

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 42487

Ref. Expediente N° NC2017/0003004

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 28 de marzo de 2017, con el N° NC2017/0003004, por F. HOFFMANN-LA ROCHE AG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “NUEVAS TRIAZOLO[4,5-D]PIRIMIDINAS”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2015/075654 del 4 de noviembre de 2015.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 799 el 19 de julio de 2017, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 8625, notificado el 16 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° NC2017/0003004 el 26 de noviembre de 2018, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentan nuevas reivindicaciones 1 a 12 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: En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 12 cumplen los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial establecidos en la normatividad citada en precedencia y este Despacho encuentra procedente conceder la patente solicitada.

Resolución N° 42487

Ref. Expediente N° NC2017/0003004

SÉPTIMO: Que de acuerdo la modificación presentada por el solicitante y con el objeto concedido, el título de la invención quedará de la siguiente manera: “NUEVAS TRIAZOLO[4,5-D]PIRIMIDINAS COMO AGONISTAS DEL RECEPTOR DE CANNABINOIDE 2”.

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:

“ NUEVAS TRIAZOLO[4,5-D]PIRIMIDINAS COMO AGONISTAS DEL RECEPTOR DE CANNABINOIDE 2 ”

Clasificación IPC: C07D 487/04, A61K 31/519.

Reivindicación(es): 1 a 12 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0003004 del 26 de noviembre de 2018, de acuerdo con el anexo 1.

Titular(es): F. HOFFMANN- LA ROCHE AG.

Domicilio(s): GRENZACHERSTRASSE 124, CH-4070 BASEL, SUIZA,
BASEL BASEL,
SUIZA.

Inventor(es): Uwe GRETHER, Matthias NETTEKOVEN, Mark ROGERS-EVANS,
Benjamin James STENTON y Sébastien SCHMITT.

Prioridad(es) N° 07/11/2014, EP14192245.0.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2015/075654. **Fecha:** 4 de noviembre de 2015.

Vigente desde: 4 de noviembre de 2015. **Hasta:** 4 de noviembre 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.



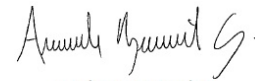
Resolución N° 42487

Ref. Expediente N° NC2017/0003004

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a F. HOFFMANN-LA ROCHE AG, 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 4 de septiembre de 2019



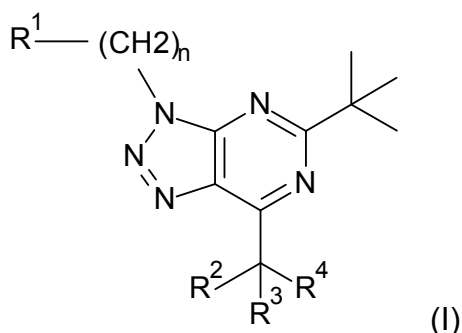
ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZÁLEZ
Fecha: 2019.09.04
12:02:43 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

ANEXO 1.

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Compuesto de fórmula (I):



en la que:

n es 0, 1 ó 2,

R¹ esfenilo, halofenilo, alquilsulfonilfenilo, alquiltetrazolilo, alquioxadiazolilo, halohidroalquilo, oxolanilo, oxetanilo, haloalquilo, halopiridinilo o alquioxetanilo,

R² es hidrógeno, hidroxilo, halógeno o haloalquilo, y

R³ y R⁴ se seleccionan independientemente de entre alquilo, o

R³ y R⁴, conjuntamente con el átomo de carbono al que se encuentran unidos, forman cicloalquilo, tietanilo, haloalquilocicloalquilo u oxotietanilo,

o

R² se encuentra ausente, y

R³ y R⁴, conjuntamente con el átomo de carbono al que se encuentran unidos, forman alquifenilo, halofenilo, alcoxifenilo, halopiridinilo, alquilpiridinilo, alquilpirazolilo, fenilo, alquioxazolilo, pirazolilo, imidazolilo, benciltriazolilo o cicloalquenilo,

o una sal o éster farmacéuticamente aceptable del mismo;

en donde

alquilo, solo o en combinación, significa un grupo alquilo de cadena lineal o cadena ramificada con 1 a 8 átomos de carbono;

cicloalquilo, solo o en combinación, significa un anillo cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono;

cicloalquenilo, solo o en combinación, se refiere a un grupo cicloalquilo como se definió anteriormente en donde uno o más enlaces simples carbono-carbono se reemplazan por un doble enlace carbono-carbono; y

alcoxi, solo o en combinación, significa un grupo de la fórmula alquil-O- en el que el término alquilo tiene el significado dado previamente.

2. Compuesto según la reivindicación 1, en el que R¹ es fenilo, halofenilo, alquiltetrazolilo o alquioxadiazolilo.
3. Compuesto según la reivindicación 1 o 2, en el que R¹ es fenilo, clorofenilo, metiltetrazolilo o metiloxadiazolilo.
4. Compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que R² se encuentra ausente y R³ y R⁴, conjuntamente con el átomo de carbono al que se encuentran unidos, forman halopiridinilo, alquilpirazolilo o alquioxazolilo, o R² es hidroxilo y R³ y



Resolución N° 42487

Ref. Expediente N° NC2017/0003004

R⁴, conjuntamente con el átomo de carbono al que se encuentran unidos, forman cicloalquilo.

5. Compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que R² se encuentra ausente y R³ y R⁴, conjuntamente con el átomo de carbono al que se encuentran unidos, forman fluoropiridinilo, metilpirazolilo o metiloxazolilo, o R² es hidroxilo y R³ y R⁴, conjuntamente con el átomo de carbono al que se encuentran unidos, forman ciclobutilo.
6. Compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que n es 1.
7. Compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, seleccionado de entre:
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(4-metilfenil)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(4-fluorofenil)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(4-metoxifenil)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(2-fluorofenil)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-7-(4-cloro-2-fluorofenil)-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(6-fluoropiridín-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(5-metilpiridín-2-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(1-metilpirazol-4-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(2-metilpirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-feniltriazolo[4,5-d]pirimidina,
4-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]-5-metil-1,2-oxazol,
5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)-3-[(2-metilsulfonilfenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina,
3-[[5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]-4-metil-1,2,5-oxadiazol,
2-[[5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]-5-metil-1,3,4-oxadiazol,
1-[5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]-4,4,4-trifluorobután-2-ol,
(2S)-3-[5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]-1,1,1-trifluoropropán-2-ol,
5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)-3-(oxolán-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)-3-(oxetán-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)-3-(3,3,3-trifluoropropil)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(3-cloropiridín-2-il)metil]-7-(2-metilpirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
1-[5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]-2-metilpropán-2-ol,
5-*terc*-butil-3-[(3-metiloxetán-3-il)metil]-7-(2-metilpirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-7-(1-metilpirazol-4-il)-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]-7-(1H-pirazol-4-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]-7-(1H-pirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
4-[5-*terc*-butil-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]-5-metil-1,2-oxazol,
5-*terc*-butil-7-(1H-imidazol-2-il)-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina,
7-(3-benciltriazol-4-il)-5-*terc*-butil-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidina,
3-[[5-*terc*-butil-7-(6-fluoropiridín-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]-4-metil-1,2,5-oxadiazol,
1-(3-bencil-5-*terc*-butiltriazolo[4,5-d]pirimidín-7-il)ciclobután-1-ol,

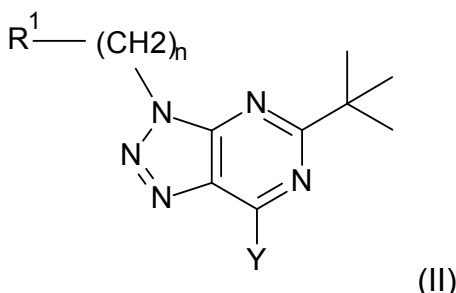
Resolución N° 42487

Ref. Expediente N° NC2017/0003004

3-bencil-5-*terc*-butil-7-(1-fluorociclobutil)triazolo[4,5-d]pirimidina,
1-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]ciclobután-1-ol,
1-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]ciclopentán-1-ol,
1-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]ciclohexán-1-ol,
1-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]cicloheptán-1-ol,
1-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]ciclooctán-1-ol,
3-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]pentán-3-ol,
3-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]tietán-3-ol,
1-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]-3-(difluorometil)ciclobután-1-ol,
1-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]-3-(difluorometil)ciclobután-1-ol,
3-[5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]-1-oxotietán-3-ol,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-[1-(fluorometil)ciclopropil]triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(ciclopenten-1-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-ciclopentil-triazolo[4,5-d]pirimidina y
3-bencil-5-*terc*-butil-7-ciclopentil-triazolo[4,5-d]pirimidina.

8. Compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, seleccionado de entre:
5-*terc*-butil-3-[(2-clorofenil)metil]-7-(6-fluoropiridín-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidina,
3-[[5-*terc*-butil-7-(2-metilpirazol-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]-4-metil-1,2,5-oxadiazol,
4-[5-*terc*-butil-3-[(1-metiltetrazol-5-il)metil]triazolo[4,5-d]pirimidín-7-il]-5-metil-1,2-oxazol,
3-[[5-*terc*-butil-7-(6-fluoropiridín-3-il)triazolo[4,5-d]pirimidín-3-il]metil]-4-metil-1,2,5-oxadiazol y
1-(3-bencil-5-*terc*-butiltriazolo[4,5-d]pirimidín-7-il)ciclobután-1-ol.

9. Procedimiento para la preparación de un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, que comprende una de las etapas siguientes:
(a) la reacción de un compuesto de fórmula (II):



en presencia de $B(OH)_2CR^2R^3R^4$ o $B(OR)_2CR^2R^3R^4$ en presencia de una base y un catalizador de paladio, en el que n y R^1 a R^4 son tal como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, Y es cloro o bromo y $B(OR)_2$ es 4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolanilo, en donde la base es Cs_2CO_3 y donde el catalizador de paladio es $Pd(PPh_3)_4$; o

(b) la reacción de un compuesto de fórmula (II) tal como se ha definido anteriormente en presencia de n-butil-litio seguido de la adición de $R^3C(O)R^4$, en el que R^3 y R^4 son tal como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6.

10. Compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, preparado siguiendo un procedimiento según la reivindicación 9.

Resolución N° 42487

Ref. Expediente N° NC2017/0003004

- 11.** Compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, como sustancia terapéuticamente activa.
- 12.** Composición farmacéutica que comprende un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y un portador terapéuticamente inerte.

