

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

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 19 de mayo de 2017, con el N° NC2017/0005014, por JANSSEN PHARMACEUTICA NV, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “ALCOHOLES TRIFLUOROMETÍLICOS COMO MODULADORES DE RORIT”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2015/058193 del 30 de octubre de 2015.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 803 el 31 de agosto de 2017, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 3290, notificado el 22 de marzo de 2018, 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° NC2017/0005014 el 3 de agosto de 2018, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentan nuevas reivindicaciones 1 a 31 que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. 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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

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 31 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0005014 del 3 de agosto de 2018, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior y, en consecuencia, este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con el objeto concedido, el título de la invención quedará de la siguiente manera: "4-FENILTIAZOL-2-CARBOXAMIDA Y 4-(PIRIDIN-3-IL)TIAZOL-2-CARBOXAMIDA MODULADORES DEL RECEPTOR NUCLEAR ROR γ T".

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:

**"4-FENILTIAZOL-2-CARBOXAMIDA Y 4-(PIRIDIN-3-IL)TIAZOL-2-CARBOXAMIDA
MODULADORES DEL RECEPTOR NUCLEAR ROR γ T"**

Clasificación IPC: C07D 417/06, C07D 417/14, C07D 487/08, C07D 277/56, A61K 31/427, A61P 3/10, A61P 17/06, A61P 19/02, A61P 37/00

Reivindicaciones: 1 a 31 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0005014 del 3 de agosto de 2018, de acuerdo al Anexo I.

Titular: JANSSEN PHARMACEUTICA NV.

Domicilio: TURNHOUTSEWEG 30, B-2340 BEERSE, BÉLGICA.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

Inventores: HARIHARAN VENKATESAN, VIRGINIA TANIS, OLAF KINZEL, CHRISTIAN GEGE, CHRISTOPH STEENECK, GERALD KLEYMANN, THOMAS HOFFMANN, STEVEN GOLDBERG, ANNE, M. FOURIE Y XIAOHUA XUE.

Prioridad N° 30/10/2014, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/072,563

Solicitud internacional N°: PCT/US2015/058193 **Fecha:** 30 de octubre de 2015.

Vigente desde: 30 de octubre de 2015

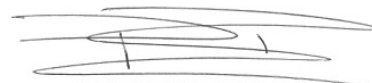
Hasta: 30 de octubre de 2035.

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 JANSSEN PHARMACEUTICA NV, advirtiéndoles 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 18 de septiembre de 2018


PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO
Superintendente de Industria y Comercio

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

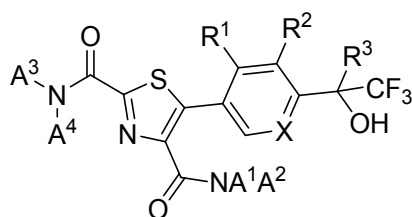
Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

ANEXO I

Reivindicaciones concedidas

1. Un compuesto de la Fórmula II:



Fórmula II

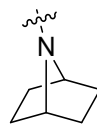
en donde

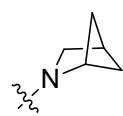
X es CH o N;

A¹ es alquilo de C₍₁₋₂₎;

A² es ciclobutilo o alquilo de C₍₁₋₄₎, en donde el alquilo de C₍₁₋₄₎ está no sustituido o sustituido con OCH₃ o hasta tres átomos de flúor;

o A¹ y A² se consideran conjuntamente con su nitrógeno unido para formar un anillo

seleccionado del grupo que consiste en azetidinilo, piperidinilo, pirrolidinilo,  y



; en donde ese anillo está no sustituido o sustituido con hasta tres sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, CF₃, CH₃, -CN, y CH₂OH;

R¹ es Cl, C(CH₃)₃, CH₂CH₃, OCF₃, CF₃, OCH(CH₃)₂, CHF₂, OCHF₂, OCH₃, F, o CH₃;



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

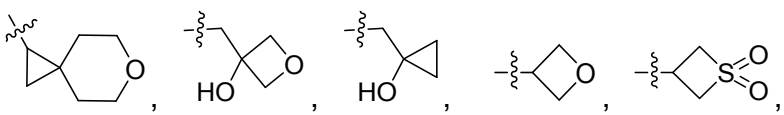
Ref. Expediente N° NC2017/0005014

R² es H, F, o Cl;

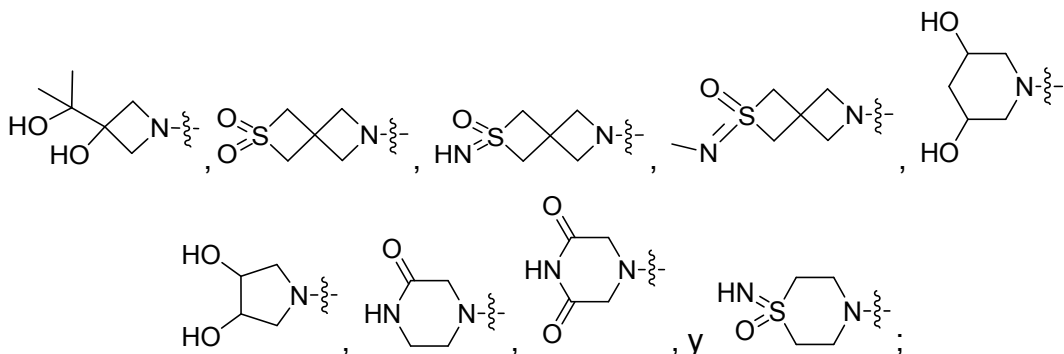
o R¹ y R² pueden considerarse conjuntamente con su fenilo unido para formar un grupo naftalenilo o quinolinilo;

R³ es CF₃, o CH₂CH₃;

A³ es H;

A⁴ es H, alquilo de C₍₁₋₅₎, ; en donde el alquilo de C₍₁₋₅₎ está no sustituido o sustituido con uno a dos sustituyentes seleccionados independientemente de CONH₂, -CN, y OH;

o A³ y A⁴ pueden considerarse conjuntamente con su nitrógeno unido para formar un anillo seleccionado del grupo que consiste en



