

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321

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 5 de abril de 2017, con el N° NC2017/0003321, por CORTEXIME, INC., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “INHIBIDORES DE GINGIPAINA DE LISINA”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2015/054050 del 5 de octubre de 2015.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 800 el 28 de julio de 2017, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 7723, notificado el 25 de junio 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° NC2017/0003321 el 17 de septiembre de 2018, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presenta nuevas reivindicaciones 1 a 22 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 22 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° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321

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:

“INHIBIDORES DE GINGIPAINA DE LISINA”

Clasificación IPC: C07C 233/62

Reivindicación(es): 1 a 22 incluida(s) en el radicado bajo el No NC2017/0003321 del 17 de septiembre de 2018, de acuerdo con el anexo 1.

Titular(es): CORTEXIME, INC.

Domicilio(s): 329 Oyster Point, Suite 300, South San Francisco, CA 94080, SOUTH SAN FRANCISCO CALIFORNIA ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA.

Inventor(es): Andrei KONRADI, Stephen S. DOMINY, Casey CRAWFORD LYNCH, Craig COBURN y Joseph VACCA

Prioridad(es) N° 06/10/2014, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/060,483

Solicitud internacional N°: PCT/US2015/054050 ***Fecha:*** 5 de octubre de 2015.

Vigente desde: 5 de octubre de 2015 ***Hasta:*** 5 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.



Resolución N° **42488**

Ref. Expediente N° NC2017/0003321

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a CORTEXIME, 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

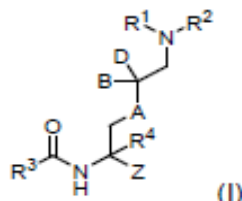
Dada en Bogotá D.C., el 4 de septiembre de 2019



ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto de acuerdo con la Formula I:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde

Z es un grupo seleccionado del grupo que consiste de benzotiazol-2-il-carbonilo, ariloximetil-carbonilo sustituido con halógeno, piridin-2-il-carbonilo y tiazol-2-il-carbonilo ;

A es -CH₂-;

B y D se seleccionan independientemente de hidrógeno y halógeno;

R¹ y R² son hidrógeno;

R³ se selecciona de arilo C₆₋₁₀, heteroarilo de 5 a 12 miembros, cicloalquilo C₃₋₈, heterociclilo saturado de 5 a 12 miembros y -L-R⁵, en donde

L se selecciona del grupo que consiste de -O-, -NR-, alquileo C₁₋₄, y heteroalquileo de 2 a 4 miembros, en donde R se selecciona de hidrógeno y alquilo C₁₋₈,

R⁵ se selecciona de arilo C₆₋₁₀, heteroarilo de 5 a 12 miembros, cicloalquilo C₃₋₈, y heterociclilo saturado de 5 a 12 miembros, y

y donde R³ no está sustituido, o R³ esta sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halo, -CN, -NO₂, -N₃, -OH, R^a, R^b, -OR^a, -OR^b, -(CH₂)_kC(O)R^c, -NR^d(CH₂)_uC(O)R^c, -O(CH₂)_uC(O)R^c, -(CH₂)_kCONR^dR^d, -(CH₂)_kNR^dC(O)R^c, -NR^d(CH₂)_uCONR^dR^d, -NR^d(CH₂)_uNR^dC(O)R^c, -O(CH₂)_uCONR^dR^d, -O(CH₂)_uNR^dC(O)R^c, -(CH₂)_kS(O)₂NR^dR^d, -(CH₂)_kNR^dS(O)₂R^c, -(CH₂)_kS(O)₂R^c, -(CH₂)_kS(O)R^c, -(CH₂)_kSR^d, -NR^d(CH₂)_uS(O)₂NR^dR^d, -NR^d(CH₂)_uNR^dS(O)₂R^c, -NR^d(CH₂)_uS(O)₂R^c, -NR^d(CH₂)_uS(O)R^c, -NR^d(CH₂)_uSR^d, -O(CH₂)_uS(O)₂NR^dR^d, -O(CH₂)_uNR^dS(O)₂R^c, -O(CH₂)_uS(O)₂R^c, -O(CH₂)_uS(O)R^c, y -O(CH₂)_uSR^c, donde:

