

Вих. № 0380-06/25  
Від 05.06.2025

Державна організація “Український національний офіс інтелектуальної власності та інновацій” (УКРНОІВІ)

-----  
01601, м. Київ-42, вул. Дмитра Годзенка, 1

Відділення експертизи заявок на винаходи, корисні моделі та топографії інтегральних мікросхем

До уваги провідного експерта сектору органічної хімії, медицини та фармацевтики Гаркавенко Оксани

Заявка № **a202100047**  
Назва **КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА МІСТИТЬ ДЕЛАМАНІД [UA]**  
Заявник **ОЦУКА ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД. [JP]**  
Дата подання **11.06.2019**

### **ЗАУВАЖЕННЯ ЩОДО ВІДПОВІДНОСТІ ЗАЯВЛЕНОГО ВИНАХОДУ УМОВАМ НАДАННЯ ПРАВОВОЇ ОХОРОНИ**

У відповідності до частини вісімнадцятої статті 16 Закону України «Про охорону прав на винаходи і корисні моделі» (далі – Закон), після публікації відомостей про заявку на винахід будь-яка особа може подати до НОІВ зауваження щодо відповідності заявленого винаходу умовам надання правової охорони, визначеним цим Законом.

Діючи від імені та за дорученням Довірителя – БЛАГОДІЙНОЇ ОРГАНІЗАЦІЇ «ВСЕУКРАЇНСЬКА МЕРЕЖА ЛЮДЕЙ, ЯКІ ЖИВУТЬ З ВІЛ/СНІД» (БО «100 ВІДСОТКІВ ЖИТТЯ»), просимо Експертизу прийняти зауваження, підставою для подання якого є те, що заявлений винахід за вищезазначеною заявкою не відповідає вимогам частин першої та другої статті 6 Закону та умовам патентоздатності, встановленими статтею 7 Закону.

#### **I. Об'єкт зауваження**

Заявка № а202100047 на винахід «КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА МІСТИТЬ ДЕЛАМАНІД», подана в Україні як національна фаза міжнародної заявки РСТ/JP2019/023006, опублікованої під номером WO2019240104 (A1).

Згідно із зазначеним в описі, цей винахід стосується композиції, яка містить деламанід, способу отримання такої композиції і т. п.

У відповідь на Попередній висновок за № 1958/3А/25 від 27.01.2025, згідно з яким заявлений винахід не відповідає умовам патентоздатності «новизна» та «винахідницький рівень», на розгляд кваліфікаційної експертизи Заявником представлено змінену формулу, яка містить 12 пунктів, з яких:

- пункти 1-10 стосуються композиції, яка містить частинки деламаніду і стабілізатор поверхні, який містить полімер і поверхнево-активну речовину. У відповідності до зміненого незалежного п. 1 полімер вибраний із групи, яка складається з гідроксипропілцелюлози, гідроксипропілметилцелюлози, полівінілпіролідону і щеплених полімерів полівінілкапролактам-полівінілацетат-поліетиленгліколь, а поверхнево-активна речовина включає неіонні і/або аніонні поверхнево-активні речовини;
- пункти 11 та 12 стосуються фармацевтичного перорального твердого складу заявленої композиції.

## II. Підстави для зауваження

### 1. Відсутність винахідницького рівня

Технічна задача, яка вирішується заявленим винаходом *«отримання тонких частинок деламаніду способом, який був би настільки економічним, наскільки це можливо, і який мав би низьке навантаження на навколишнє середовище»*...*«нелегко ефективно подрібнювати деламанід і запобігти агрегації після подрібнення. Крім того, деламанід є надзвичайно гідрофобним і, таким чином, його важко подрібнювати у воді»*.

За визначенням Заявника, *«коли деламанід і певний стабілізатор поверхні змішували і піддавали вологому помелу, було можливо ефективно подрібнити деламанід до субмікронних частинок, а також запобігти утворенню вторинних частинок»*.

