

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 17697

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

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° NC2017/0008156, por IDORSIA PHARMACEUTICALS LTD, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “DERIVADOS DE HIDROXIALQUIL-PIPERAZINA COMO MODULADORES DEL RECEPTOR CXCR3”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2016/050645 del 14 de enero de 2016.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 812 el 30 de noviembre de 2017, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 12244, notificado el 11 de octubre 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° NC2017/0008156 el 10 de enero de 2019, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 13 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 13 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0008156 del 10 de enero de 2019 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 la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2017/0008156 del 10 de enero de 2019 y teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “DERIVADOS DE 1-(4-(4-(PIRIMIDIN-5-IL)TIAZOL-5-IL)PIPERAZIN-1-IL)ETAN-1-ONA COMO MODULADORES DE RECEPTORES CXCR3 Y COMPOSICIONES QUE LOS COMPRENDEN”.

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

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

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 1-(4-(4-(PIRIMIDIN-5-IL)TIAZOL-5-IL)PIPERAZIN-1-IL)ETAN-1-ONA COMO MODULADORES DE RECEPTORES CXCR3 Y COMPOSICIONES QUE LOS COMPRENDEN”

Clasificación IPC: C07D 417/14, A61K 31/427, A61P 37/00.

Reivindicaciones: 1 a 13 incluidas en el radicado bajo el No NC2017/0008156 del 10 de enero de 2019, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: IDORSIA PHARMACEUTICALS LTD.

Domicilio: HEGENHEIMERMATTWEG 91, ALLSCHWIL CH-4123 BASEL-LANDSCHAFT, SUIZA.

Inventores: Eva CAROFF, Emmanuel MEYER.

Prioridad N° 15/01/2015, EP, PCT/EP2015/050696.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2016/050645

Fecha: 14 de enero de 2016.

Vigente desde: 14 de enero de 2016

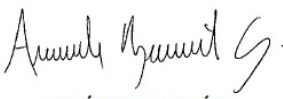
Hasta: 14 de enero de 2036.

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.

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a IDORSIA PHARMACEUTICALS LTD, 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 29 de mayo de 2019



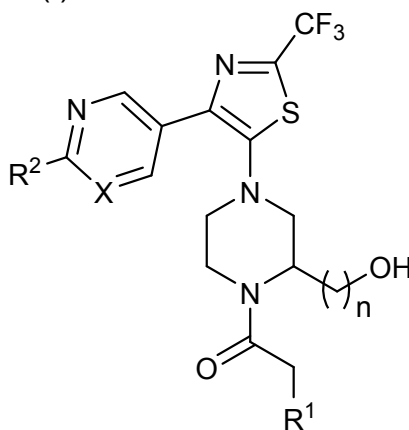
ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

Habiendo así especialmente descripto y determinado la naturaleza de la presente invención y la forma en que la misma ha de ser llevada a la práctica, se declara reivindicar como de propiedad y derecho exclusivo:

1. Un compuesto de Fórmula (I)



Fórmula (I)

en donde

n representa el número entero 1 o 2;

X representa N;

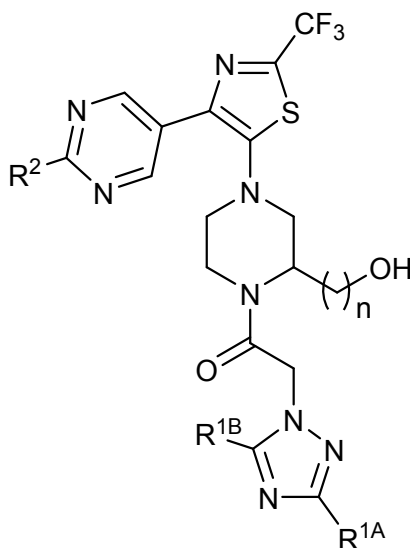
R¹ representa un grupo heteroarilo monocíclico de 5 miembros que contiene 2 o 3 átomos de nitrógeno que está, de manera independiente, mono- o di-sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan, de manera independiente, del grupo integrado por alquilo(C₁₋₄), cicloalquilo(C₃₋₆), alcoxi(C₁₋₂)-alquilo(C₁₋₂), hidroxi-alquilo(C₁₋₄) y fluoroalquilo(C₁₋₂); o un anillo aromático bicíclico de 9 miembros que contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno que está no sustituido o mono-sustituido con alcoxi(C₁₋₄) o halógeno; y

