

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 5634

Ref. Expediente N° NC2017/0009614

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 22 de septiembre de 2017, con el N° NC2017/0009614, por AMGEN INC., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “COMPUESTOS BICÍCLICOS DE SULFONAMIDA CETONA”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2016/020403 del 2 de marzo de 2016.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 815 el 16 de enero de 2018, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 9014, notificado el 24 de julio 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° NC2017/0009614 el 18 de octubre de 2018, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentan nuevas reivindicaciones 1 a 16 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 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 16 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0009614 del 18 de octubre de 2018, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior y, en consecuencia, este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 5634

Ref. Expediente N° NC2017/0009614

SÉPTIMO: Que de acuerdo con la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2017/0009614 del 18 de octubre de 2018 y teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS INHIBIDORES DE NAV1.7 DERIVADOS DE 2-OXO-1,5,7,8-TETRAHIDRO-1,6-NAFTIRIDIN-6(2H)-SULFONAMIDA”.

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:

“COMPUESTOS INHIBIDORES DE NAV1.7 DERIVADOS DE 2-OXO-1,5,7,8-TETRAHIDRO-1,6-NAFTIRIDIN-6(2H)-SULFONAMIDA”

Clasificación IPC: C07D 471/04, A61K 31/437, A61P 29/00

Reivindicaciones: 1 a 16 incluidas en el radicado bajo el No NC2017/0009614 el 18 de octubre de 2018, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: AMGEN INC.

Domicilio: One Amgen Center Dr.
Thousand Oaks, California 91320
91320
ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA.

Inventores: Matthew WEISS, Benjamin C. MILGRAM, Thomas DINEEN, John STELLWAGEN, Angel GUZMAN-PEREZ, Alessandro BOEZIO, Isaac E. MARX.

Prioridad N° 02/03/2015, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/127,206.

Solicitud internacional N°: PCT/US2016/020403 **Fecha:** 2 de marzo de 2016.

Vigente desde: 2 de marzo de 2016 **Hasta:** 2 de marzo de 2036.

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.

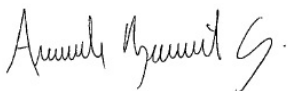
**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Resolución N° 5634

Ref. Expediente N° NC2017/0009614

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a AMGEN INC., 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., el 11 de abril de 2019



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

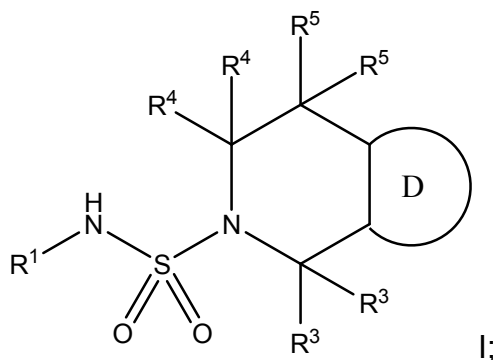
Resolución N° 5634

Ref. Expediente N° NC2017/0009614

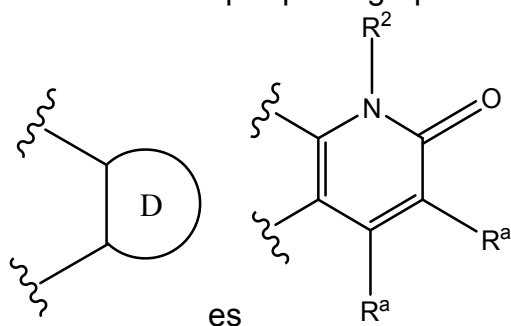
ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto de la Fórmula (I), un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos,



caracterizado porque el grupo:



R^1 es un arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, en donde el grupo heteroarilo tiene desde 1 hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de O, N o S, y el grupo arilo o heteroarilo está sustituido con 0, 1, 2, 3, o 4 sustituyentes seleccionados independientemente de halo, -CN, -alquiloC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, -OH, -O-alquiloC₁₋₆, -O-haloalquiloC₁₋₆, -C(=O)OR^a, o -(CR^bR^b)_nNR^aR^a;