Варто підкреслити, що заявлена технічна проблема і її вирішення в такий спосіб є відомою з цитованого в Попередньому висновку рівня техніки, а сукупність ознак за

зміненою формулою не має належного обґрунтування в межах первинних матеріалів заявки з огляду на наступне.

Зміни формули стосуються обмеження в незалежному п. 1 формули полімерів чотирма сполуками з багатьох представлених в первинному описі.

Підставами для таких змін є приклади таблиці 1 опису та фігури 1a і 1b доданих креслень первинних матеріалів заявки. Однак приклади таблиці демонструють підвищення ефективності помелу деламаніду в комбінації з полімером та поверхнево-активною речовиною у порівнянні з комбінацією деламаніду з поверхнево-активною речовиною. Порівняльних даних щодо помелу деламаніду в комбінації з полімером, тобто за відсутності поверхнево-активної речовини, а також деламаніду при відсутності обох зазначених речовин немає.

За відсутності переконливих порівняльних даних, а також з урахуванням відомого з рівня техніки факту, що розчинність малорозчинних лікарських засобів може підвищуватись шляхом їх поєднання з полімерами та поверхнево-активними речовинами, не можна стверджувати про наявність неочікуваного ефекту.

На додачу до цитованих експертизою в Попередньому висновку документів рівня техніки Д1-Д5 та у зв'язку зі внесеними змінами в формулу хочемо звернути увагу на наступні документи рівня техніки.

- Д6: WO2007043542A1. ПРОТИТУБЕРКУЛЬОЗНА КОМПОЗИЦІЯ, ЯКА МІСТИТЬ СПОЛУКИ ОКСАЗОЛУ. Дата публікації: 19.04.2007. Дана заявка перейшла до національної фази в Україні, за результатами чого було видано патент UA93888C2 від 25.03.2011. Володілець ОЦУКА ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД. [JP].

Д6 розкриває протитуберкульозні терапевтичні препарати, що містять оксазолні сполуки, в переліку яких зазначено деламанід (R)-2-(4-{4-[N-(4-хлорфеніл)-N-метил-амін]піперидин-1-іл} феноксиметил)-2-метил-6-нітро-2,3-дігідрімідазо[2,1-b]оксазол, активні форми цих сполук або їхні солі, а також лікарські засоби (див. стор 26 опису до патенту UA93888C2).

У відповідності до даного технічного рішення щонайменше одна з зазначених сполук може бути змішана з фармацевтично прийнятними носіями відомими методами і безпечно застосована у фармацевтичних композиціях, в тому числі гранульованих, для перорального застосування як в таблетках, так і в капсулах (стор. 35 опису до патенту UA93888C2).

Серед фармацевтично прийнятних носіїв, що можуть бути використані, у відповідності до цього технічного рішення, є гідрофільні полімери, зокрема гідроксипропілцелюлоза, гідроксипропілметилцелюлоза, полілівінілпірролідон та поверхнево-активні речовини, серед яких зазначено ефір жирної кислоти сахарози, фумаратстеарил натрію тощо (стор. 35, 36 опису до патенту UA93888C2).

Загальне співвідношення оксазольних сполук і фармацевтично прийнятних носіїв у протитуберкульозних терапевтичних засобах за цим винаходом відрізняється залежно від форми препаратів. Зазвичай він знаходиться в діапазоні від 0,01 до 99,99 % за масою, переважно від 0,1 до 99,9 % за масою, більш переважно від 1 до 30 % за масою, виходячи з загальної кількості препарату (див. стор. 37 опису до патенту UA93888C2).

- Д7: WO0243704A1. ПОКРАЩЕНИЙ СКЛАД ЩОДО РОЗЧИННОСТІ АБО ЗАСВОЮВАННЯ ПРИ ОРАЛЬНОМУ ПРИЙОМІ. Дата публікації: 06.06.2002.