cada R^a se selecciona independientemente de alquilo C₁₋₄ y haloalquilo C₁₋₄,

Resolución N° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321

cada R^b se selecciona independientemente de cicloalquilo C_{3-6} , halocicloalquilo C_{3-6} , arilo C_{6-10} , heteroarilo de 5 a 12 miembros, y heterociclilo saturado de 5 a 12 miembros,

cada R^c se selecciona independientemente de -OH, alquilo C_{1-8} , haloalquilo C_{1-8} , cicloalquilo C_{3-8} , halocicloalquilo C_{3-8} , arilo C_{6-10} , (arilo C_{6-10})-(alquilo C_{1-8}), heteroarilo de 5 a 12 miembros, y heterociclilo saturado de 5 a 12 miembros,

cada R^d se selecciona independientemente de hidrógeno y alquilo C_{1-8} ,

cada subíndice k se selecciona independientemente de 0, 1, 2, 3, 4, 5 y 6, y

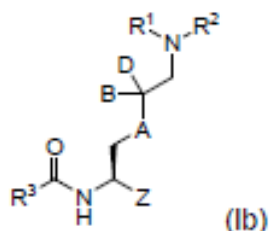
cada subíndice u se selecciona independientemente de 1, 2, 3, 4, 5 y 6; y

R^4 se selecciona de hidrógeno, y alquilo C_{1-4} ;

con la condición de que cuando Z es benzotiazol-2-il-carbonilo, y B, D, y R^1 son hidrógeno, entonces R^3 es distinto de benciloxi, benciloxi sustituido, o 1-(3-fenil-propanoil)piperidin-3-il, y

con la condición de que cuando Z es fenoximetil-carbonilo o fenoximetil-carbonilo sustituido, y B y D son hidrógeno, entonces R^3 es distinto de (2-fenil)etilo o (2-fenil)etilo sustituido.

2. El compuesto de la reivindicación 1 teniendo una estructura de acuerdo con la Fórmula Ib:



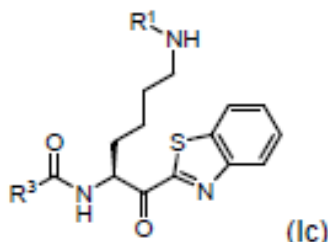
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

3. El compuesto de la reivindicación 1 o la reivindicación 2, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde R^3 se selecciona de ciclohexilo; 1-metilciclohexilo; 1-metoxiciclohexilo; ciclopentilo; morfolin-2-ilo; 4-acetilmorfolin-2-ilo; fenilo; 2-trifluorometilfenilo; 3-azidofenilo; piperidin-3-ilo; 1-acetil-piperidina-3-ilo; piridin-2-ilo; piridin-3-ilo; piridin-4-ilo; 6-oxo-1,6-dihidropiridin-2-ilo; tetrahidrofuran-2-ilo; tetrahydro-2H-piran-2-ilo; tetrahydro-2H-piran-3-ilo; tetrahydro-2H-piran-4-ilo; 1,2,3,4-tetrahidronaft-1-ilo; 1,2,3,4-tetrahidronaft-2-ilo; tiazol-5-ilo y tiazol-2-ilo.