R² representa cicloalquilo(C₃₋₆), alcoxi(C₁₋₄) o trifluorometilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, en donde **R¹** representa un grupo heteroarilo monocíclico de 5 miembros que contiene 2 o 3 átomos de nitrógeno que está, de manera independiente, mono- o di-sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan, de manera independiente, del grupo integrado por alquilo(C₁₋₄), cicloalquilo(C₃₋₆) y fluoroalquilo(C₁₋₂); o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que además es un compuesto de Fórmula (I_{TA})

Resolución N° 17697

Ref. Expediente N° NC2017/0008156



Fórmula (I_{TA})

en donde

n representa el número entero 1 o 2;

R^{1A} representa alquilo(C₁₋₄), cicloalquilo(C₃₋₆), alcoxi(C₁₋₂)-alquilo(C₁₋₂), hidroxi-alquilo(C₁₋₄) o fluoroalquilo(C₁₋₂);

R^{1B} representa hidrógeno o alquilo(C₁₋₄); y

R² representa cicloalquilo(C₃₋₆), alcoxi(C₁₋₄) o trifluorometilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, en donde **R^{1A}** representa alquilo(C₁₋₄) o cicloalquilo(C₃₋₆);
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 3 o 4, en donde **R^{1B}** representa hidrógeno;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 3 o 4, en donde **R^{1B}** representa metilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde **R²** representa trifluorometilo;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del grupo integrado por:
2-(3-ter-butil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-[(S)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il]-etanona;
2-(3,5-dimetil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-[(S)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il]-etanona;
2-(3-ciclopropil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-[(S)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il]-etanona;
1-[(S)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il]-2-(3-isopropil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
1-[(S)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il]-2-(3-trifluorometil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
1-[(S)-4-[4-(2-etoxi-pirimidin-5-il)-2-trifluorometil-tiazol-5-il]-2-hidroximetil-piperazin-1-il]-2-(3-trifluorometil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

2-(3,5-dimetil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((S)-4-[4-(2-etoxi-pirimidin-5-il)-2-trifluorometil-tiazol-5-il]-2-hidroximetil-piperazin-1-il)-etanona;
1-((S)-4-[4-(2-ciclopropil-pirimidin-5-il)-2-trifluorometil-tiazol-5-il]-2-hidroximetil-piperazin-1-il)-2-(3,5-dimetil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
1-((S)-4-[4-(2-ciclopropil-pirimidin-5-il)-2-trifluorometil-tiazol-5-il]-2-hidroximetil-piperazin-1-il)-2-(3-trifluorometil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(3-isopropil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
2-(3,5-dimetil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
2-benzoimidazol-1-il-1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
2-(5-fluoro-indol-1-il)-1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(5-metoxi-indol-1-il)-etanona;
1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(3-metil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(3-metoximetil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
2-[3-(1-hidroxi-etil)-[1,2,4]triazol-1-il]-1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(3-metil-pirazol-1-il)-etanona;
2-(3-etil-5-metil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
2-(5-etil-3-metil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-imidazo[4,5-b]piridin-3-il-etanona;
2-(3,5-dimetil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(3-trifluorometil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
2-(3-ciclobutil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
2-(3-ter-butil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
2-(3-ciclopropil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
2-(3-etil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
2-(5-etil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(3-isopropil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(3-metil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(5-metil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
1-((R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-2-(3-metoximetil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona; y
2-(3-difluorometil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-((R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il)-etanona;
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.



Ref. Expediente N° NC2017/0008156

9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del grupo integrado por:
- 1-{(R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il}-2-(3-metil-pirazol-1-il)-etanona;
 - 2-(3-etil-pirazol-1-il)-1-{(R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il}-etanona;
 - 2-(3-ciclopropil-pirazol-1-il)-1-{(R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il}-etanona;
 - 1-{(S)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il}-2-(3-metil-pirazol-1-il)-etanona;
 - 2-(3-etil-pirazol-1-il)-1-{(S)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il}-etanona; y
 - 2-(3-ciclopropil-pirazol-1-il)-1-{(S)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il}-etanona;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
10. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, en donde el compuesto es
- 1-{(R)-2-hidroximetil-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il}-2-(3-metil-pirazol-1-il)-etanona;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
11. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, en donde el compuesto es
- 2-(3-etil-[1,2,4]triazol-1-il)-1-{(R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il}-etanona;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
12. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, en donde el compuesto es
- 1-{(R)-2-(2-hidroxi-etil)-4-[2-trifluorometil-4-(2-trifluorometil-pirimidin-5-il)-tiazol-5-il]-piperazin-1-il}-2-(3-metil-[1,2,4]triazol-1-il)-etanona;
- o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
13. Una composición farmacéutica que comprende, como principio activo, un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un(os) excipiente(s) terapéuticamente inerte(s).