В Д7 розкрита композиція, у якій покращена розчинність або здатність до перорального всмоктування компонента, що має обмежену водорозчинність. Композиція містить три компоненти: речовину з обмеженою водорозчинністю, поверхнево-активну речовину та гідрофільний полімер (див. п. 1 формули), і отримується шляхом вологого гранулювання у присутності води. Речовина з обмеженою водорозчинністю є лікарським засобом (див. п. 2 формули) – *«Композиція за п. 1, у якій компонент з низькою розчинністю у воді є лікарським засобом з обмеженою водорозчинністю»*.

Як поверхнево-активну речовину використовують одну або більше речовин, вибраних з наступної групи: лаурилсульфат натрію, полісорбат 80, полісорбат 60, гідрогенізовану касторову олію, етоксильовану поліоксіетиленом, поліоксіетилен-поліоксіпропіленгліколь та ефір жирної кислоти сахарози (див. п.5 формули).

Гідрофільний полімер обирають з групи, що включає: гідроксипропілцелюлозу, гідроксипропілметилцелюлозу, метилцелюлозу, карбоксиметилцелюлозу, гідроксипропілкрохмаль, гідроксетилцелюлозу, сукцинат гідроксипропілметилцелюлози, фталат гідроксипропілметилцелюлози, карбоксивініловий полімер, полілівінілпірролідон, полілівініловий спирт, сополімер метакрилової кислоти, макрогол, крохмаль, желатин, декстрин, пулулан і агар (див. п. 6 формули).

З матеріалів заявки випливає, що вагове співвідношення компонента з обмеженою розчинністю у воді до поверхнево-активної речовини та гідрофільного полімеру не є суворо обмеженим. Однак переважно воно становить:

1 : від 0,1 до 50 : від 0,01 до 20,

а як більш бажаний варіант —

1 : від 0,5 до 20 : від 0,1 до 10.

• Д8: WO2016192680A1. ЛІКАРСЬКІ ФОРМИ ТА ЇХ ЗАСТОСУВАННЯ. Дата публікації 08.12. 2016 .

В Д8 розкрита стабільна тверда фармацевтична лікарська форма для перорального застосування. Лікарська форма включає носій (субстрат), що утворює принаймні одну камеру, у яку завантажено вміст лікарського засобу. Заявлена лікарська форма сконструйована таким чином, щоб активний фармацевтичний інгредієнт лікарського засобу вивільнявся контрольованим чином.

Лікарський засіб включає активний фармацевтичний інгредієнт (див. параграф 0009 опису), який вибирають з групи, що складається з (R)-фолітксорину, лідокаїну, делафлоксацину, деламаніду, делаприлу тощо (див. параграф 0091 опису). На фіг. 6 показано лікарську форму, яка містить носій (субстрат), що утворює шари, між якими розміщено вміст лікарського засобу у вигляді наночастинок, диспергованих між цими шарами (див. параграф 0032 опису). Субстрат може бути виготовлений з гідрофільного полімеру (наприклад, гідроксипропілметилцелюлози (UPMC) та полі(етиленоксиду) (PEO)), гідрофобного полімеру (наприклад, етилцелюлози (EC)), полімеру, що набухає, полімеру, що не набухає, пористого полімеру, непористого полімеру, еродованого полімеру або нееродованого полімеру. У деяких варіантах реалізації субстрат складається з кількох частин, кожна з яких виготовлена з одного або іншого матеріалу (див. параграфи 0073, 0074 опису). Вміст лікарського засобу може бути змішаний з розчином, в якому він розчинений або суспендований. Потім розчин атомізується/розпилюється поверх друкованого шару під час тривимірного друку лікарської форми. Після того, як розчин, що містить лікарський засіб, висихає, лікарський засіб розподіляється в лікарській формі. Наночастинки мають велику площу поверхні та високу швидкість розчинення (див. параграф 0098 опису). Для того, щоб отримати наночастинки в потрібному діапазоні розмірів, умови синтезу можуть бути належним чином підібрані, контрольовані або змінені з метою забезпечення, наприклад,

бажаної концентрації розчину або відповідного діапазону порожнин (див. параграф 0099 опису).