Resolución N° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321

4. El compuesto de la reivindicación 1, que tiene una estructura según Formula Ic:

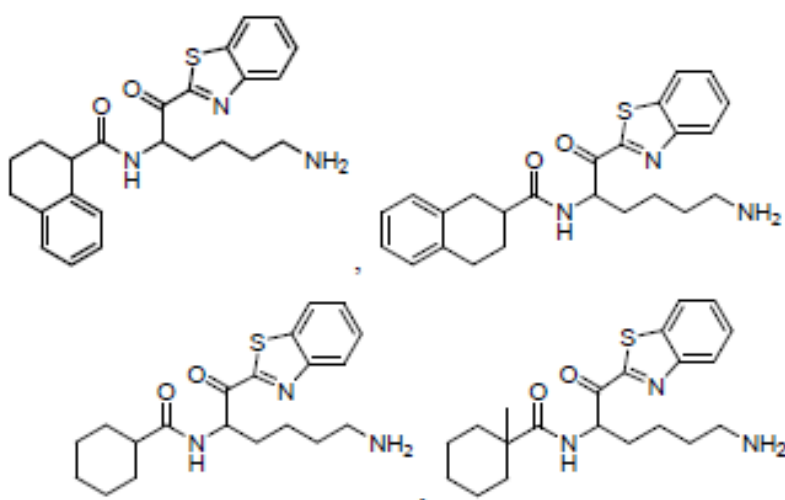


o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
donde R³ se selecciona del grupo que consiste en arilo C₆₋₁₀, heteroarilo de 5 a 12 miembros, cicloalquilo C₃₋₈, heterocicilo saturado de 5 a 12 miembros, y -L-R⁵,
donde L es alquileo C₁₋₄.

5. El compuesto de la reivindicación 4, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde

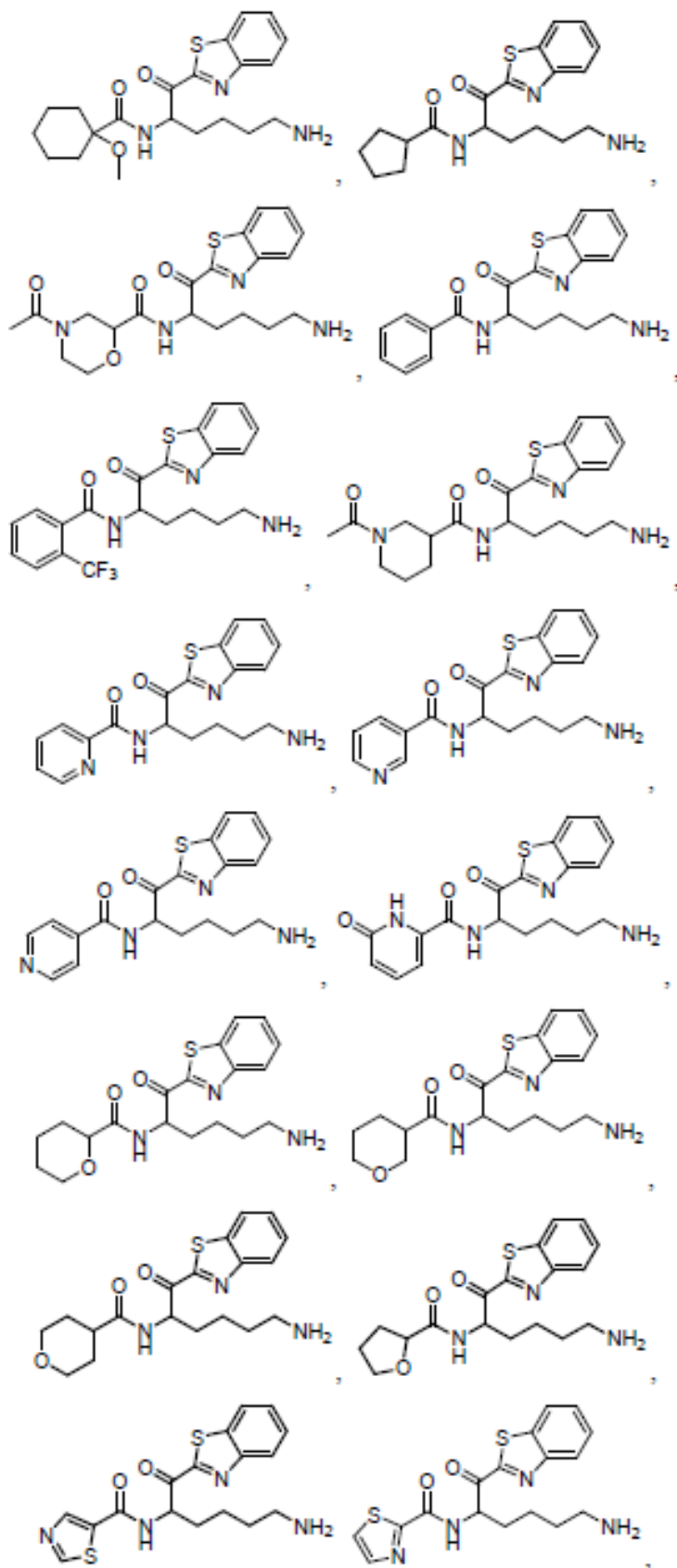
R³ se selecciona del grupo que consiste en ciclohexilo, ciclopentilo, morfolino, fenilo, piperidinilo, piridinilo, tetrahidrofurano, tetrahidropirano, 1,2,3,4-tetrahidronaftilo, y tiazolilo,
cada uno de los cuales no está sustituido, o cada uno de los cuales está sustituido con 1-3 miembros seleccionados del grupo que consiste en metilo, metoxi, trifluorometilo, acetilo, y -N₃.

