

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 67564

Ref. Expediente N° NC2018/0003548

Por la cual se otorga parcialmente 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 3 de abril de 2018, con el N° NC2018/0003548, por DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “DERIVADOS DE HIDROXIALQUIL THIADIAZOL”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/IB2016/055795 del 28 de septiembre de 2016.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 833 el 19 de julio de 2018, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 844, notificado el 23 de enero de 2020, 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° NC2018/0003548 el 24 de abril de 2020, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 12 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 10 incluidas en el radicado bajo el N° NC2018/0003548 el 24 de abril de 2020, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a compuesto y una composición que difiere del estado de la técnica más cercano, EP2226322, en el grupo A como sustituyente del anillo tiadiazol. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto antibacteriano mejorado

Resolución N° 67564

Ref. Expediente N° NC2018/0003548

contra la cepa *Streptococcus pneumoniae*. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 10 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.

Que por otra parte, las reivindicaciones 11 a 12 incluidas en el radicado bajo el N° NC2018/0003548 el 24 de abril de 2020, no cumplen los requisitos indicados. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1 Objeto de la invención

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de “un nuevo antibiótico que tenga un nuevo mecanismo de acción, que muestre una fuerte actividad antibacteriana (...), y al mismo tiempo posea excelente solubilidad para absorción oral y perfil de seguridad susceptible de uso humano” (pág.5, lín.2-6).

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto representado por la fórmula general (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo (pág.5, lín.11-12).

6.2 Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

En virtud de lo dispuesto en el artículo 30, de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina que señala: *“Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción. Las reivindicaciones podrán ser independientes o dependientes. Una reivindicación será independiente cuando defina la materia que se desea proteger sin referencia a otra reivindicación anterior. Una reivindicación será dependiente cuando defina la materia que se desea proteger refiriéndose a una reivindicación anterior. Una reivindicación que se refiera a dos o más reivindicaciones anteriores se considerará una reivindicación dependiente múltiple”*.

Las reivindicaciones presentan las siguientes observaciones:

- La reivindicación 11 no es concisa por que reclama la misma materia reivindicada en la reivindicación 1, es decir el compuesto de fórmula (I), o un tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo con los mismos significados para R y A.
- La reivindicación 12 no es concisa por que reclama la misma materia reivindicada en la reivindicación 2, es decir el tautómero del compuesto de fórmula (I), con los mismos significados para R y A´.

6.3. Respuesta a los argumentos del solicitante

El solicitante afirma sobre las reivindicaciones 10 y 11 incluidas en el radicado N° NC2018/0003548 del 18 de enero de 2019 que: *“dichas reivindicaciones están*



Resolución N° 67564

Ref. Expediente N° NC2018/0003548

dirigidas a un producto que contiene el compuesto reclamado en las reivindicaciones 1 y 2. Por lo cual, se solicita sea retirada dicha objeción presentadas en la solicitud”.

Esta Oficina aclara que a pesar del preámbulo indicando la actividad de la molécula y contrario a lo afirmado por el solicitante, las reivindicaciones 10 y 11 (actualmente reivindicaciones 11 y 12 del radicado NC2018/0003548 del 24 de abril de 2020) no incluyen características técnicas esenciales adicionales que correspondan a un producto, como por ejemplo los excipientes formando parte de los componentes o características de una composición, que junto con el compuesto de fórmula (I) o su tautómero constituyan las características técnicas esenciales de dicha composición, sin embargo se observa que la actual reivindicación 10 (radicado NC2018/0003548 del 24 de abril de 2020) reclama las composiciones farmacéuticas en las cuales la molécula, su tautómero o su sal farmacéuticamente aceptable están presentes.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2018/0003548 el 24 de abril de 2020 y teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “DERIVADOS DE HIDROXIALQUIL THIADIAZOL COMO AGENTES ANTIBACTERIANOS”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, la Directora de Nuevas Creaciones,

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:

“DERIVADOS DE HIDROXIALQUIL THIADIAZOL COMO AGENTES ANTIBACTERIANOS”

Clasificación IPC: C07D 417/14, A61K 31/433, A61P 31/00.

Reivindicaciones: 1 a 10 incluidas en el radicado bajo el No NC2018/0003548 el 24 de abril de 2020, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED.

Domicilio: 3-5-1, Nihonbashi Honcho CHUO-KU 103-8426 TOKYO JAPON.

Inventores: Manoj Kumar KHERA, Tarun MATHUR, Jitendra A. SATTIGERI, Nobuhisa MASUDA, Tsuyoshi SONEDA, Yoshiko KAGOSHIMA, Toshiyuki KONOSU, Tetsuya SUZUKI, Makoto YAMAOKA, Ryo ITOOKA.

Resolución N° 67564

Ref. Expediente N° NC2018/0003548

Prioridad N°: 30/09/2015, IN (INDIA), 3119/DEL/2015

Solicitud internacional N°: PCT/IB2016/055795 **Fecha:** 28 de septiembre de 2016.