• Д9: US2016235687A1. СТАБІЛІЗАТОРИ НАНОЧАСТИНОК ЦУКРОВОГО ЕСТЕРУ.

Дата публікації: 18.08.2016.

У Д9 описано спосіб одержання твердої лікарської форми, що містить наночастинки, стабілізовані цукровими естерами, які запобігають агломерації наночастинок під час висушування і забезпечують відновлення їх початкового розміру при редиспергуванні твердої лікарської форми у водному середовищі (див. реферат).

У світлі розкриття Д1 – Д5, з урахуванням Д6 – Д9 та за відсутності в матеріалах заявки відомостей стосовно наявності неочевидних переваг технічного рішення, як його охарактеризовано в зміненій формулі, можна стверджувати, що на дату подання заявки на винахід створення композиції, яка містить частинки деламаніду та стабілізатор поверхні, що включає полімер і поверхнево-активну речовину, які вибрані з зазначених у заявці груп, а також включення такої композиції до фармацевтичної твердої пероральної форми, було б очевидним для фахівця у відповідній галузі техніки.

Таким чином заявлений винахід за зміненою формулою не дозволяє встановити його неочевидність з огляду на найближчий рівень техніки, що дає підстави стверджувати, що заявлений винахід за пунктами 1-12 не відповідає критерію патентоздатності «винахідницький рівень» відповідно до частини сьомої статті 7 Закону.

## 2. Порушення частини першої ст. 6.

Додатково до аргументів щодо невідповідності заявленого винаходу умовам патентоздатності хочемо привернути увагу Експертизи до етичних та суспільно значущих ризиків видачі патенту за заявленим винаходом. Нижче надаємо додаткову інформацію, яка не стосується суті винаходу, а призначена для пояснення мотивів подання зауваження від юридичної особи, яка за характером діяльності є благодійною неприбутковою організацією, а отже не може бути виробником чи дистриб'ютором лікарських засобів та, відповідно, не може скласти конкуренцію заявнику на ринку України.

Згідно з даними Всесвітньої організації охорони здоров'я (ВООЗ), Україна входить до п'ятірки країн Європейського регіону ВООЗ із найбільшою кількістю випадків

захворюваності на туберкульоз. Крім того, Україна входить до переліку 30 країн світу з найвищою поширеністю мультирезистентного туберкульозу.

До повномасштабного вторгнення Росії в Україну у 2022 році, Україна вже мала один із найвищих рівнів захворюваності на туберкульоз у Європі. Повномасштабна війна ще більше загострила ситуацію з поширенням туберкульозу в Україні.

У 2023 році показник захворюваності на туберкульоз серед дітей віком 0-14 років зріс на 40,5% у порівнянні з 2022 роком. Серед підлітків віком 15-17 років у 2023 році рівень захворюваності підвищився на 55,3% порівняно з попереднім роком. Збільшення кількості випадків туберкульозу серед дітей та підлітків тісно пов'язане з погіршенням епідеміологічної ситуації серед дорослого населення. Крім того, рівень захворюваності на активний туберкульоз у поєднанні з хворобою, зумовленою вірусом імунодефіциту людини (ВІЛ), порівняно з 2022 роком збільшилася на 5,1% (див. за посиланням <https://phc.org.ua/kontrol-zakhvoryuvan/tuberkuloz/statistika-z-tb> ).

Наказом Міністерства охорони здоров'я України від 19 січня 2023 року № 102 затверджено Стандарти медичної допомоги «Туберкульоз», які передбачають використання деламаніду в схемах лікування мультирезистентного туберкульозу. Згідно з повідомленням ВООЗ від 23 серпня 2024 року, деламанід рекомендовано як частину двох нових шестимісячних режимів лікування, що поєднують бедаквілін, деламанід та лінезолід разом з левофлоксацином або клофазиміном. Деламанід також включено до дев'ятимісячних режимів лікування мультирезистентного туберкульозу/туберкульозу, стійкого до рифампіцину, з або без стійкості до інших протитуберкульозних препаратів без резистентності до фторхінолонів.