6. El compuesto de la reivindicación 1, que se selecciona de entre el grupo que consiste en:



Resolución N° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321

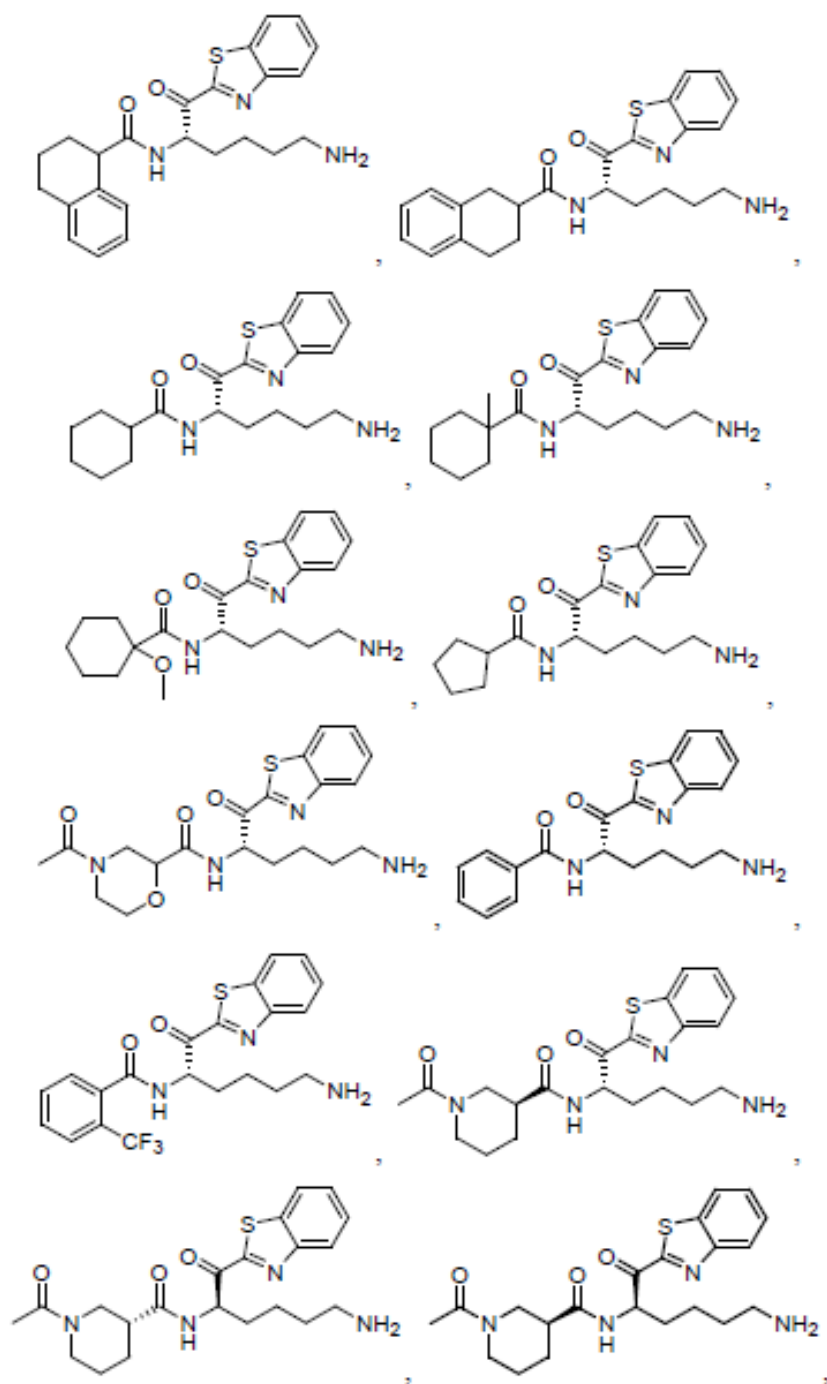


y sus sales farmacéuticamente aceptables.