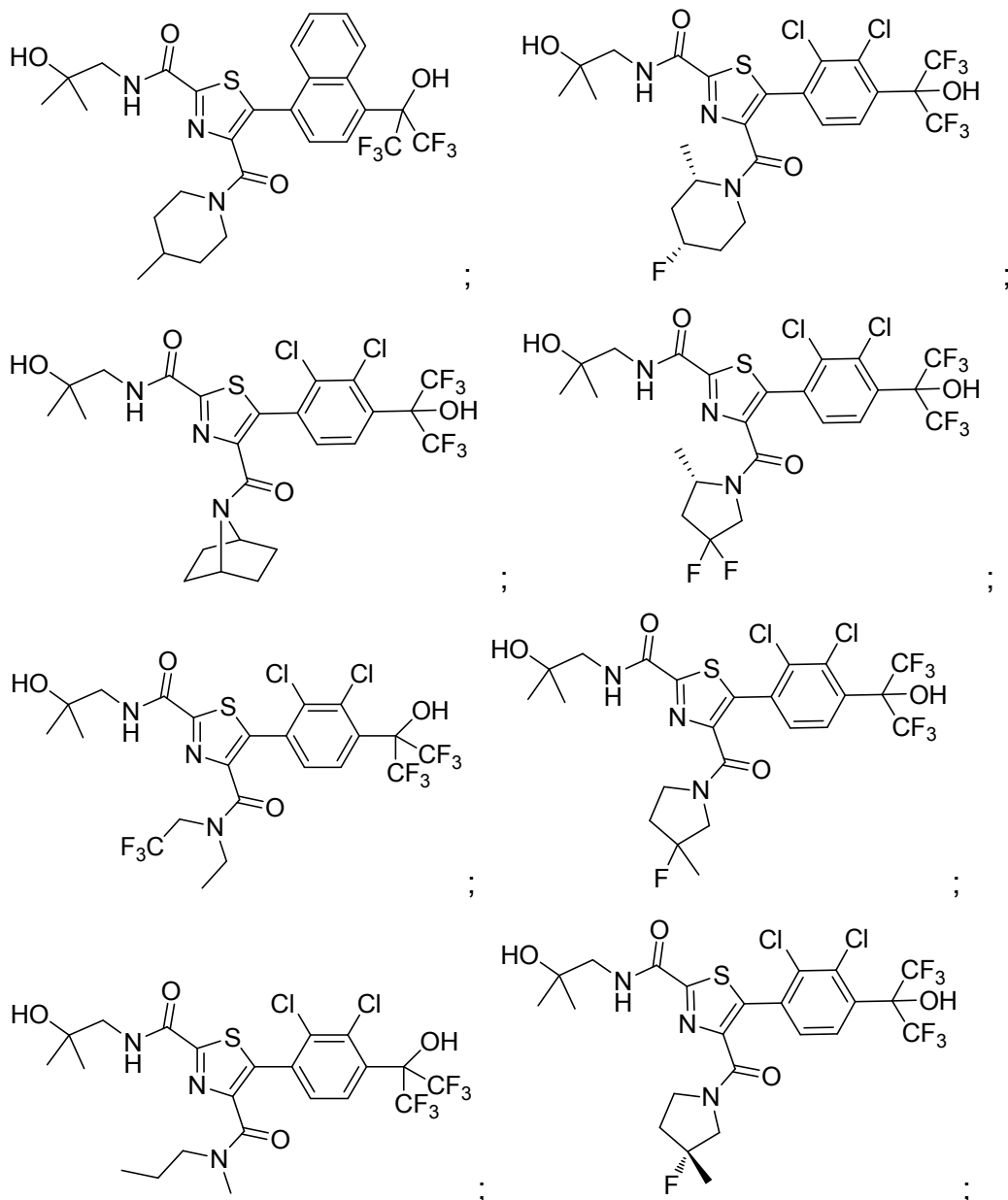
y sales farmacéuticamente aceptables de este.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado del grupo que consiste en:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

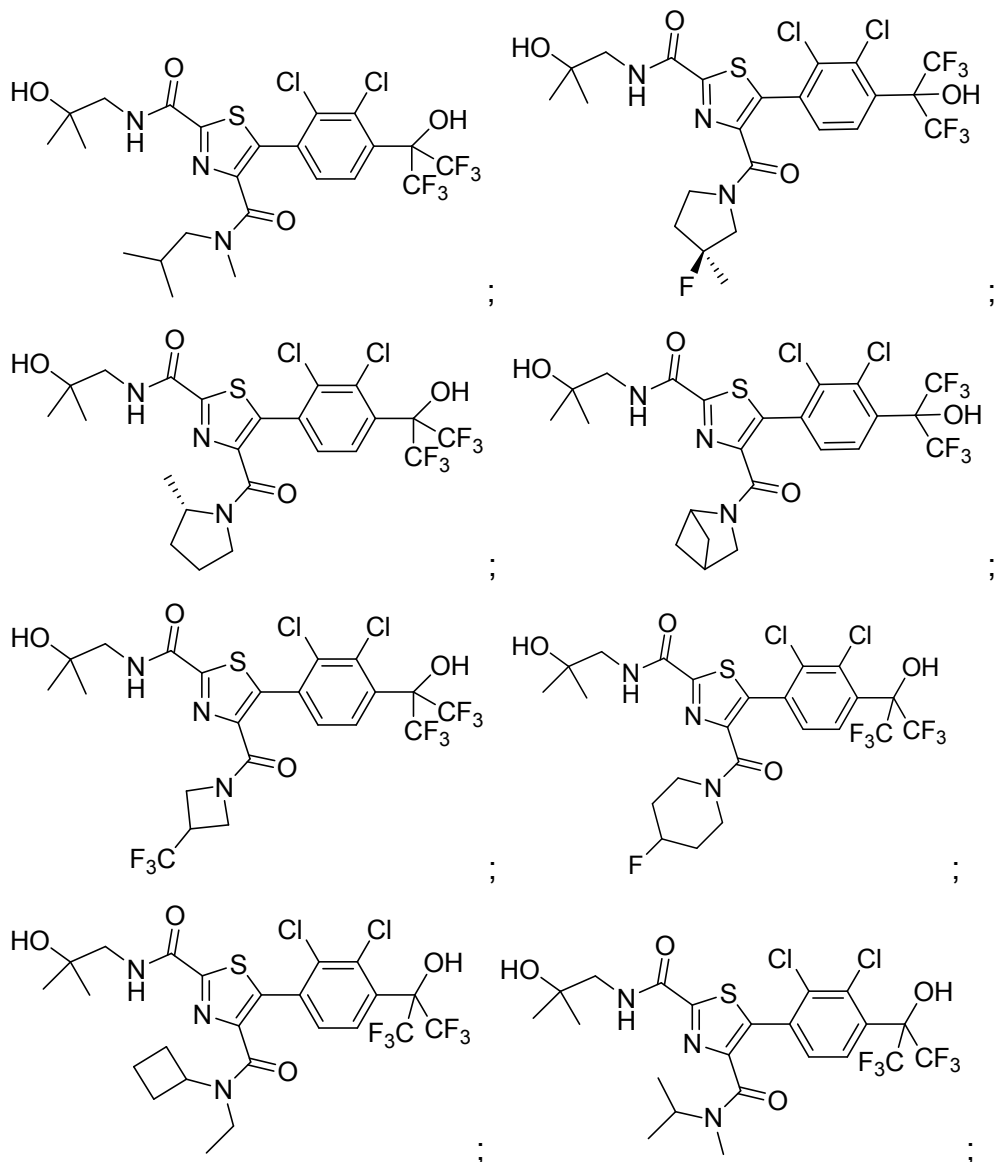
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

