условию изобретательского уровня соответствуют, в частности, химическое соединение, подпадающее под общую структурную формулу группы известных соединений, но не описанное как специально полученное и исследованное и при этом проявляющее новые неизвестные для этой группы свойства в качественном или количественном отношении (селективное изобретение).

Согласно подпункту 3 пункта 39 Требований ИЗ не допускается для характеристики композиции в качестве ее признаков использовать сведения, непосредственно к композиции не относящиеся (например, условия и режимы использования этой композиции в каком-либо процессе, способе), количественный (измеряемый или рассчитываемый) параметр, характеризующий одно или более свойств композиции, в случаях, когда этот параметр является отличительным признаком в характеристике композиции в независимом пункте формулы (например, параметры прочности ламинирования, сопротивления растрескиванию при напряжении,

фармакокинетического профиля и тому подобное), технический результат, проявляющийся при изготовлении или использовании композиции. При характеристике фармацевтической композиции не допускается использование признаков, относящихся к способу лечения или профилактики заболевания (например, указание доз, условий или режимов применения композиции или лекарственных средств, полученных на ее основе).

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

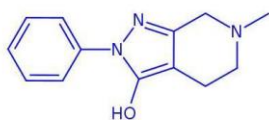
Согласно подпункту 2 пункта 53 Требований ИЗ формула изобретения должна быть полностью основана на описании изобретения, то есть определяемый формулой изобретения объем правовой охраны изобретения должен быть подтвержден описанием изобретения.

Согласно пункту 39 Правил ППС в рамках рассмотрения возражения лицо, подавшее возражение, вправе ходатайствовать об изменении испрашиваемого объема правовой охраны изобретения, при условии, если испрашиваемые изменения могут устранить причины, препятствующие предоставлению правовой охраны заявленному объекту, либо в случае, если без внесения соответствующих изменений в предоставлении правовой охраны должно быть отказано в полном объеме, а при их внесении – частично.

Существо заявленной группы изобретений выражено в приведенной выше формуле.

Анализ доводов, содержащихся в возражении и решении Роспатента, с учетом материалов заявки, касающихся оценки соответствия заявленной группы изобретений условию патентоспособности «новизна», показал следующее.

Следует согласиться с доводом, изложенным в решении Роспатента о том, что из независимого пункта 1 формулы не исключено соединение, известное из источника информации [1] (источник Д16) имеющее структурную формулу



из которой видно, что заместитель у атома N в тетрагидропиразолопиридиновом фрагменте, который соответствует заместителю R3 у соединений по пункту 1, не представляет собой H, а является метилом и по-прежнему соответствует структурной формуле I-1 предложенных соединений.

Соответственно вывод, сделанный в решении Роспатента о несоответствии изобретения по пункту 1 вышеприведенной формулы условию патентоспособности «новизна» сделан правомерно (пункт 1 статьи 1350 Кодекса).

Анализ доводов, содержащихся в возражении и решении Роспатента, с учетом материалов заявки, касающихся оценки соответствия заявленной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень», показал следующее.

Также следует согласиться с доводом, изложенным в решении Роспатента о том, что согласно общей формуле соединений, раскрытых в патентных документах [2] (источник Д1) (п.1 формулы изобретения) и [3] (источник Д26) (п.1 формулы изобретения), в положении, соответствующем заместителю OR4, указана оксо-группа (=O). При этом в патентном документе [2] (с.79 строка 29) и в патентном документе [3] (с.85 строка 29) указано, что известные соединения также включают и таутомеры соединений.

Кроме того, изобретения, известные из патентных документов [2] и [3] направлены на достижение того же технического результата, что и предложенные, а именно предоставление ингибиторов в отношении активности NOX и образования активных форм кислорода (АФК).

Соответственно, для специалиста в данной области техники очевидно, что соединения, охарактеризованные общими формулами, известные из патентного документа [3] (реферат, с.19-26, 46-49, 75-83 соединение формулы

(Ia), пункты 1, 17 формулы) включают предложенные соединения по независимым пунктам 1 и 6 (частично) вышеприведенной формулы в случае когда R4 представляет собой водород.

Соединения по независимым пунктам 2 и 6 (частично) формулы соединения подпадают под общую структурную формулу группы известных из патентного документа [2] (реферат, с.4, 19-22, 28-31, 50-52, 59-70, 70-74 описания, примеры, пп.1, 18 формулы) соединений.

Таким образом, упомянутые выше соединения, предложенные в заявке, не описаны в патентных документах [2] и [3] как специально полученные и исследованные, однако обладают тем же видом активности.

При этом на основании имеющихся в первоначальных материалах заявки данных видно, что не все из тестируемых соединений имеют значения IC50 в дифференцированных клетках HL-60, составляющие менее 0,5 мкМ.