Resolución N° 42488

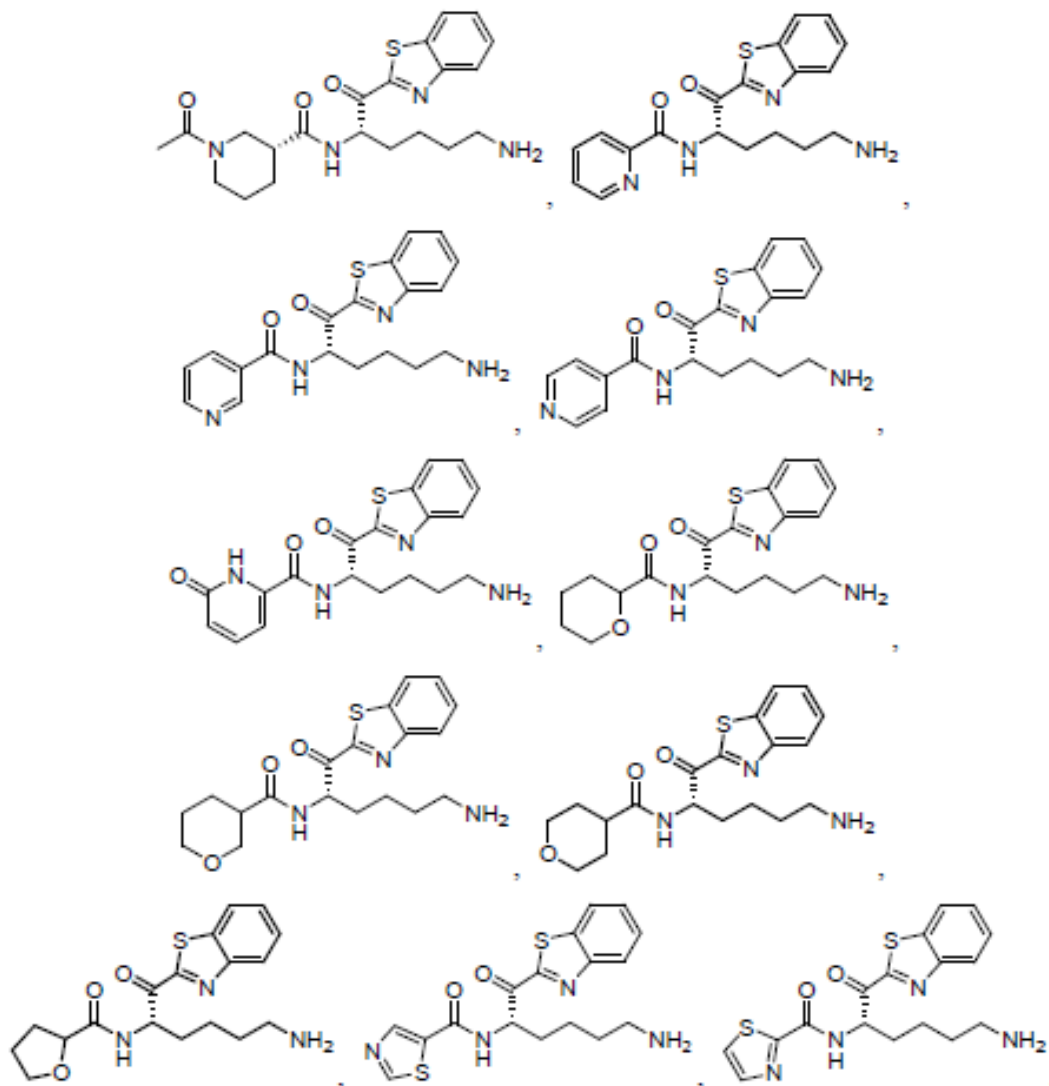
Ref. Expediente N° NC2017/0003321

7. El compuesto de la reivindicación 1, el cual se selecciona del grupo que consiste en:



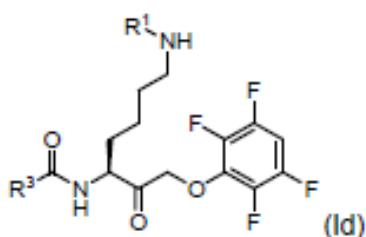
Resolución N° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321



y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

8. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que tiene una estructura según Formula Id:



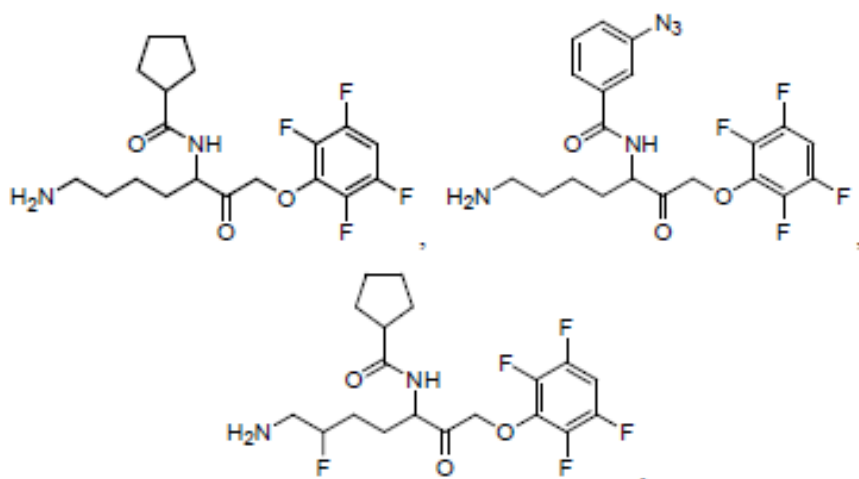
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,

Resolución N° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321

donde R^3 se selecciona del grupo que consiste en arilo C_{6-10} , heteroarilo de 5 a 12 miembros, cicloalquilo C_{3-8} , heterociclilo saturado de 5 a 12 miembros, y $-L-R^5$,
donde L es alquileo C_{1-4} .

9. El compuesto de la reivindicación 8, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde
 R^3 se selecciona del grupo que consiste en ciclohexil, ciclopentil morfolina, fenilo, piperidinilo, piridinilo, tetrahydrofuranilo, tetrahidropiranilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftanilo, y tiazolilo,
cada uno de los cuales no está sustituido, o cada uno de los cuales está sustituido con 1-3 miembros seleccionados del grupo que consiste en metilo, metoxi, trifluorometilo, acetilo, y $-N_3$.
10. El compuesto de la reivindicación 1, que se selecciona de entre el grupo que consiste en:



y sus sales farmacéuticamente aceptables.