R^2 es alquiloC₁₋₆, o un arilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros, donde el grupo heteroarilo tiene desde 1 hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de O, N o S, y el grupo alquilo, arilo o heteroarilo está no sustituido o está sustituido con desde 1 hasta 5 sustituyentes R⁶ seleccionados independientemente de halo, -CN, -alquiloC₁₋₆, haloalquiloC₁₋₆, -OH, -O-alquiloC₁₋₆, -O-haloalquiloC₁₋₆, -(CR^bR^b)_mA, -alquenoC₂₋₆-A, -alquinoC₂₋₆-A, o -O(CR^bR^b)_mA;

cada R³ es seleccionado independientemente de H o -alquiloC₁₋₆;

cada R⁴ es seleccionado independientemente de H o -alquiloC₁₋₆;

cada R⁵ es H;



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 5634

Ref. Expediente N° NC2017/0009614

A es un grupo arilo o heteroarilo de 4 hasta 9 miembros, o un grupo cicloalquilo de 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, o 10 miembros, donde el grupo heteroarilo tiene desde 1 hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de O, N o S; y el grupo arilo, heteroarilo o cicloalquilo está sustituido con 0, 1, 2, 3, o 4 sustituyentes R^7 seleccionados independientemente de halo, $-NR^aR^a$, $-\text{alquiloC}_{1-6}$, $-\text{O-alquiloC}_{1-6}$, $-(CR^bR^b)_mOH$, hidroxialquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , $-\text{O-haloalquiloC}_{1-6}$, $-\text{CN}$, $-\text{C}(=\text{O})NR^aR^a$, $-\text{O}-(CR^bR^b)_mB$ o $-(CR^bR^b)_mB$;

B es un grupo arilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo de 5 hasta 6 miembros, o un grupo cicloalquilo de 3 hasta 5 miembros, donde el grupo heteroarilo o heterocicloalquilo tiene desde 1 hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de O, N o S; y el grupo arilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocicloalquilo está sustituido con 0, 1, 2, 3, o 4 sustituyentes R^8 seleccionados independientemente de halo, $-NR^aR^a$, $-\text{alquiloC}_{1-6}$, $-\text{OalquiloC}_{1-6}$, hidroxialquilo C_{1-6} , $-\text{CF}_3$, $-\text{CHF}_2$, $-\text{CH}_2\text{F}$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCHF}_2$, $-\text{OCH}_2\text{F}$, $-\text{CN}$ o $-\text{C}(=\text{O})NR^aR^a$;

cada R^a es independientemente H o $-\text{alquiloC}_{1-6}$;

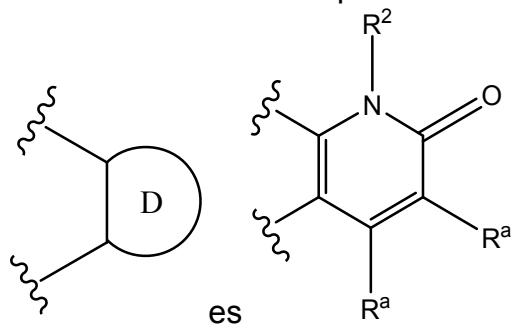
cada R^b es independientemente H o $-\text{alquiloC}_{1-6}$;

cada R^c es independientemente H o $-\text{alquiloC}_{1-6}$;

cada n es independientemente 0, 1, 2, 3 o 4; y

cada m es 0.

2. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque el grupo



3. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque R^2 es un grupo arilo de 6 miembros o heteroarilo de 6 miembros.

4. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque R^2 es fenilo.

5. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque R^2 está sustituido con desde 1 hasta 3 sustituyentes R^6 seleccionados independientemente de $-\text{OalquiloC}_{1-6}$, halo, $-\text{alquiloC}_{1-6}$, haloalquilo C_{1-6} , $-(CR^bR^b)_m-A$, o $-\text{alquinoC}_{2-6}-A$.



