

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 13904

Ref. Expediente N° NC2019/0009090

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:

Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 22 de agosto de 2019, con el N° NC2019/0009090, por ASTELLAS PHARMA INC, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “COMPUESTO DE PROLINAMIDA SUSTITUIDA POR FENILDIFLUORMETILO”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/JP2018/001927 del 23 de enero de 2018.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 870 el 30 de agosto de 2019, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N°10263, notificado el 6 de julio de 2021, 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.

Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2019/0009090 el 24 de septiembre de 2021, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 17 que reemplazan las originalmente presentadas. Posteriormente, mediante escrito radicado bajo el N° NC2022/0001967 el 23 de febrero de 2022, el solicitante presentó las reivindicaciones 1 a 17 atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas. Se acepta este último capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

Que de acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486. Por lo tanto, se tendrán en cuenta las reivindicaciones 1 a 17 del radicado N° NC2022/0001967 del 23 de febrero de 2022.



Resolución N° 13904

Ref. Expediente N° NC2019/0009090

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.”*

Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 17 incluidas en el radicado bajo el N° NC2022/0001967 del 23 de febrero de 2022, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior toda vez que refieren a derivados de compuestos de prolinamida sustituida por fenildifluormetilo, que difieren del estado de la técnica más cercano, WO/2010/121918, en el tipo de sustituciones que presenta el anillo pirrolidinico de la prolina, específicamente el grupo -CF₂-. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto inhibitor sobre la catepsina S como se ve en las tablas 1 y 2 del correspondiente capítulo descriptivo. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

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

Que el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0009090 del 22 de agosto de 2019, tituló la invención como: “COMPUESTO DE PROLINAMIDA SUSTITUIDA POR FENILDIFLUORMETILO”. Sin embargo, no se acepta porque no refleja completamente el alcance de la solicitud, y de acuerdo con el objeto concedido, el título de la invención quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS DERIVADOS DE PROLINAMIDA SUSTITUIDA CON FENIL DIFLUOROMETILO COMO INHIBIDORES DE CATEPSINA S Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS COMPRENDEN”

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

RESUELVE

ARTÍCULO 1: 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:

“COMPUESTOS DERIVADOS DE PROLINAMIDA SUSTITUIDA CON FENIL DIFLUOROMETILO COMO INHIBIDORES DE CATEPSINA S Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS COMPRENDEN”

Clasificación IPC: C07D 207/16, A61K 31/4439, A61K 31/496, A61P 13/12, A61P 37/06, A61P 37/08, C07D 401/10, C07D 403/10.



Resolución N° 13904

Ref. Expediente N° NC2019/0009090

Reivindicaciones: 1 a 17 incluidas en el radicado bajo el No NC2022/0001967 del 23 de febrero de 2022 de acuerdo con el anexo 1.

Titular: ASTELLAS PHARMA INC.

Domicilio: 5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chome, CHUO-KU 1038411 TOKYO JAPON.

Inventores: Yutaka NAKAJIMA, Sunao IMADA, Eriko YAMAMOTO, Kazuyuki TSUCHIYA, Yu HARAYAMA y Shunichiro MATSUMOTO.

Prioridad N° 24/01/2017, JP, 2017-01032.

Solicitud internacional N°: PCT/JP2018/001927

Fecha: 23 de enero de 2018.

Vigente desde: 23 de enero de 2018

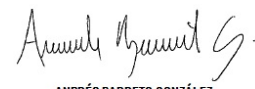
Hasta: 23 de enero de 2038.

ARTÍCULO 2: 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 3: Notificar el contenido de la presente resolución a ASTELLAS PHARMA INC, 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 22 de marzo de 2022



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZÁLEZ
Fecha: 2022.03.22
17:00:55 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

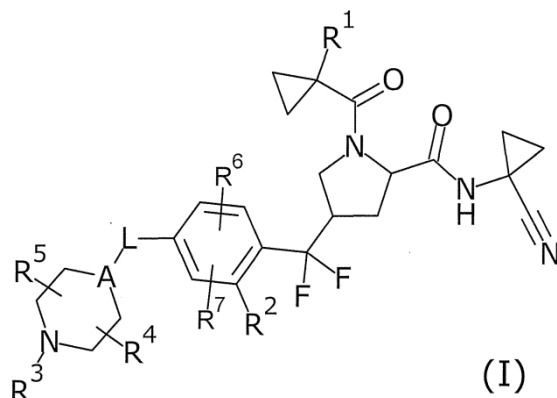
Resolución N° 13904

Ref. Expediente N° NC2019/0009090

ANEXO 1.
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales:

[Quím. 15]