Resolución N° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321

donde R^3 se selecciona del grupo que consiste en arilo C_{6-10} , heteroarilo de 5 a 12 miembros, cicloalquilo C_{3-8} , heterociclilo saturado de 5 a 12 miembros, y $-L-R^5$,

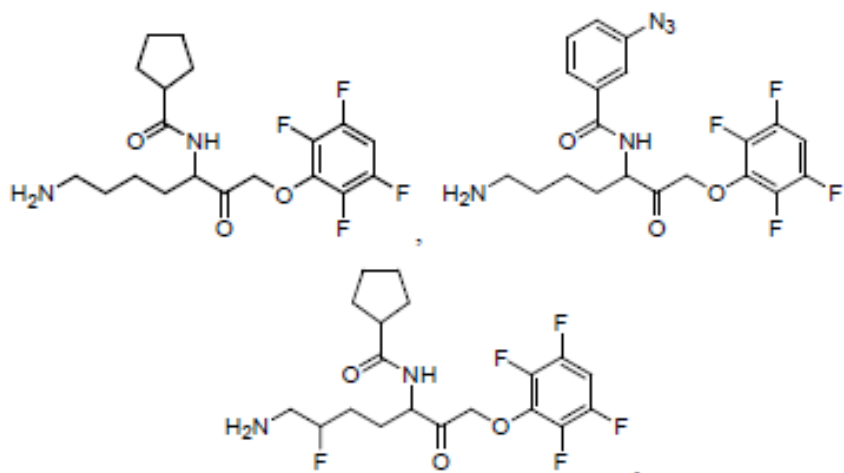
donde L es alquileo C_{1-4} .

9. El compuesto de la reivindicación 8, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde

R^3 se selecciona del grupo que consiste en ciclohexil, ciclopentil morfolina, fenilo, piperidinilo, piridinilo, tetrahydrofurano, tetrahidropirano, 1,2,3,4-tetrahidronaftano, y tiazolilo,

cada uno de los cuales no está sustituido, o cada uno de los cuales está sustituido con 1-3 miembros seleccionados del grupo que consiste en metilo, metoxi, trifluorometilo, acetilo, y $-N_3$.

10. El compuesto de la reivindicación 1, que se selecciona de entre el grupo que consiste en:

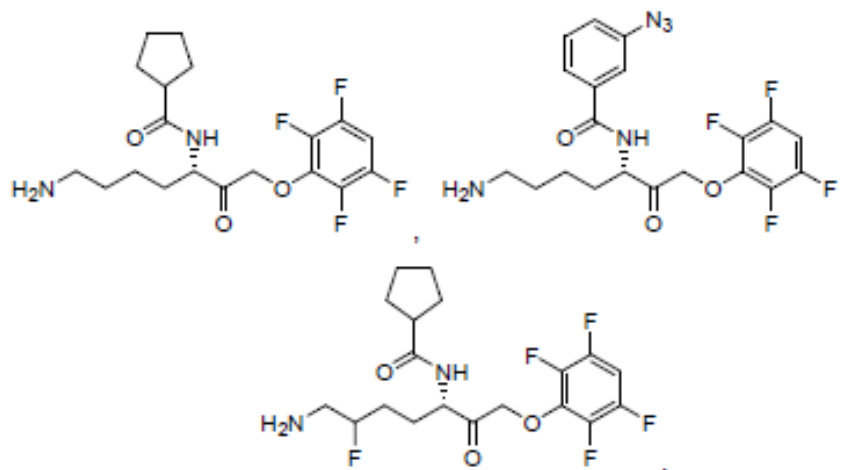


y sus sales farmacéuticamente aceptables.