Вместе с тем необходимо отметить, что сравнение показателя IC50, в частности предложенных и известных соединений, требует тщательной унификации экспериментальных условий в опытах с ними.

Однако данные, подтверждающие биологическую активность предложенных соединений, получены при проведении исследований в условиях, отличающихся от экспериментов, описанных в патентных документах [2] и [3].

Следовательно, не представляется возможным однозначно утверждать, что все предложенные соединения проявляют новые неизвестные свойства в количественном отношении по сравнению с известными соединениями (пункт 78 Правил).

Вместе с тем, предложенная в независимом пункте 7 фармацевтическая композиция отличается от композиций, известных из патентных документов [2] (пп.1, 18 формулы) и [3] (пп.1, 17 формулы) тем, что в качестве активного начала содержит соединения по независимым пунктам 1 и 2 формулы, которые при этом обладают тем же видом биологической активности, а в материалах заявки отсутствуют сведения о новых неизвестных свойствах для

всех предложенных соединений.

Соответственно, на основании сведений, раскрытых в патентных документах [2] и [3] для специалиста будет явным образом следовать возможность применения предложенных соединений в виде фармацевтической композиции по указанному назначению (пункт 77 Правил)

Таким образом, необходимо констатировать, что вывод, сделанный в решении Роспатента о несоответствии предложенной группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень» правомерен (пункт 2 статьи 1350 Кодекса).

Вместе с тем в соответствии с пунктом 39 Правил ППС, заявителем с возражением представлено ходатайство об изменении испрашиваемого объема правовой охраны группы изобретений.

Однако, в ходе рассмотрения возражения, заявителем в корреспонденции, поступившей 30.05.2025, была представлена новая уточненная формула изобретения, в которой по отношению к формуле изобретения, по которой было вынесено решение об отказе в выдаче патента, были сделаны следующие изменения:

- независимый пункт 1 формулы уточнен путем включения признаков зависимого пункта 3 формулы (основание: пункты 4-8 первоначальной формулы изобретения);

- пункт 1 формулы дополнительно ограничен путем исключения значения «водород» из значений радикала R4 соединения формулы I-1;

- независимый пункт 2 формулы исключен;

- зависимые пункты 3 и 5 формулы исключены;

- нумерация и зависимости остальных пунктов формулы скорректированы соответствующим образом;

- независимый пункт 6 формулы ограничен одним индивидуальным соединением 6-бензил-3-метокси-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин (соединение 53).

Кроме того, заявитель представляет дополнительные

экспериментальные данные, демонстрирующие ингибирующий эффект в отношении выработки АФК для двух индивидуальных соединений, раскрытых в описании изобретения (соединения 38 и 53).

Уточненная формула изобретения была принята к рассмотрению. В отношении уточненных притязаний необходимо отметить следующее.

Независимый пункт 1 (зависимый пункт 2) относится к соединению химической формулы I-1.

При этом из формулы исключены признаки, характеризующие известное соединение и исключены признаки, в части которых, в решении Роспатента был сделан вывод о несоответствии группы изобретений условию патентоспособности «изобретательский уровень».

Таким образом, соединения по уточненному независимому пункту 1 формулы не подпадают под известные из патентных документов [2] и [3] соединения, а оставшиеся в уточненной формуле соединения имеют иную химическую природу и их получение и применение с достижением, указанного в описании заявки технического результата, с учетом сведений, раскрытых в источниках информации [2] и [3], не является очевидным для специалиста в данной области техники.

Независимый пункт 3 относится к индивидуальному соединению, соответствующему примеру 53, которое было признано патентоспособным в решении Роспатента.

Независимый пункт 4 (зависимые пункты 5-6) относится к фармацевтической композиции на основе соединений по пункту 1 уточненной формулы, которые как изложено выше являются новыми, не подпадают под группу известных из уровня техники соединений и не являются очевидными для специалиста в данной области техники.

Таким образом, изобретения по независимым пунктам 1, 3 и 4 уточненной формулы соответствуют условию патентоспособности «изобретательский уровень» согласно пункту 2 статьи 1350 Кодекса.

Необходимо констатировать, что не выявлено препятствий для выдачи

патента Российской Федерации на изобретения, охарактеризованные в представленной заявителем 30.05.2024, уточненной формуле группы изобретений.

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

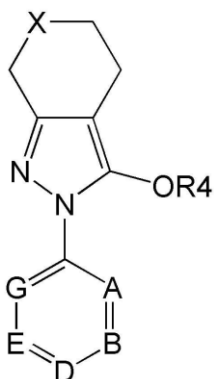
удовлетворить возражение, поступившее 05.03.2025, отменить решение Роспатента от 07.08.2024 и выдать патент Российской Федерации на изобретение с формулой, представленной в корреспонденции, поступившей 30.05.2025.