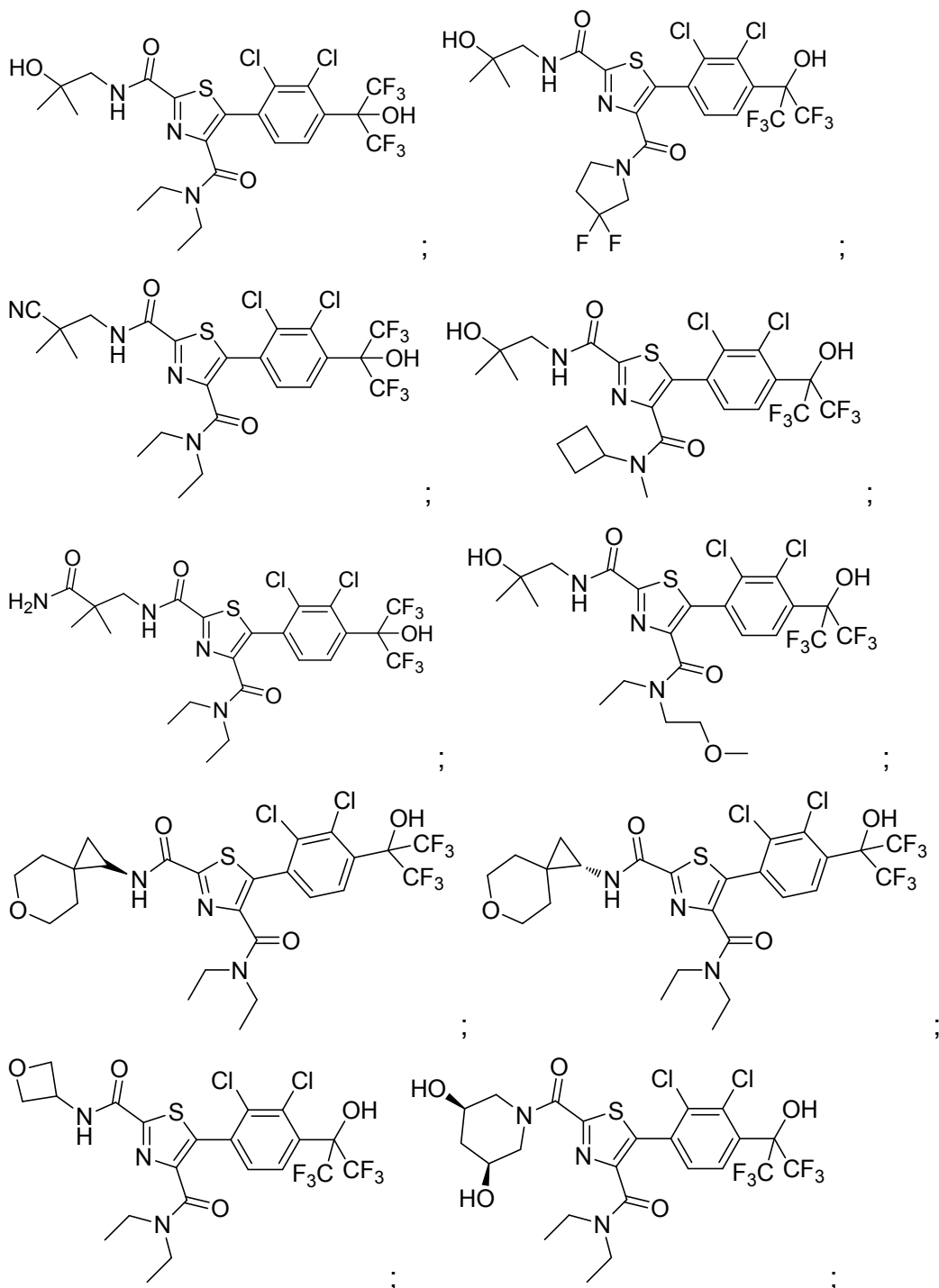
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

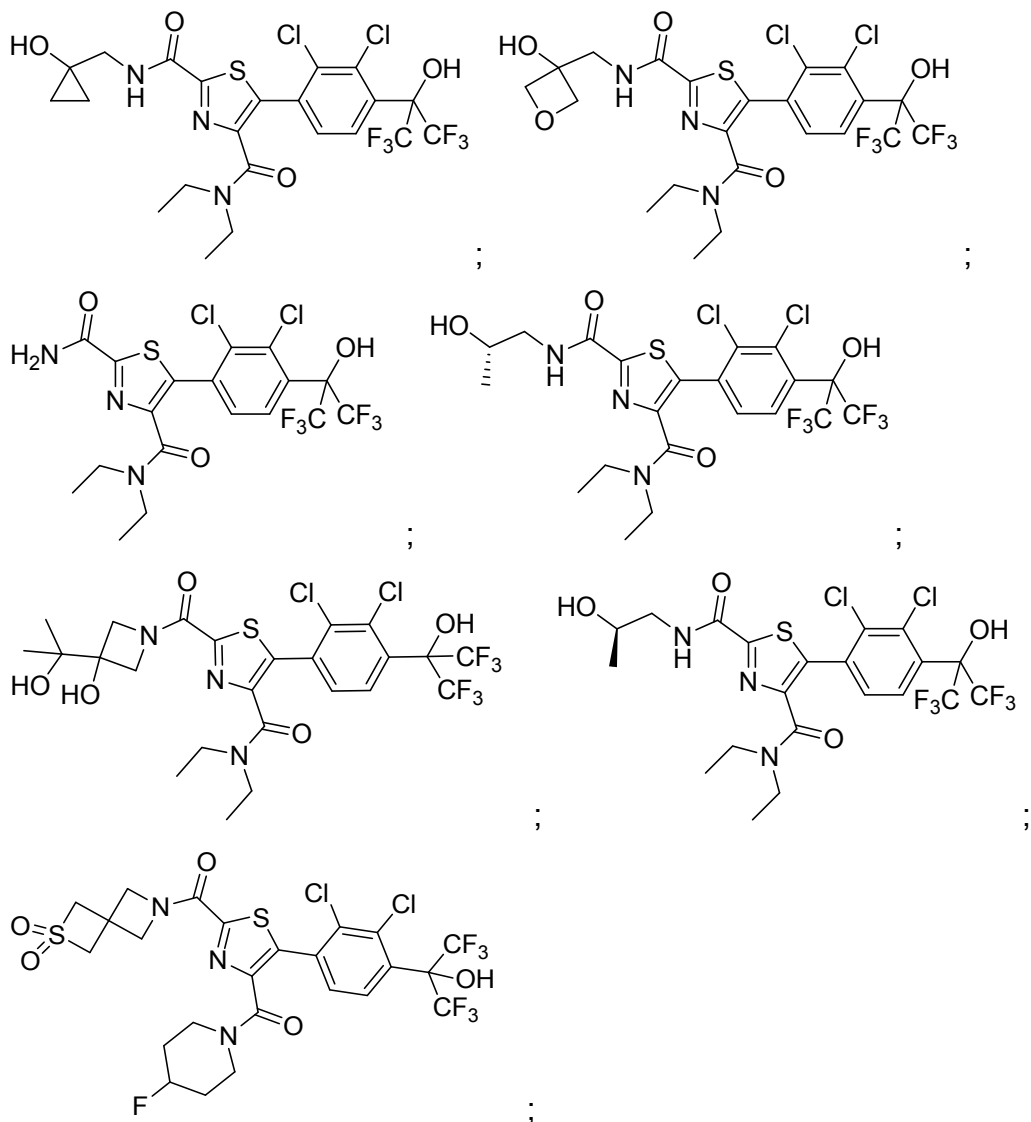
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

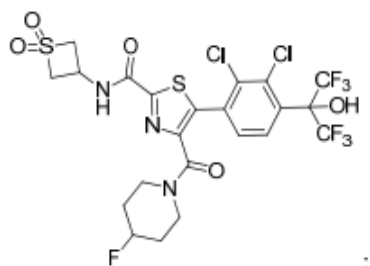
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



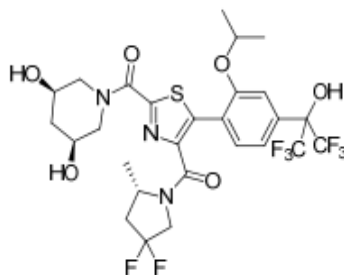
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

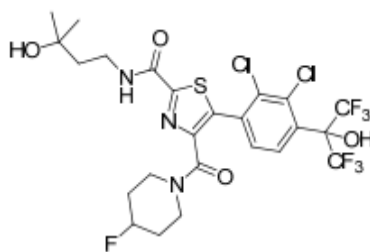
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



