

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 220269

Ref. Expediente N° NC2017/0012622

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 7 de diciembre de 2017, con el N° NC2017/0012622, por BAYER PHARMA AKTIENGESSELLSCHAFT, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “MODULADORES ALOSTÉRICOS POSITIVOS DEL RECEPTOR MUSCARÍNICO M2”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2016/062737 del 6 de junio de 2016.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 822 el 28 de marzo de 2018, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 4243, notificado el 10 de junio de 2019, 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° NC2017/0012622 el 30 de agosto de 2019, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 9 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 9 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0012622 del 30 de agosto de 2019, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a un compuesto que difiere del estado de la técnica más cercano, EP1650192, en que los compuestos están sustituidos en la posición 6. Adicionalmente, esta diferencia no se encuentra sugerida en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto de tener actividad como modulador

Resolución N° **220269**

Ref. Expediente N° NC2017/0012622

alostérico positivo M2. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 9 cumplen los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial establecidos en la normatividad citada en precedencia y 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° NC2017/0012622 del 30 de agosto 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 3-(AMINOCARBONIL)-7-AMINO-1,8-NAFTIRIDIN-4-ONA COMO MODULADORES ALOSTÉRICOS POSITIVOS DEL RECEPTOR MUSCARÍNICO M2”.

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 3-(AMINOCARBONIL)-7-AMINO-1,8-NAFTIRIDIN-4-ONA COMO MODULADORES ALOSTÉRICOS POSITIVOS DEL RECEPTOR MUSCARÍNICO M2”

Clasificación IPC: C07D 471/04, A61K 31/4375, A61P 9/06, A61P 13/12.

Reivindicaciones: 1 a 9 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0012622 del 30 de agosto de 2019, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT.

Domicilio: Müllerstr. 178 13353 Berlin, Alemania.

Inventores: Hanna TINEL, Tobias MARQUARDT, Katrin NOWAK REPPPEL, Thomas MONDRITZKI, Henrik TELLER, Alexander STRAUB, Markus BRECHMANN, Mark MEININGHAUS, Klaus MÜNTER, Daniela FLIEGNER, Melissa BOULTADAKIS ARAPINIS, Alexandros VAKALOPOULOS, Anne-Sophie REBSTOCK, Matthias Beat WITTWER, Thomas MÜLLER.

Prioridades N°: 09/06/2015, EP, 15171127.2.
22/02/2016, EP, 16156676.5.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2016/062737. **Fecha:** 6 de junio de 2016.

Vigente desde: 6 de junio de 2016. **Hasta:** 6 de junio de 2036.

Resolución N° **220269**

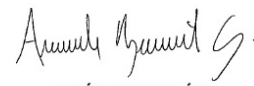
Ref. Expediente N° NC2017/0012622

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 BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT, 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 16 de octubre de 2019



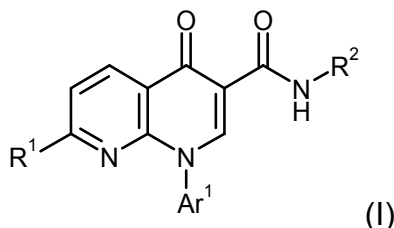
ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZALEZ
Fecha: 2019.10.16
17:03:42 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Compuesto de la fórmula (I),



donde

R¹ es NR⁴R⁵,

donde

R⁴ es hidrógeno, metilo, alquilo-(C₂-C₄) o cicloalquilo-(C₃-C₆),
donde alquilo-(C₂-C₄) puede estar sustituido por hidroxilo o hasta
trisustituido por flúor

y

R⁵ es alquilo-(C₁-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₆), heterociclilo saturado de 3 a 6
miembros o alquilsulfonilo-(C₁-C₄),
donde alquilo-(C₁-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₆) y heterociclilo saturado de 3 a
6 miembros pueden estar hasta trisustituidos, de forma idéntica o
diferente por metilo, difluorometilo, trifluorometilo, hidroxilo,
hidroxicarbonilo, oxo, metoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi y ciano y
adicionalmente hasta tetrasustituidos por flúor,

