

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 1744

Ref. Expediente N° NC2017/0008115

Por la cual se otorga una Patente de Invención

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 11 de agosto de 2017, con el N° NC2017/0008115, por THERAVANCE BIOPHARMA R&D IP LLC, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “ÁCIDO (2S,4R) - 5- (5' - CLORO -2'- FLUOROBIFENIL -4- IL) -4- (ETOXIOXALILAMINO) -2- HIDROXIMETIL -2-METILPENTANOICO”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2016/017315 del 10 de febrero de 2016.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 809 el 31 de octubre de 2017, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 8305, notificado el 14 de agosto de 2019, se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

CUARTO: Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2017/0008115 el 13 noviembre de 2019, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 17 que reemplazan las originalmente presentadas. Se acepta este último capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina *“Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial”*.

SEXTO: Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 17 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0008115 el 13 Noviembre de 2019, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a un compuesto, su sal farmacéuticamente aceptable y su forma cristalina, que difieren del estado de la técnica más cercano, US2013/0109639, en que corresponde al ácido (2S, 4R) - 5 - (5' - cloro - 2' - fluorobifenil] -4 - IL) - 4 - (etoxioxalilamino) - 2 - hidroximetil - 2 - metilpentanoico, una sal farmacéuticamente aceptable y su forma cristalina (2S,4R)-5-(5'-cloro-2'-fluoro-[1,1'-bifenil]-4-il)-4-(2-etoxi-2-xoacetamido)-2-(hidroximetil)-2-metilpentanoato de calcio. Adicionalmente, en el estado de la técnica no se sugiere esta diferencia asociada al efecto farmacocinético de una mayor biodisponibilidad oral (Tabla, Pág. 96, descripción de la solicitud) y baja excreción renal (Tabla, Pág.102, descripción de la solicitud). Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.



Resolución N° 1744

Ref. Expediente N° NC2017/0008115

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 17 cumplen los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial establecidos en la normatividad citada en precedencia y este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

SÉPTIMO: Que el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2017/0008115 el 13 noviembre de 2019, solicitó la modificación del título a: “ÁCIDO (2S, 4R) – 5 - (5' - CLORO-2' - FLUOROBIFENIL] – 4 – IL) – 4 -(ETOXIOXALILAMINO) – 2 – HIDROXIMETIL – 2 - METILPENTANOICO O UNA SAL DEL MISMO COMO PROFÁRMACO PARA LA INHIBICIÓN DE NEPRILISINA (NEP)”, la cual no se acepta porque no describe completamente el objeto de invención. Teniendo en cuenta lo anterior, el título quedará de la siguiente manera: “ÁCIDO (2S, 4R) - 5 -(5' - CLORO - 2' - FLUOROBIFENIL] -4 - IL) - 4 - (ETOXIOXALILAMINO) - 2 - HIDROXIMETIL - 2 - METILPENTANOICO, UNA SAL FARMACÉUTICAMENTE ACEPTABLE Y SU FORMA CRISTALINA COMO PROFÁRMACO PARA LA INHIBICIÓN DE NEPRILISINA (NEP)”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE

ARTÍCULO PRIMERO: Otorgar patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación titulada:

“ÁCIDO (2S, 4R) - 5 -(5' - CLORO - 2' - FLUOROBIFENIL] -4 - IL) - 4 - (ETOXIOXALILAMINO) - 2 - HIDROXIMETIL - 2 - METILPENTANOICO, UNA SAL FARMACÉUTICAMENTE ACEPTABLE Y SU FORMA CRISTALINA COMO PROFÁRMACO PARA LA INHIBICIÓN DE NEPRILISINA (NEP)”

Clasificación IPC: C07C 233/56, A61K 31/192, A61P 9/00, A61P 13/12, A61P 9/12, A61K 45/06.

Reivindicación(es): 1 a 17 incluida(s) en el radicado bajo el No NC2017/0008115 el 13 noviembre de 2019, de acuerdo con el anexo 1.

Titular(es): THERAVANCE BIOPHARMA R&D IP LLC

Domicilio(s): THERAVANCE BIOPHARMA R&D IP LLC, 901 Gateway Boulevard, South San Francisco, California 94080, 94080 ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA.

Inventor(es): Adam D. HUGHES, Erik FENSTER, Melissa FLEURY, Anne-Marie BEAUSOLEIL, Venkat R. THALLADI, Jerry NZEREM, Miroslav RAPTA

Prioridad(es) N° 11/02/2015, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/114,705

Solicitud internacional N°: PCT/US2016/017315 **Fecha:** 10 de febrero de 2016.

Vigente desde: 10 de febrero de 2016 **Hasta:** 10 de febrero de 2036.

Resolución N° 1744

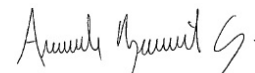
Ref. Expediente N° NC2017/0008115

ARTÍCULO SEGUNDO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y en las demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a THERAVANCE BIOPHARMA R&D IP LLC, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los diez (10) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 27 de enero de 2020



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

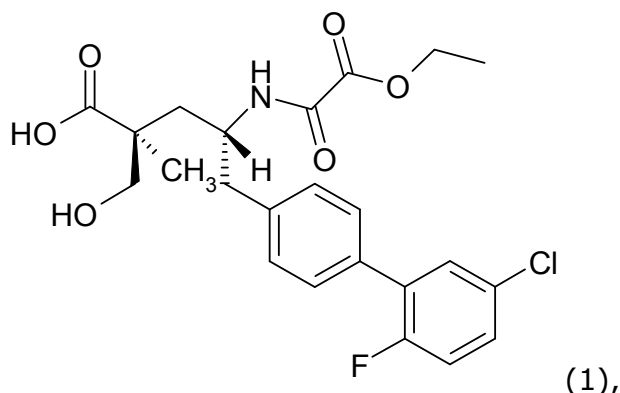
Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZÁLEZ
Fecha: 2020.01.28
17:01:26 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.



ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto CARACTERIZADO porque es de la estructura:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Una forma cristalina de (2*S*,4*R*)-5-(5'-cloro-2'-fluoro-[1,1'-bifenil]-4-il)-4-(2-etoxi-2-oxoacetamido)-2-(hidroximetil)-2-metilpentanoato de calcio, en donde la forma cristalina está CARACTERIZADA por un patrón de difracción de rayos X en polvo que comprende picos de difracción a valores 2θ de $3,47 \pm 0.2$, $3,98 \pm 0.2$, $5,00 \pm 0.2$, $7,18 \pm 0.2$, $7,38 \pm 0.2$, $7,97 \pm 0.2$, $8,57 \pm 0.2$, $8,87 \pm 0.2$, $9,42 \pm 0.2$, $9,99 \pm 0.2$, $10,60 \pm 0.2$, $10,91 \pm 0.2$, $12,19 \pm 0.2$, $14,86 \pm 0.2$, $15,74 \pm 0.2$, $15,98 \pm 0.2$, $18,98 \pm 0.2$, $19,75 \pm 0.2$, $22,69 \pm 0.2$, y $23,58 \pm 0.2$, y por una traza de calorimetría diferencial de barrido registrada a una velocidad de calentamiento de 10 °C por minuto que muestra un valor máximo en el flujo de calor endotérmico a una temperatura de entre 237 °C y 241 °C.

3. Una composición farmacéutica CARACTERIZADA porque comprende el compuesto reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2 y uno o más portadores farmacéuticamente aceptables.

Resolución N° 1744

Ref. Expediente N° NC2017/0008115

4. La composición farmacéutica de la reivindicación 3, CARACTERIZADA porque el portador farmacéuticamente aceptable es estearato de magnesio.

5. Una forma farmacéutica oral CARACTERIZADA porque comprende el compuesto reivindicado en la reivindicación 1 en una cápsula, comprimido, líquido o suspensión.

6. La forma farmacéutica oral de la reivindicación 5, CARACTERIZADA porque la cápsula comprende gelatina, polisacárido, quitosano o polímeros sintéticos.

7. La forma farmacéutica oral de la reivindicación 5, CARACTERIZADA porque la cápsula es una cápsula dura que comprende gelatina, polisacáridos, o polímeros sintéticos.

8. La forma farmacéutica oral de la reivindicación 5, CARACTERIZADA porque la cápsula comprende hidroxipropil metilcelulosa.

9. Una forma farmacéutica intravenosa CARACTERIZADA porque comprende el compuesto reivindicado en la reivindicación 1 en una solución tamponada.

10. Un proceso para preparar el compuesto de la reivindicación 1, CARACTERIZADO porque el proceso comprende:

(a) mezclar etanol y cloruro de oxalilo para formar una solución, agitar a temperatura ambiente en el rango de 15°C a 30°C por 30 minutos;

Resolución N° 1744

Ref. Expediente N° NC2017/0008115

(b) hacer reaccionar éster bencílico del ácido (2*S*,4*R*)-4-amino-5-(5'-cloro-2'-fluorobifenil-4-il)-2-hidroximetil-2-metilpentanoico con la solución, agitar a temperatura ambiente en el rango de 15°C a 30°C por 30 minutos; y

(c) combinar la mezcla resultante con 10% en peso de paladio sobre carbono bajo hidrógeno y agitar a temperatura ambiente en el rango de 15°C a 30°C por 2 horas para obtener el compuesto de la reivindicación 1.

11. El proceso de acuerdo con la reivindicación 10, CARACTERIZADO porque el compuesto resultante es purificado mediante cromatografía.

12. Un proceso para preparar la forma cristalina de la reivindicación 2, CARACTERIZADO porque el proceso comprende:

(a) disolver ácido (2*S*,4*R*)-5-(5'-cloro-2'-fluorobifenil-4-il)-4-(etoxioxalilamino)-2-hidroximetil-2-metilpentanoico en etanol y *N,N*-diisopropiletilamina para formar la solución A;

(b) disolver trifluorometanosulfonato de calcio en etanol para formar la solución B;

(c) agregar a gotas la solución B a la solución A para formar una suspensión;

(d) agitar a temperatura ambiente en el rango de 15°C a 30°C; y

(e) aislar los sólidos resultantes para obtener la forma cristalina.

13. El proceso de acuerdo con la reivindicación 12, CARACTERIZADO porque el proceso además comprende:

(f) enfriar la forma cristalina a 5 °C y agregar una mezcla fría de etanol:agua bajo agitación vigorosa; y



Resolución N° 1744

Ref. Expediente N° NC2017/0008115

(g) filtrar y secar a temperatura ambiente para obtener la forma cristalina.

14. Una forma farmacéutica CARACTERIZADA porque comprende el compuesto reivindicado en la reivindicación 2 en una cápsula o comprimido.

15. La forma farmacéutica de la reivindicación 14, CARACTERIZADA porque la cápsula comprende gelatina, polisacárido, quitosano o polímeros sintéticos.

16. La forma farmacéutica de la reivindicación 14, CARACTERIZADA porque la cápsula es una cápsula dura que comprende gelatina, polisacáridos, o polímeros sintéticos.

17. La forma farmacéutica de la reivindicación 14, CARACTERIZADA porque la cápsula comprende hidroxipropil metilcelulosa.