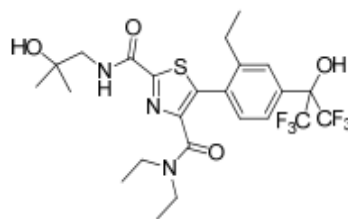
;



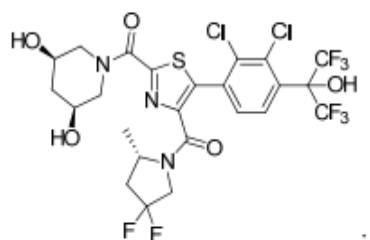
;



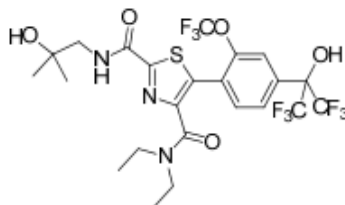
;



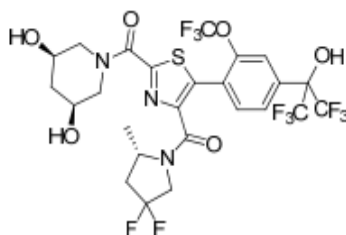
;



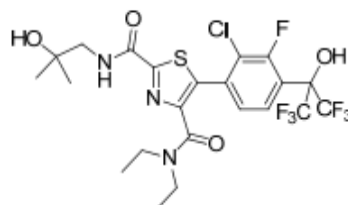
;



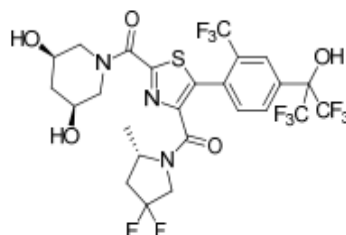
;



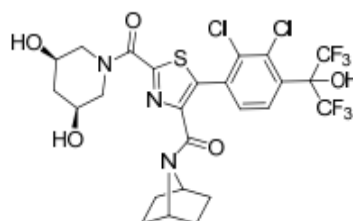
;



;



;



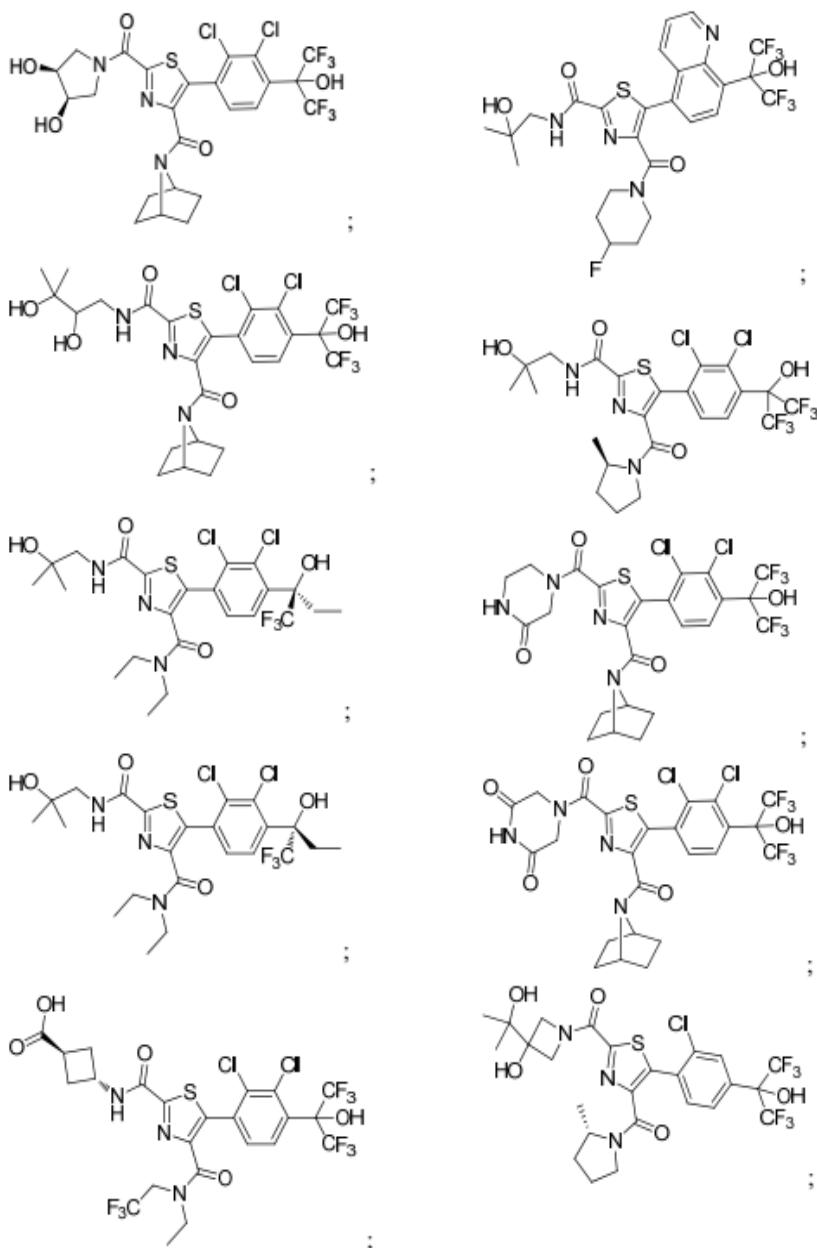
;



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

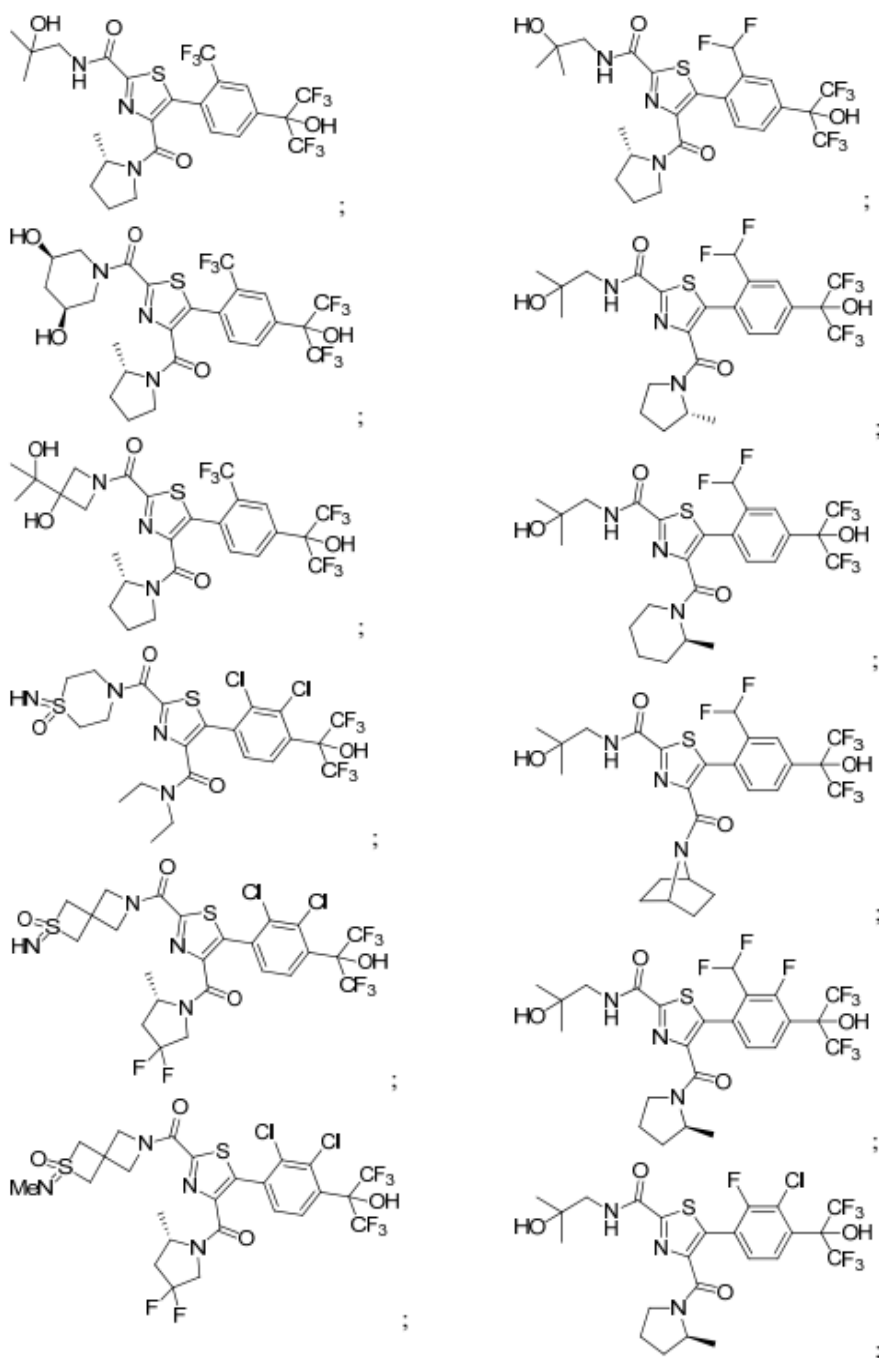
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