Отже, деламанід є критично важливим для комплексного лікування туберкульозу з розширеною резистентністю. Разом з тим деламанід є одним із найдорожчих препаратів для лікування мультирезистентного туберкульозу. Згідно з даними тендеру Global Drug Facility ціна деламаніду Otsuka становить 1 190 доларів США за шестимісячний курс лікування (див.

за посиланням

[https://www.stoptb.org/sites/default/files/documents/2024.11.11\\_DLM%20FAQ\\_FINAL\\_Posted%20with%20logo%20all%20pages.pdf](https://www.stoptb.org/sites/default/files/documents/2024.11.11_DLM%20FAQ_FINAL_Posted%20with%20logo%20all%20pages.pdf) ).

Варто зауважити, що Україна наразі може закупувати виключно брендовий деламанід виробництва Otsuka (Дельтіба). Водночас за даними дослідників та експертів у

сфері доступу до лікування, деламанід можна виробляти та продавати з прибутком за ціною від 30 до 96 доларів США за шестимісячний курс лікування, що в понад 10 разів нижче за його поточну вартість. Очікується, що у 2025 році на глобальний ринок має вийти генерик деламаніду виробництва Lupin.

З ціллю економії державного бюджету, перерозподілу коштів і покриття потреби у лікарських засобах з початком повномасштабної війни препарати для лікування туберкульозу закуповуються за фінансової підтримки міжнародних партнерів, зокрема, Глобального фонду боротьби зі СНІДом, туберкульозом та малярією (GF). Це тимчасова міра, яка потребує стійкого та стабільного рішення. Саме тому вкрай важливо, щоб доступ українського пацієнта до доступного життєво-важливого лікування, зокрема деламаніду, не блокувався слабким вторинним патентом, винахід за яким не відповідає умовам патентоздатності.

Враховуючи все вище зазначене, просимо відмовити у видачі патенту за заявкою № а202100047, оскільки заявлений у цій заявці винахід не відповідає вимогам частин першої та другої статті 6 Закону України «Про охорону прав на винаходи і корисні моделі», та умовам патентоздатності, визначеним статтею 7 цього Закону.

#### Додатки:

1. Д6 заявка WO2007043542A1 та опис до патенту UA93888C2, виданого на основі даної заявки – на 126-х арк.;
2. Д7 заявка WO0243704A1 та її переклад українською – на 62-х арк.;
3. Д8 заявка WO2016192680A1 та її переклад українською – на 133-х арк.;
4. Д9 заявка US2016235687A1 та її переклад українською – на 50-ти арк.;
5. Статистика з ТБ \_ Центр громадського здоров'я - <https://phc.org.ua/kontrol-zakhvoryuvan/tuberkuloz/statistika-z-t> – на 3-х арк.;
6. Results of the Global Drug Facility's 2024 Tender for Delamanid- [https://www.stoptb.org/sites/default/files/documents/2024.11.11\\_DLM%20FAQ\\_FINAL\\_Posted%20with%20logo%20all%20pages.pdf](https://www.stoptb.org/sites/default/files/documents/2024.11.11_DLM%20FAQ_FINAL_Posted%20with%20logo%20all%20pages.pdf) та переклад українською – на 1-ти2 арк.;
7. Gotham D, Fortunak J, Pozniak A, et al. Estimated generic prices for novel treatments for drug-resistant tuberculosis. J Antimicrob Chemother 2017;72(4):1243-

1252. [Cited 2023 Nov 13]. Available at: <https://doi.org/10.1093/jac/dkw522> та переклад українською – на 59-ти арк.;

8. Довіреність, що засвідчує повноваження представника - на 2-х арк.;

Патентний повірений



Боровик П.А.