Vigente desde: 28 de septiembre de 2016 **Hasta:** 28 de septiembre de 2036.

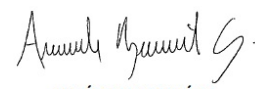
ARTÍCULO SEGUNDO: Denegar la patente de invención solicitada para las reivindicaciones 11 a 12 incluidas en el radicado bajo el NC2018/0003548 el 24 de abril de 2020, de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente resolución.

ARTÍCULO TERCERO: 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 CUARTO: Notificar el contenido de la presente resolución a DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED., 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., a los 26 de octubre de 2020



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZALEZ
Fecha: 2020.10.26
17:04:56 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

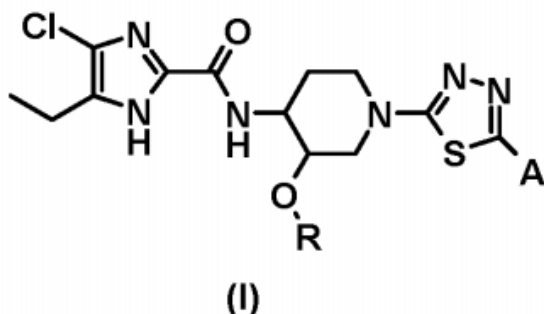


Ref. Expediente N° NC2018/0003548

ANEXO 1

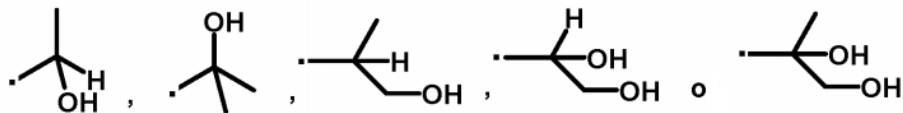
REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto representado por la fórmula (I), o un tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo;

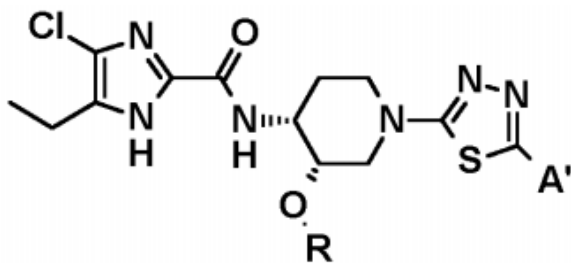


donde R representa alquilo (C₁-C₃), y

A representa las siguientes fórmulas:



2. El compuesto, un tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, en el que el compuesto de fórmula (I) tiene la siguiente estructura:

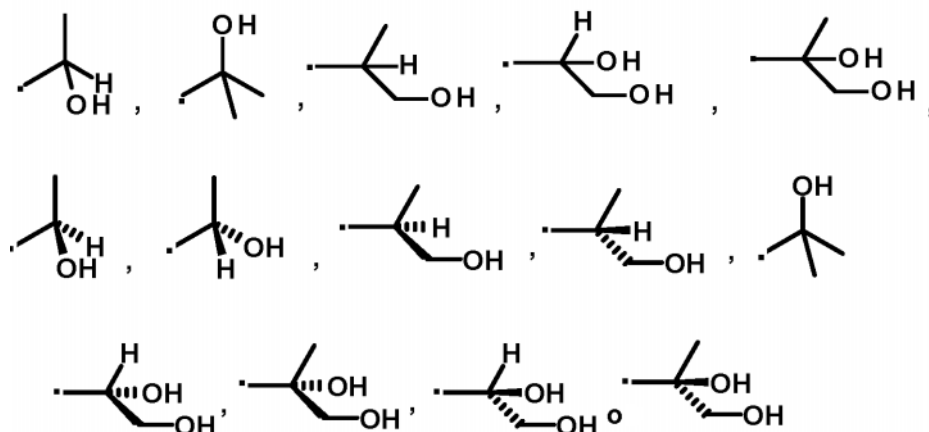


donde R representa alquilo (C₁-C₃), y

A' representa las siguientes fórmulas:

Resolución N° 67564

Ref. Expediente N° NC2018/0003548



3. El compuesto, un tautómero, un estereoisómero, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en el que R representa metilo o etilo.

4. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que el compuesto se selecciona de:

- 4-Cloro-*N*-[(3*S*,4*R*)-3-etóxi-1-[5-(1-hidroxietil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]piperidin-4-il]-5- etil-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No. 1),
- 4-Cloro-5-etil-*N*-{(3*S*,4*R*)-1-[5-(2-hidroxiopropan-2-il)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-3-metoxipiperidin-4-il}-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No. 2),
- 4-Cloro-5-etil-*N*-{(3*S*,4*R*)-1-[5-(1-hidroxietil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-3-metoxipiperidin-4-il}-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No.3),
- 4-Cloro-5-etil-*N*-[(3*S*,4*R*)-1-{5-[(1*R*)-1-hidroxietil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-3-metoxipiperidin-4-il]-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No.4),
- 4-Cloro-5-etil-*N*-[(3*S*,4*R*)-1-{5-[(1*S*)-1-hidroxietil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-3-metoxipiperidin-4-il]-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No.5),
- 4-Cloro-5-etil-*N*-{(3*S*,4*R*)-1-[5-(1-hidroxiopropan-2-il)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-3-metoxipiperidin-4-il}-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No.6),
- 4-Cloro-*N*-{(3*S*,4*R*)-3-etóxi-1-[5-(2-hidroxiopropan-2-il)-1,3,4-tiadiazol-2-il] piperidin-4-il}-5-etil-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No.7),
- 4-Cloro-*N*-[(3*S*,4*R*)-1-{5-[(1*S*)-1,2-dihidroxietil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-3-metoxipiperidin-4-il]-5-etil-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No. 8),
- 4-Cloro-*N*-[(3*S*,4*R*)-1-{5-[(1*R*)-1,2-dihidroxietil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-3-metoxipipendin-4-il]-5-etil-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No. 9),
- 4-Cloro-*N*-[(3*S*,4*R*)-1-{5-[(2*R*)-1,2-dihidroxiopropan-2-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-3- metoxipiperidin-4-il]-5-etil-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No. 10),

Resolución N° 67564

Ref. Expediente N° NC2018/0003548

4-Cloro-*N*-[(3*S*,4*R*)-1-{5-[(2*S*)-1,2-dihidroxiopropan-2-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-3-metoxipiperidin-4-il]-5-etil-1*H*-imidazol-2-carboxamida (Compuesto No. 11), o

un tautómero, una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos.

5. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el compuesto es un hidrato 2/3 de 4-cloro-5-etil-*N*-[(3*S*, 4*R*)-1-[5-(2-hidroxiopropan-2-il)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-3-metoxipiperidin-4-il]-1*H*-imidazol-2-carboxamida, un tautómero, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

6. El compuesto según la reivindicación 4, en el que 4-cloro-5-etil-*N*-[(3*S*, 4*R*)-1-[5-(2-hidroxiopropan-2-il)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-3-metoxipiperidin-4-il]-1*H*-imidazol-2-carboxamida se selecciona de la Forma I, o Forma II, caracterizado por el espectro de difracción por rayos X en polvo (XRD) (CuK, $\lambda=1.54\text{\AA}$), en donde la Forma I tiene picos 2θ (d) característicos en 8.38 (10.54), 10.90 (8.11), 14.50 (6.08), 14.94 (5.92), 19.82 (4.48), y 24.68 (3.60), y en donde la Forma II tiene picos 2θ (d) característicos en 13.20 (6.67), 14.94 (5.92), 16.08 (5.51), 17.76 (4.99), 19.46 (4.56), y 24.82 (3.58).

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, en el que el hidrato 2/3 de 4-cloro-5-etil-*N*-[(3*S*, 4*R*)-1-[5-(2-hidroxiopropan-2-il)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-3-metoxipiperidin-4-il]-1*H*-imidazol-2-carboxamida es un sólido cristalino, designado como Forma I, caracterizado por el espectro de difracción de rayos X en polvo (XRD) (CuK, $\lambda = 1.54\text{\AA}$), que tiene picos 2θ (d) característicos en 8.38 (10.54), 10.90 (8.11), 14.50 (6.08), 14.94 (5.92), 19.82 (4.48), y 24.68 (3.60).

8. El compuesto según la reivindicación 4, en el que 4-Cloro-*N*-[(3*S*, 4*R*)-1-{5-[(2*R*)-1,2-dihidroxiopropan-2-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-3-metoxipiperidin-4-il]-5-etil-1*H*-imidazol-2-carboxamida es un sólido cristalino, designado como Forma A, caracterizado por el espectro de difracción de rayos X en polvo (XRD) (CuK, $\lambda=1.54\text{\AA}$), en donde la Forma A tiene picos 2θ (d) característicos en 15.70 (5.63), 17.06 (5.19), 19.10 (4.64), y 21.92 (4.05).

9. El compuesto según la reivindicación 4, en el que 4-Cloro-*N*-[(3*S*,4*R*)-1-{5-[(2*S*)-1,2-dihidroxiopropan-2-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-3-metoxipiperidin-4-il]-5-etil-1*H*-imidazol-2-carboxamida es un sólido cristalino, designado como Forma B, caracterizado por el espectro de difracción de rayos X en polvo (XRD)

Resolución N° **67564**

Ref. Expediente N° NC2018/0003548

(CuK, $\lambda=1.54\text{\AA}$), en donde la Forma B tiene picos 2θ (d) característicos en 13.13 (6.73), 14.27 (6.20), y 19.10 (4.64).

10. Una composición farmacéutica que comprende de 1 a 50 mg/kg de un compuesto, un tautómero, un estereoisómero, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, como su ingrediente activo.