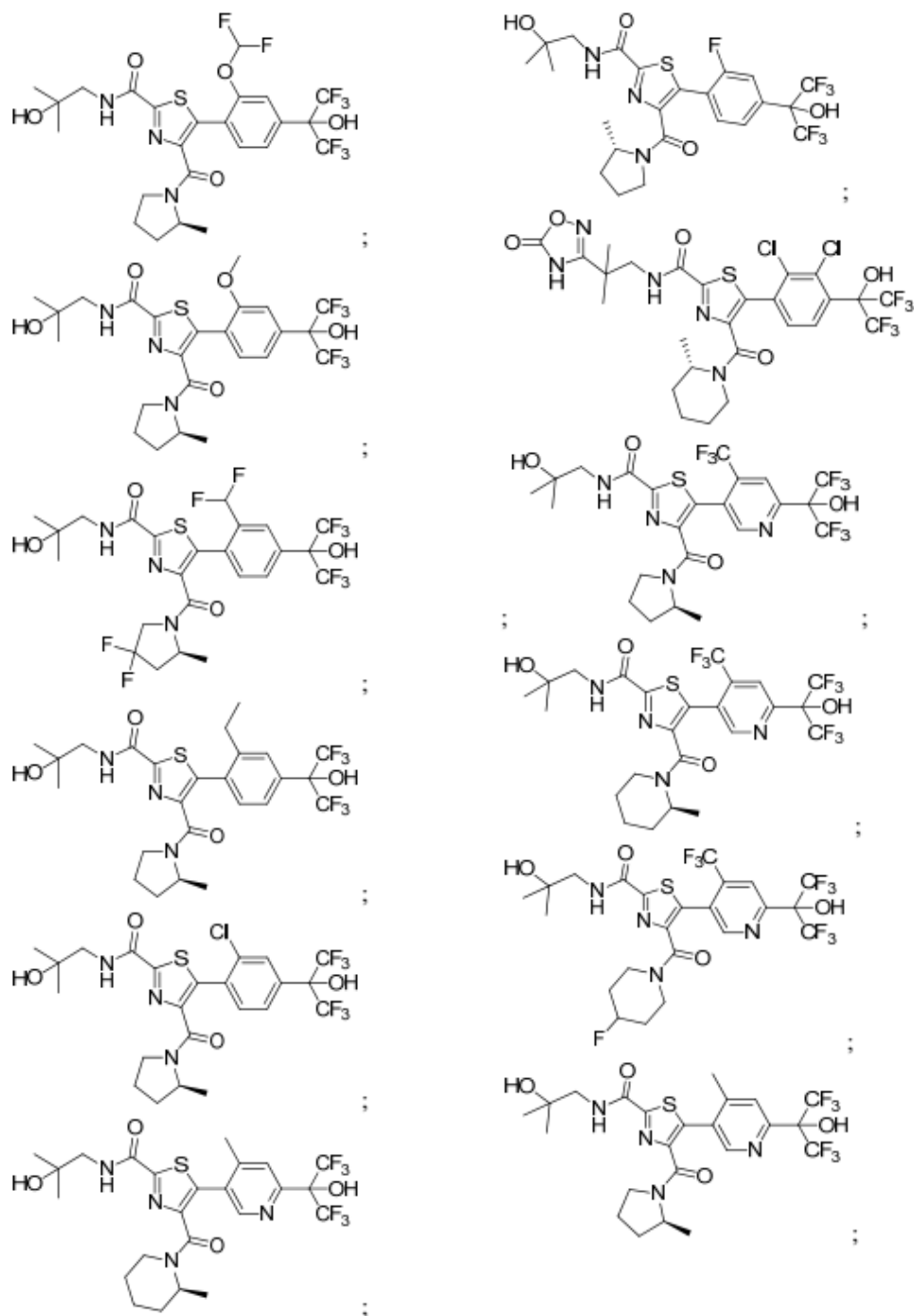
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