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 5634

Ref. Expediente N° NC2017/0009614

6. El compuesto de conformidad con la reivindicación 5, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque en el grupo R^6 - $(CR^bR^b)_m$ -A, A es un anillo seleccionado de fenilo, piridilo, o pirimidinilo, en donde el anillo está sustituido con 0, 1, 2, 3, o 4 R^7 sustituyentes seleccionados independientemente de cloro, fluoro, metilo, metoxi, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CH_2F$, $-OCF_3$, $-OCHF_2$, $-OCH_2F$, $-OCH_2CF_3$, o $-CN$; cada R^b es independientemente H o $-alquiloC_{1-6}$; y m es 0 o 1.

7. El compuesto de conformidad con la reivindicación 5, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque en el grupo R^6 - alquinilo C_{2-6} -A, A es un anillo cicloalquilo C_{3-8} sustituido con 0, 1, 2, 3, o 4 sustituyentes R^7 seleccionados de cloro, fluoro, metilo, metoxi, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CH_2F$, $-OCF_3$, $-OCHF_2$, $-OCH_2F$, o $-CN$.

8. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque R^2 es anillo fenilo o piridinilo sustituido con 3 sustituyentes R^6 que comprende:

- (a) *orto* para el anillo D: R^6 es seleccionado de metilo, metoxi o etoxi;
- (b) *meta* para el anillo D: R^6 es seleccionado de ausente, metilo, F, o Cl; y
- (c) *para* para el anillo D: R^6 es seleccionado de halo, anillo fenilo, o anillo piridilo; en donde cada uno del anillo fenilo o anillo piridilo, está sustituido con 0, 1, 2, 3, o 4 sustituyentes R^7 seleccionados de F, Cl, metilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CH_2F$, $-OCF_3$, $-OCHF_2$, $-OCH_2F$, o $-CN$.

9. El compuesto de conformidad con la reivindicación 8, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque el R^2 es anillo fenilo.

10. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque cada uno de R^3 y R^4 es seleccionado independientemente de H o metilo.

11. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque R^1 es un grupo heteroarilo de 5 hasta 6 miembros.

12. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque R^1 es anillo isoxazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo, piridazinilo, piridilo, o pirimidinilo, en donde el anillo



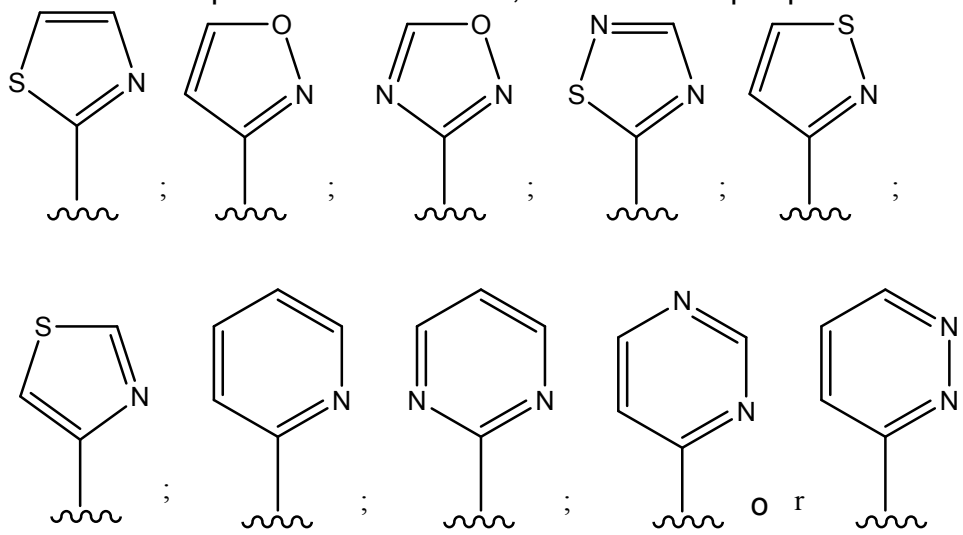
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 5634

Ref. Expediente N° NC2017/0009614

está no sustituido o está sustituido con 0, 1, 2, 3, o 4 sustituyentes seleccionados independientemente de halo o -alquiloC₁₋₆.

13. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque R¹ es:



en donde el anillo está no sustituido o está sustituido con 0, 1, 2, 3, o 4 sustituyentes seleccionados independientemente de halo o -alquiloC₁₋₆.

14. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, caracterizado porque es seleccionado de:

- 1-(4'-cloro-2-fluoro-3',5-dimetoxi-4-bifenilil)-2-oxo-N-3-piridazinil-1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
- 1-(4'-cloro-2-fluoro-3',5-dimetoxi-4-bifenilil)-N-3-isoxazolil-2-oxo-1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
- 1-(2-fluoro-5-metoxi-3'-(trifluorometil)-4-bifenilil)-N-3-isoxazolil-2-oxo-1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
- 1-(3'-cloro-2,5'-difluoro-5-metoxi-4-bifenilil)-N-3-isoxazolil-2-oxo-1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
- 1-(5-fluoro-2-metoxi-4-(2-metoxi-5-(trifluorometil)-3-piridinil)fenil)-N-3-isoxazolil-2-oxo-1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
- 1-(4'-cloro-2-fluoro-5-metoxi-3'-metil-4-bifenilil)-N-3-isoxazolil-2-oxo-1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
- 1-(4'-cloro-2-fluoro-5-metoxi-3'-metil-4-bifenilil)-2-oxo-N-2-pirimidinil-1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
- 2-oxo-N-3-piridazinil-1-(2,3',4'-trifluoro-5-metoxi-4-bifenilil)-1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
- 1-(4'-cloro-2-fluoro-5-metoxi-3'-metil-4-bifenilil)-2-oxo-N-3-piridazinil-1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
- 1-(3'-cloro-2,5'-difluoro-5-metoxi-4-bifenilil)-2-oxo-N-3-piridazinil-1,5,7,8-



**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Resolución N° 5634

Ref. Expediente N° NC2017/0009614

tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
1-(4'-cloro-2-fluoro-5-metoxi-3'-metil-4-bifenilil)-2-oxo-N-1,3-tiazol-2-il-1,5,7,8-
tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
1-(2,3'-difluoro-5-metoxi-5'-(trifluorometil)-4-bifenilil)-2-oxo-N-3-piridazinil-
1,5,7,8-tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
1-(3'-ciclopropil-2-fluoro-5-metoxi-4-bifenilil)-2-oxo-N-3-piridazinil-1,5,7,8-
tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
1-(2-fluoro-5-metoxi-3'-(trifluorometil)-4-bifenilil)-2-oxo-N-3-piridazinil-1,5,7,8-
tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
2-oxo-N-3-piridazinil-1-(2,3',4',5'-tetrafluoro-5-metoxi-4-bifenilil)-1,5,7,8-
tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
1-(2,4'-dicloro-3',5'-dimetoxi-4-bifenilil)-N-3-isoxazolil-2-oxo-1,5,7,8-tetrahidro-
1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
1-(2,3'-dicloro-5'-fluoro-5-metoxi-4-bifenilil)-N-3-isoxazolil-2-oxo-1,5,7,8-
tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida;
1-(2-cloro-5-metoxi-3'-(trifluorometil)-4-bifenilil)-N-3-isoxazolil-2-oxo-1,5,7,8-
tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida; y
1-(2-fluoro-3',5'-dimetoxi-4'-metil-4-bifenilil)-N-3-isoxazolil-2-oxo-1,5,7,8-
tetrahidro-1,6-naftiridin-6(2H)-sulfonamida.

15. El compuesto de conformidad con la reivindicación 14, caracterizado porque el compuesto es un atropisómero P.

16. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende el compuesto de conformidad con la reivindicación 1, un enantiómero, diaestereómero, atropisómero del mismo, o una mezcla de los mismos, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, y un excipiente farmacéuticamente aceptable.