(21) 2020120028

(51) МПК

C07D 401/04 (2006.01) **C07D 495/04** (2006.01) **A61P 1/16** (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01) **C07D 519/00** (2006.01) **A61P 25/16** (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01) **A61K 31/437** (2006.01) **A61P 25/28** (2006.01)
C07D 409/04 (2006.01) **A61K 31/4436** (2006.01) **A61P 29/00** (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01) **A61K 31/4725** (2006.01)

(57) 1. Соединение приведенной ниже химической формулы I-1 или его фармацевтически приемлемая соль химическая формула I-1



в которой

X представляет собой NR₃; и

R₃ выбран из Ra-L-, Ra-L-CO-, Ra-L-NHCO-, Ra-L-OCO- и Ra-L-SO₂-; и

Ra выбран из циано, галогена, замещенного или незамещенного C₁-C₅ прямого или разветвленного алкила, C₂-С6алкинила, C₂-С6алкенила, незамещенного C₃-C₈циклоалкила, замещенного или незамещенного C₆-C₂₀арила, или замещенного или незамещенного C₅-C₂₀гетероарила, и гетероарил содержит 1, 2 или 3 гетероатома из O, N и S; и

L выбран из прямой связи, и C₁-C₃алкилена, и замещенного или незамещенного фенилена; и

R4 представляет собой незамещенный C1-C5алкил; и

A представляет собой CR5 или N, и B представляет собой CR6, и D представляет собой CR7, и E представляет собой CR8, и G представляет собой CR9 или N, где A или G представляет собой N; и

радикалы с R5 по R9 являются одинаковыми или разными, и каждый независимо выбран из водорода, циано, галогена, карбонила, нитро, карбоксила, C1-C5алкокси, замещенного или незамещенного C1-C5 прямого или разветвленного алкила, незамещенной аминогруппы, и две или более группы, смежные друг с другом, могут быть объединены друг с другом с образованием незамещенного C5-C10гетероарильного кольца, содержащего 1, 2 или 3 гетероатома, выбранных из N и S; и

замещенный C1-C5 прямой или разветвленный алкил может быть независимо замещен одним или более чем одним заместителем, выбранным из галогена, замещенного или незамещенного C6-C20арила или C5-C20гетероарила, содержащего 1 гетероатом, выбранный из N и O; и

замещенный C6-C20арил или замещенный C5-C20гетероарил может быть независимо замещен одним или более чем одним заместителем, выбранным из галогена,

циано, нитро, замещенной аминогруппы, C1-C5алкокси, C1-C5галогеналкила, C1-C10алкила, C3-C8циклоалкила; и

замещенная аминогруппа может быть замещена одной или двумя C1-C5алкильными группами; и

замещенный C6-C10арилен может быть замещен одним или более чем одним заместителем, выбранным из C1-C3алкила, галогена.

2. Соединение или его фармацевтически приемлемая соль по п. 1, где R3 представляет собой Ra-L-;

L представляет собой C1-C3 алкилен; и

А представляет собой CR5 или N, и В представляет собой CR6, и D представляет собой CR7, и Е представляет собой CR8, и G представляет собой CR9 или N, где А или G представляет собой N.

3. Соединение или его соль, где указанное соединение представляет собой 6-бензил-3-метокси-2-(пиридин-2-ил)-4,5,6,7-тетрагидро-2H-пиразоло[3,4-с]пиридин.

4. Фармацевтическая композиция для предупреждения или лечения заболевания, связанного с окислительным стрессом, содержащая эффективную дозу соединения по любому из п. 1 или его фармацевтически приемлемую соль в качестве активного ингредиента и фармацевтически приемлемый носитель.

5. Фармацевтическая композиция по п. 4, где фармацевтически приемлемый носитель представляет собой один или более

чем один, выбранный из группы, состоящей из эксципиентов, разбавителей,

разрыхлителей, связующих веществ, смазывающих веществ, поверхностно-активных

веществ, эмульгаторов, суспендирующих агентов и разбавителей.

6. Фармацевтическая композиция по п. 4, где заболевание, связанное с окислительным стрессом, выбрано из рака, неалкогольного стеатогепатита, фиброза печени, фиброза легких и болезни Паркинсона, где рак выбран из группы, состоящей из рака печени, гепатоцеллюлярной карциномы, рака желудочно-кишечного тракта, рака желудка, менингиомы, ассоциированной с нейрофиброматозом, рака поджелудочной железы, лейкоза, миелопролиферативного/миелодиспластического заболевания, фибросаркомы кожи, рака молочной железы, рака легких, рака щитовидной железы, колоректального рака, рака предстательной железы, рака молочной

железы, рака яичников, опухоли головного мозга, рака головы и шеи, и глиобластомы.

(56) WO 2011101804 A1, 25.08.2011

WO 2011101805 A1, 25.08.2011