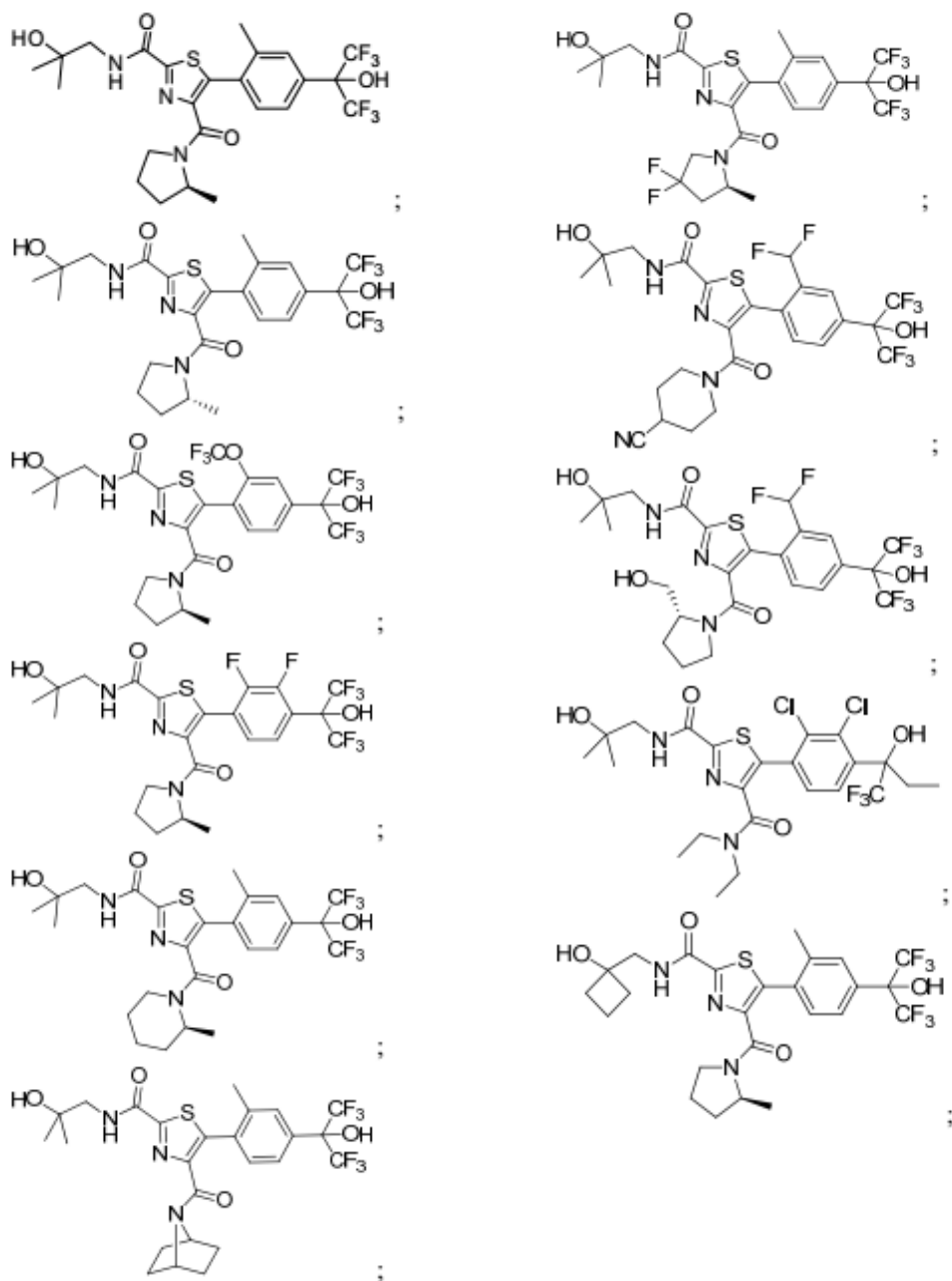
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

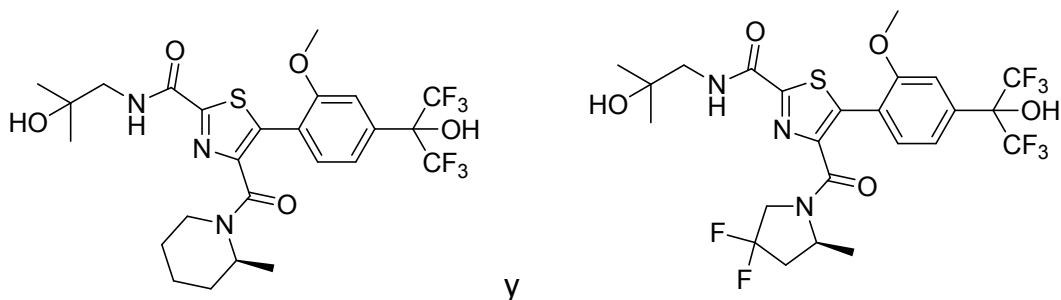
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

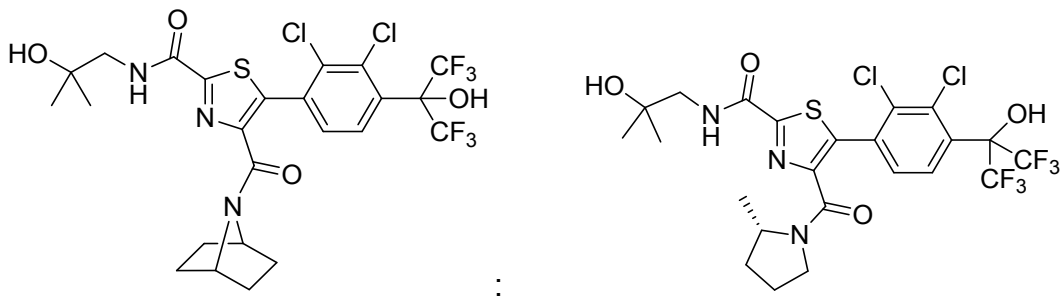
Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014



y sales farmacéuticamente aceptables de este.

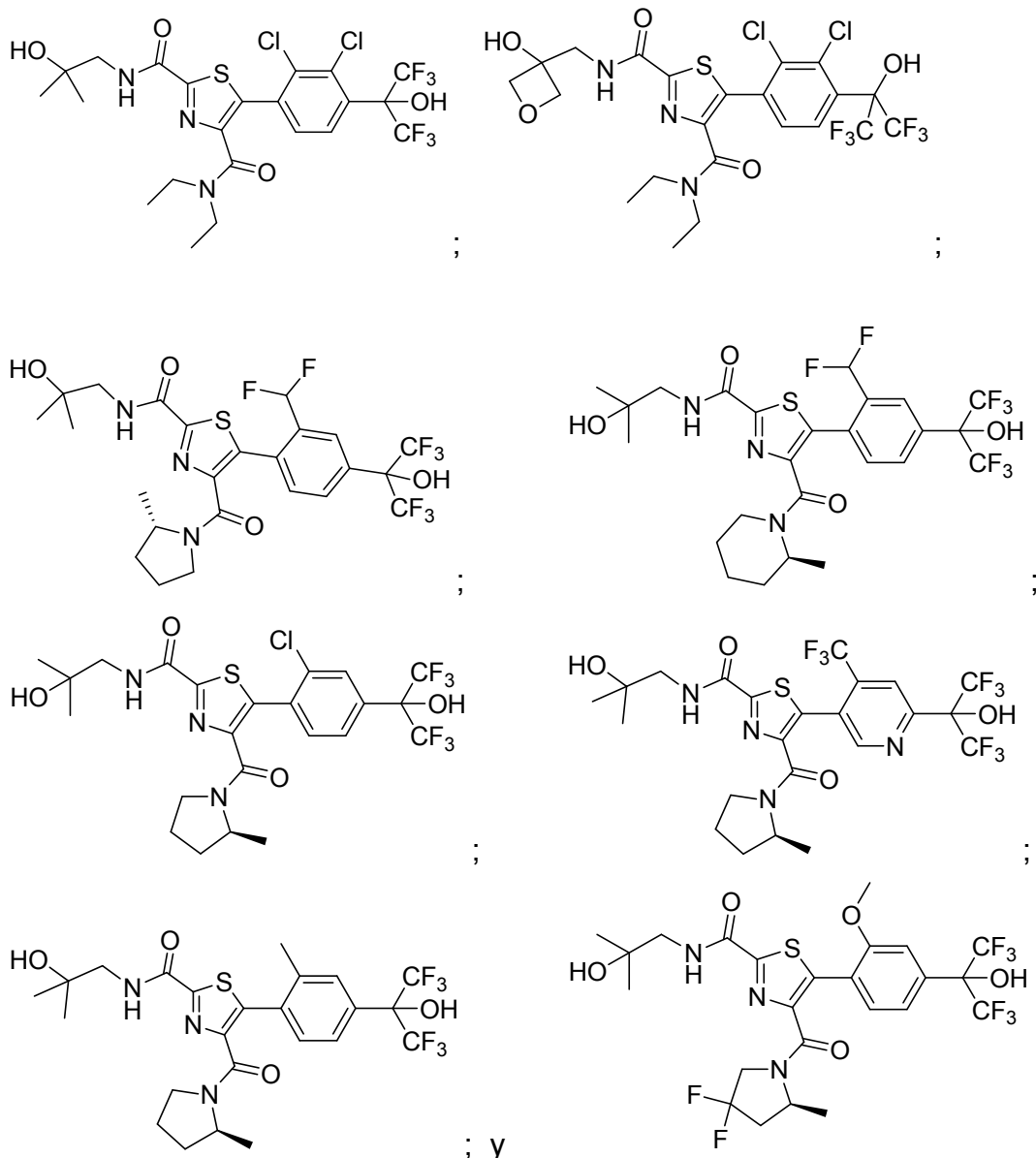
3. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de la reivindicación 1 y un portador farmacéuticamente aceptable.
4. Una composición farmacéutica que se elabora al mezclar un compuesto de la reivindicación 1 y un portador farmacéuticamente aceptable.
5. Un proceso para elaborar una composición farmacéutica; el proceso comprende mezclar un compuesto de la reivindicación 1 y un portador farmacéuticamente aceptable.
6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, seleccionado del grupo que consiste en:



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014



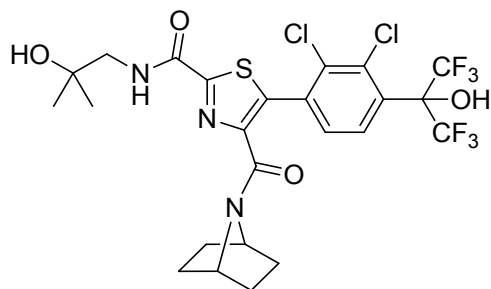
y sales farmacéuticamente aceptables de este.

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, que es:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

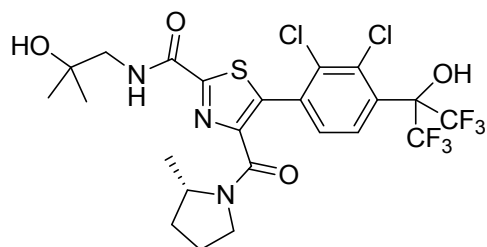
Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014



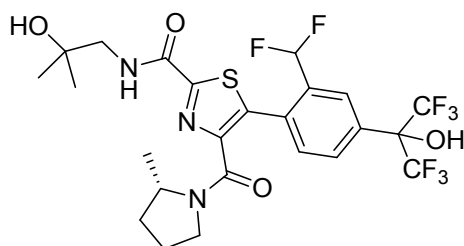
y sales farmacéuticamente aceptables de este.

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, que es:



y sales farmacéuticamente aceptables de este.

9. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, que es:



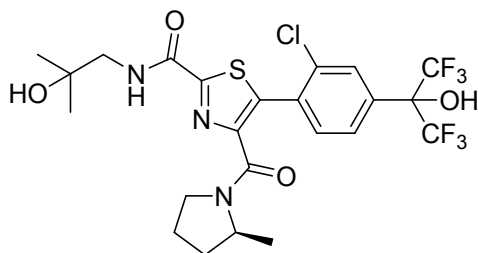
y sales farmacéuticamente aceptables de este.

10. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, que es:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

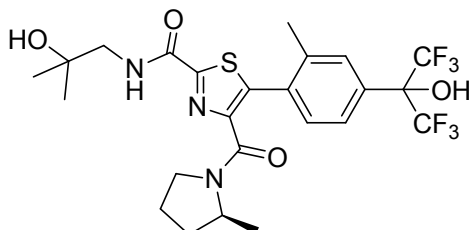
Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014



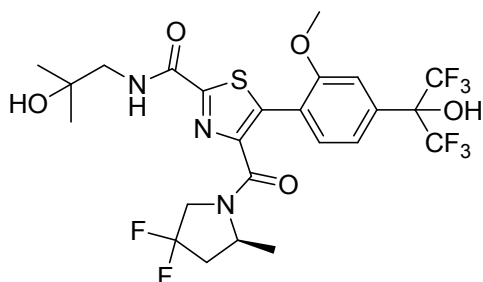
y sales farmacéuticamente aceptables de este.

11. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, que es:



y sales farmacéuticamente aceptables de este.

12. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 6, que es:



y sales farmacéuticamente aceptables de este.

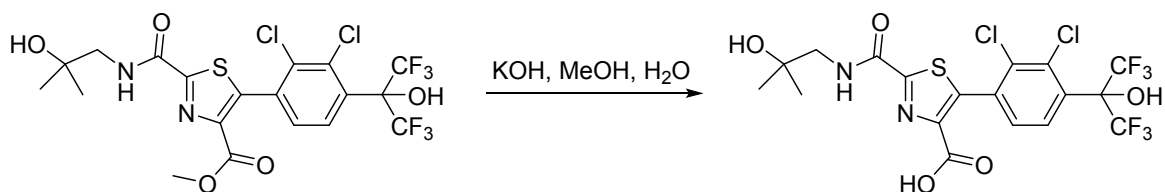
13. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de la reivindicación 6 y un portador farmacéuticamente aceptable.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

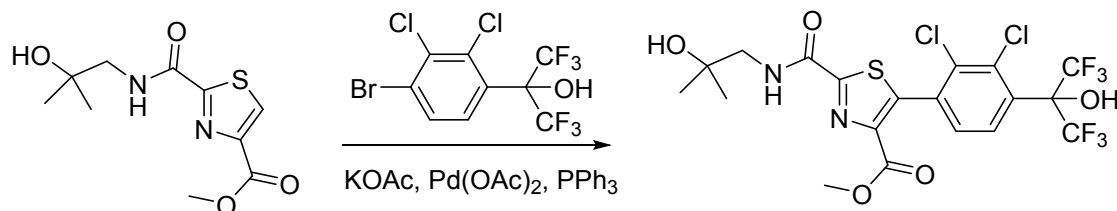
Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

17. El método de la reivindicación 16, que además comprende el paso de hacer ácido 5-(2,3-dicloro-4-(1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-hidroxiopropan-2-il)fenil)-2-((2-hidroxi-2-metilpropil)carbamoil)thiazole-4-carboxílico al hacer reaccionar 5-(2,3-dicloro-4-(1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-hidroxiopropan-2-il)fenil)-2-((2-hidroxi-2-metilpropil)carbamoil)thiazol-4-carboxilato de metilo con KOH, metanol, y agua, como se muestra en la reacción a continuación:



18. El método de la reivindicación 17, que además comprende el paso de hacer 5-(2,3-dicloro-4-(1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-hidroxiopropan-2-il)fenil)-2-((2-hidroxi-2-metilpropil)carbamoil)thiazol-4-carboxilato de metilo al hacer reaccionar 2-(4-bromo-2,3-diclorofenil)-1,1,1,3,3,3-hexafluoropropan-2-ol con 2-((2-hidroxi-2-metilpropil)carbamoil)thiazol-4-carboxilato de metilo, KOAc, Pd(OAc)₂, y PF₃, como se muestra en la reacción a continuación:

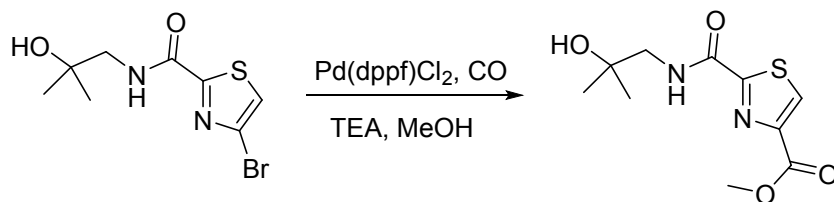


19. El método de la reivindicación 18, que además comprende el paso de hacer 2-((2-hidroxi-2-metilpropil)carbamoil)thiazol-4-carboxilato de metilo al hacer reaccionar 4-bromo-N-(2-hidroxi-2-metilpropil)thiazol-2-carboxamida, TEA, MeOH, y Pd(dppf)Cl₂, como se muestra en la siguiente reacción:

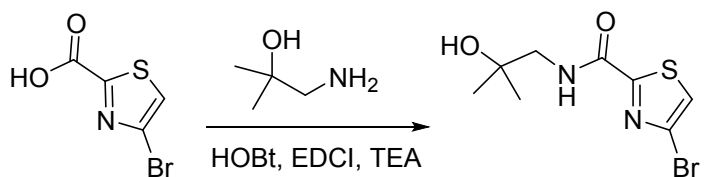
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 69436

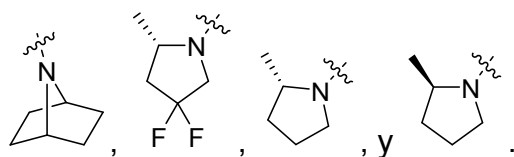
Ref. Expediente N° NC2017/0005014



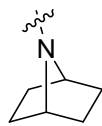
20. El método de la reivindicación 19, que además comprende el paso de hacer 4-bromo-N-(2-hidroxi-2-metilpropil)thiazol-2-carboxamida al hacer reaccionar ácido 4-bromotiazol-2-carboxílico, HOBt, 1-amino-2-metil-propan-2-ol, EDCI, and TEA como se muestra en la siguiente reacción:



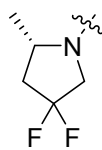
21. El método de la reivindicación 16, en donde R¹ además se selecciona del grupo que consiste de:



22. El método de la reivindicación 20, en donde R¹ es



23. El método de la reivindicación 20, en donde R¹ es



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

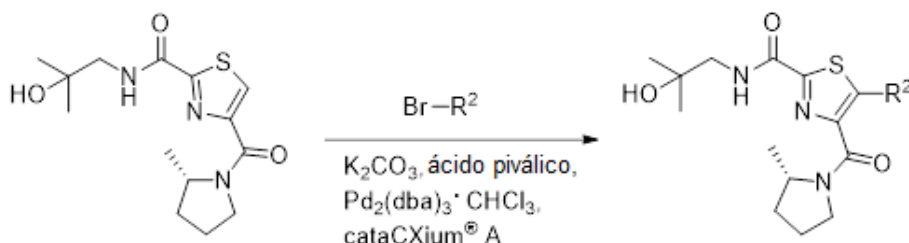
Resolución N° 69436

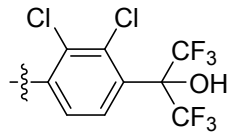
Ref. Expediente N° NC2017/0005014

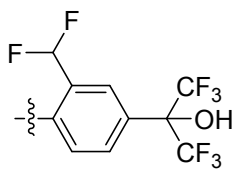
24. El método de la reivindicación 20, en donde R¹ es .

25. El método de la reivindicación 20, en donde R¹ es .

26. Un método para hacer una (S)-5-(R²)-N-(2-hidroxi-2-metilpropil)-4-(2-metilpirrolidina-1-carbonil)tiazol-2-carboxamida que comprende el paso de hacer reaccionar (S)-N-(2-hidroxi-2-metilpropil)-4-(2-metilpirrolidina-1-carbonil)tiazol-2-carboxamida, R²-Br, K₂CO₃, ácido pivalico, Pd₂(dba)₃·CHCl₃, y cataCXium® A, como se muestra en la siguiente reacción:



en donde R² se selecciona del grupo que consiste de:  y



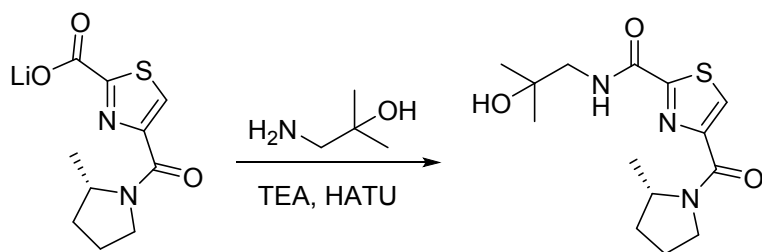
27. El método de la reivindicación 26, que además comprende la síntesis de (S)-N-(2-hidroxi-2-metilpropil)-4-(2-metilpirrolidina-1-carbonil)tiazol-2-carboxamida por

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

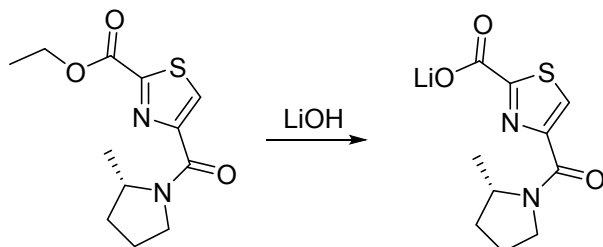
Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

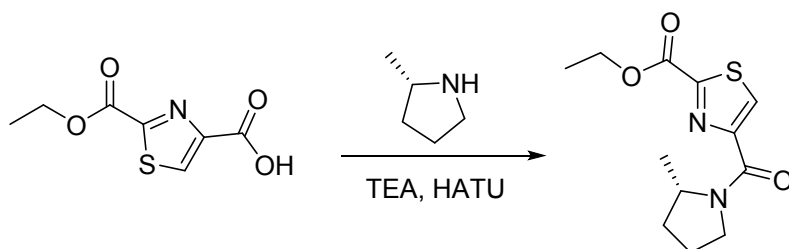
medio de la reacción de (S)-4-(2-metilpirrolidina-1-carbonil)tiazol-2-carboxilato de litio y 1-amino-2-metilpropan-2-ol, TEA, y HATU, como se muestra en la siguiente reacción:



28. El método de la reivindicación 27, que además comprende la síntesis de (S)-4-(2-metilpirrolidina-1-carbonil)tiazol-2-carboxilato de litio por medio de la reacción de (S)-4-(2-metilpirrolidina-1-carbonil)tiazol-2-carboxilato de etilo con LiOH, como se muestra en la siguiente reacción:



29. El método de la reivindicación 28, que además comprende la síntesis de (S)-4-(2-metilpirrolidina-1-carbonil)tiazol-2-carboxilato de etilo por medio de la reacción de ácido 2-(etoxicarbonil)tiazol-4-carboxílico, (S)-2-metilpyrrolidina, TEA, y HATU, como se muestra en la siguiente reacción:

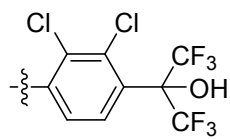


REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

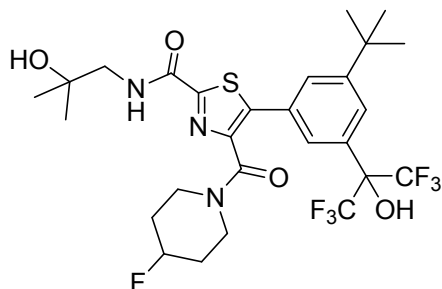
Resolución N° 69436

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

30. El método de la reivindicación 29, en donde R² es:



31. Un compuesto que es:



y sales farmacéuticamente aceptables de este.