Resolución N° 42488

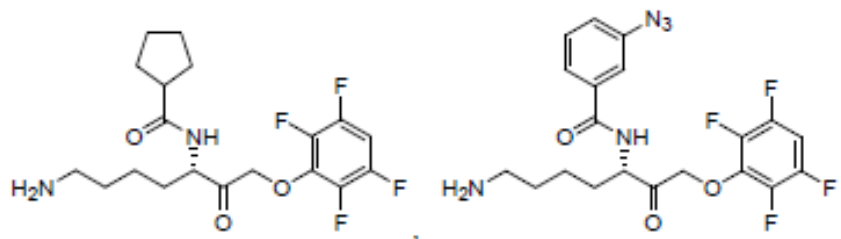
Ref. Expediente N° NC2017/0003321

11. El compuesto de la reivindicación 1, el cual se selecciona del grupo que consiste en:



y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

12. El compuesto de la reivindicación 8, el cual se selecciona del grupo que consiste en:



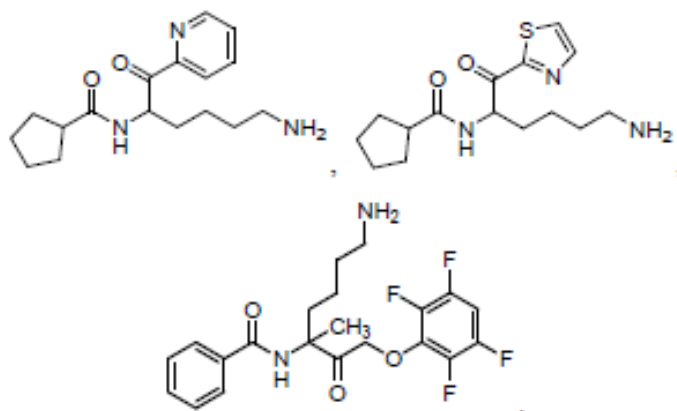
y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

13. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde
Z se selecciona del grupo que consiste en piridin-2-il-carbonilo y tiazol-2-il-carbonilo, y
R³ se selecciona del grupo que consiste en arilo C₆₋₁₀ y cicloalquilo C₃₋₈.

14. El compuesto de la reivindicación 1, que se selecciona de entre el grupo que consiste en:

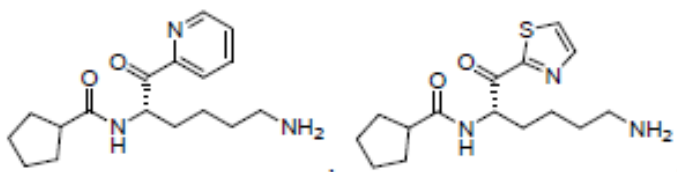
Resolución N° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321



y sus sales farmacéuticamente aceptables.

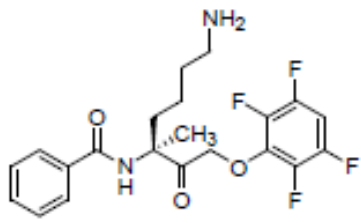
15. El compuesto de la reivindicación 13, el cual se selecciona del grupo que consiste en:



y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

16. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde R⁴ es alquilo C₁₋₄.

17. El compuesto de la reivindicación 16, el cual es



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

18. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde

B es hidrógeno;

D es hidrógeno o flúor;

Z es benzotiazol-2-il-carbonilo o ariloximetil-carbonilo sustituido con halógeno;

R¹ y R² son H;

Resolución N° 42488

Ref. Expediente N° NC2017/0003321

R³ se selecciona entre ciclohexilo, ciclopentilo, morfolino, fenilo, piperidinilo, piridinilo, tetrahidrofurano, tetrahidropirano, 1,2,3,4-tetrahidronaftilo y tiazolilo, cada uno de los cuales no está sustituido, o cada uno de los cuales está sustituido con 1-3 miembros seleccionados del grupo que consiste en metilo, metoxi, trifluorometilo, acetilo y -N₃; y
R⁴ es hidrógeno o metilo.

19. El compuesto de la reivindicación 18, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde R₄ es hidrógeno.
20. El compuesto de la reivindicación 18, o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, donde D y R₄ son hidrógeno.
21. El compuesto de la reivindicación 18, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde D y R₄ son hidrógeno, y en donde Z es (2,3,5,6-tetrafluorofenoxi) metil-carbonilo.
22. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21 y un excipiente farmacéuticamente aceptable.