(En la fórmula,

R^1 es alquilo C_{1-6} o halógeno–alquilo C_{1-6} ,

R^2 es un halógeno o halógeno–alquilo C_{1-6} ,

L es un enlace o $-CH_2-$,

A es CH o N,

R^3 es H o alquilo C_{1-6} ,

R^4 y R^5 son iguales o diferentes entre sí, y son H o alquilo C_{1-6} ,

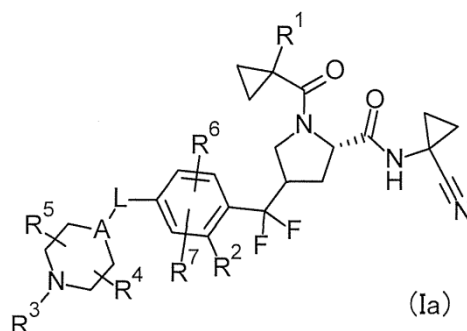
R^6 y R^7 son iguales o diferentes entre sí, y son H, o alquilo C_{1-6} , o un halógeno).

2. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 1,
en donde L es $-CH_2-$.
3. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 2,
en donde R^2 es halógeno–alquilo C_{1-6} , A es N, R^3 es alquilo C_{1-6} , R^4 es H, R^5 es H, R^6 es H, y R^7 es H.
4. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 1,
en donde la fórmula (I) es la fórmula (Ia).

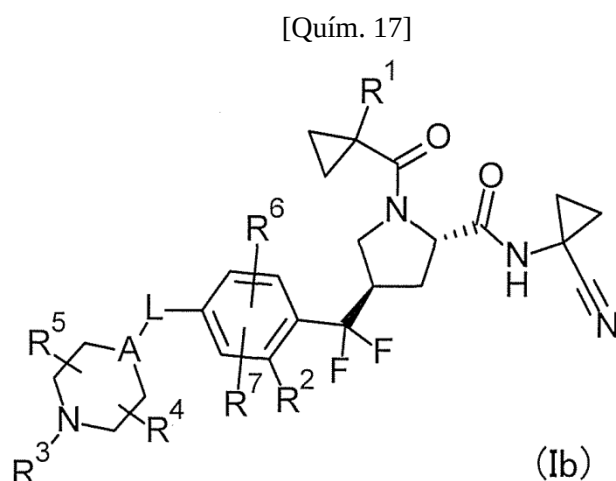
[Quím. 16]

Resolución N° 13904

Ref. Expediente N° NC2019/0009090



5. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 1, en donde la fórmula (I) es la fórmula (Ib).



6. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 3, en donde la fórmula (I) es la fórmula (Ib).
7. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 1, que se selecciona del grupo que consiste en:

(4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-(difluor{4-[(4-metilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil}metil)-1-[(1-metilciclopropil)carbonil]-L-prolinamida,

(4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-(difluor{4-[(4-metilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil}metil)-1-{[1-(trifluormetil)ciclopropil]carbonil}-L-prolinamida,

(4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-{4-[(4-etilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil}(difluor)metil)-1-{[1-(trifluormetil)ciclopropil]carbonil}-L-prolinamida,

(4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-{4-[(4-etilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil}(difluor)metil)-1-[(1-metilciclopropil)carbonil]-L-prolinamida, y

una de sus sales.

Resolución N° 13904

Ref. Expediente N° NC2019/0009090

8. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 7, que es (4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-(difluor{4-[(4-metilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil} metil)-1-[(1-metilciclopropil)carbonil]-L-prolinamida o una de sus sales.
9. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 7, que es (4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-(difluor{4-[(4-metilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil} metil)-1-[(1-(trifluormetil)ciclopropil)carbonil]-L-prolinamida o una de sus sales.
10. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 7, que es (4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-[(4-[(4-etilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil}(difluor) metil)-1-[(1-(trifluormetil)ciclopropil)carbonil]-L-prolinamida o una de sus sales.
11. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 7, que es (4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-[(4-[(4-etilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil}(difluor) metil)-1-[(1-metilciclopropil)carbonil]-L-prolinamida o una de sus sales.
12. Una composición farmacéutica que comprende el compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 1, y uno o más excipientes.
13. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 8, el cual es disuccinato de (4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-(difluor{4-[(4-metilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil} metil)-1-[(1-metilciclopropil)carbonil]-L-prolinamida.
14. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 13, el cual es un cristal de disuccinato de (4R)-N-(1-cianociclopropil)-4-(difluor{4-[(4-metilpiperazin-1-il)metil]-2-(trifluormetil)fenil}metil)-1-[(1-metilciclopropil)carbonil]-L-prolinamida.
15. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 14, el cual es un cristal que tiene picos a 2θ (°) = 2,7, 5,3, 9,8, 10,4, 13,5, 14,0, 15,1, 16,6, 17,4 y 24,4 en difracción de rayos X en polvo usando Cu como un tubo.
16. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 15, el cual es un cristal que tiene una temperatura de inicio de un pico endotérmico en análisis DSC de 134,3°C.
17. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 12, en la que el compuesto o una de sus sales es el compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 7.