o

R⁴ y R⁵ junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un
heterociclo monocíclico de 3 a 6 miembros o bicíclico de 6 a 10
miembros, saturado o parcialmente insaturado, que puede contener uno
o dos heteroátomos idénticos o diferentes adicionales del grupo de N, O,
S, SO y/o SO₂ como miembros de anillo,
donde el heterociclo monocíclico de 3 a 6 miembros y bicíclico de 6 a 10
miembros puede estar sustituido cada uno por 1 a 5 sustituyentes
independientemente seleccionados del grupo de alquilo-(C₁-C₄),
difluorometilo, trifluorometilo, hidroxilo, hidroxicarbonilo, oxo, alcoxi-(C₁-
C₃), difluorometoxi, trifluorometoxi, ciano, alcoxi-(C₁-C₃)carbonilo,
aminocarbonilo, mono-(C₁-C₃)-alkilaminocarbonilo, -NHC(=O)R^{22A} y -
CH₂NHC(=O)R^{22B}, y adicionalmente hasta tetrasustituido por flúor,
donde

R^{22A} y R^{22B} representan independientemente alquilo-(C₁-C₃) o
ciclopropilo,

y

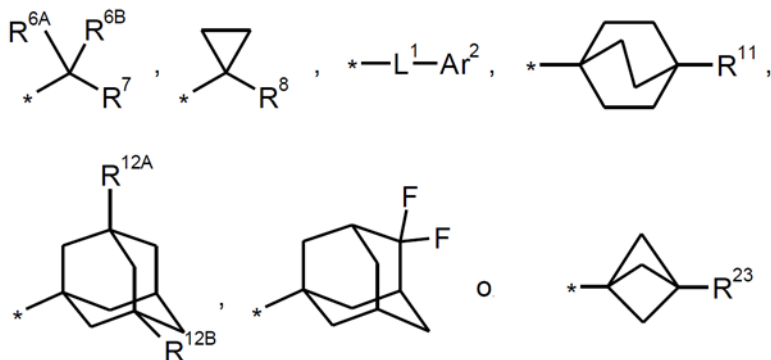


Resolución N° 220269

Ref. Expediente N° NC2017/0012622

donde alquilo-(C₁-C₄) puede estar mono o disustituido, de forma idéntica o diferente, por hidroxilo y alcoxi-(C₁-C₃) y hasta tetrasustituido por flúor,

R² es un grupo de la fórmula

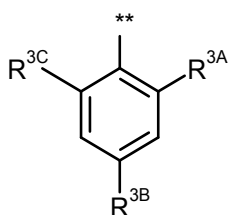


donde

- * marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno del resto amida,
- R^{6A} es hidrógeno o metilo,
- R^{6B} es metilo, etilo, ciclopropilo, trifluorometilo o trifluorometoximetilo,
- R⁷ es metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc-butilo, 2-metilprop-1-ilo, trifluorometilo, difluorometilo, pentafluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo o ciclopropilo,
- R⁸ es 2,2,2-trifluoroetilo,
- L¹ es un enlace o un grupo de la fórmula -CR^{9A}R^{9B}-,
donde
 - R^{9A} representa hidrógeno o metilo,
 - R^{9B} representa hidrógeno, metilo, trifluorometilo o trifluorometoximetilo,
- Ar² es fenilo,
que puede estar mono o disustituido, de forma idéntica o diferente, por flúor, cloro, metilo y/o trifluorometilo,
- R¹¹ es hidrógeno, flúor o metilo,
- R^{12A} es hidrógeno, flúor, metilo, etilo o trifluorometilo,
- R^{12B} es hidrógeno o flúor,
- R²³ es hidrógeno, flúor o trifluorometilo,

y

Ar¹ es un grupo de la fórmula



donde

- ** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

Resolución N° 220269

Ref. Expediente N° NC2017/0012622

R^{3A} es flúor, cloro o trifluorometilo,

R^{3B} es hidrógeno o flúor

y

R^{3C} es hidrógeno, flúor o cloro

y los N-óxidos, sales, solvatos, sales de los N-óxidos y solvatos de los N-óxidos o sales de los mismos.

2. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 1
donde

R¹ es NR⁴R⁵,

donde

R⁴ es hidrógeno o metilo,

y

R⁵ es alquilo-(C₁-C₄) o metilsulfonilo,

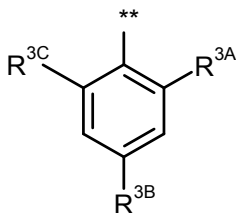
donde alquilo-(C₁-C₄) puede estar hasta disustituido por hidroxilo y adicionalmente hasta trisustituido por flúor,

o

R⁴ y R⁵ junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un heterociclo monocíclico de 4 a 6 miembros o bicíclico de 6 a 10 miembros, saturado o parcialmente insaturado, que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales del grupo de N, O, S, SO y SO₂ como miembro de anillo,
donde el heterociclo monocíclico de 4 a 6 miembros y bicíclico de 6 a 10 miembros puede cada uno estar sustituido por 1 a 5 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo de alquilo-(C₁-C₃), difluorometilo, trifluorometilo, hidroximetilo, hidroxietilo, hidroxilo, oxo, metoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, metoximetilo, ciano, metoxicarbonilo, aminocarbonilo y monometilaminocarbonilo, y adicionalmente hasta tetrasustituido por flúor,

y

Ar¹ es un grupo de la fórmula



donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

R^{3A} es flúor, cloro o trifluorometilo,

R^{3B} es hidrógeno o flúor

y

R^{3C} es hidrógeno, flúor o cloro



Resolución N° 220269

Ref. Expediente N° NC2017/0012622

y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

3. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 1 o 2 donde

R^1 es NR^4R^5 ,

donde

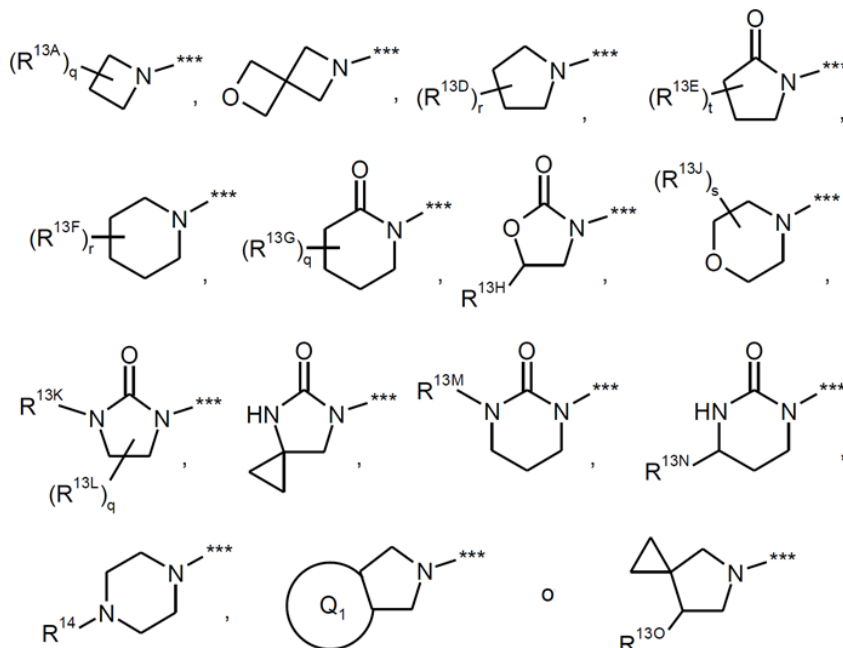
R^4 es hidrógeno o metilo,

y

R^5 es metilo, isopropilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-hidroxietilo o 2-hidroxipropilo,

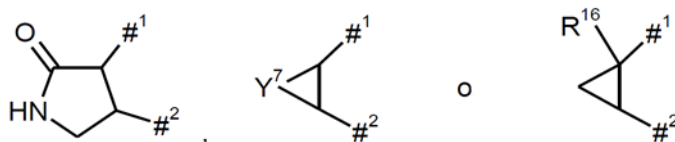
o

es un heterociclo monocíclico de 4 a 6 miembros o bicíclico de 6 a 8 miembros que se une a través de un átomo de nitrógeno y es de la fórmula



donde

*** marca el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de piridina, el anillo Q_1 es un grupo de la fórmula



donde

$\#1$ y $\#2$ marcan el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de pirrolidina,

y

Y^7 es $-CF_2-$ o $-CHR^{15}-$,

donde

R^{15} representa metoximetilo,

y

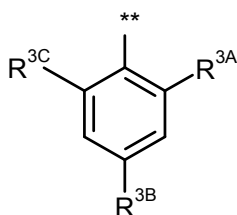
Resolución N° 220269

Ref. Expediente N° NC2017/0012622

R¹⁶ es hidroxilo,
 R^{13A} es flúor, hidroxilo, hidroximetilo, metilo, trifluorometilo o metoxi,
 R^{13D} es hidrógeno, flúor, metilo, hidroxilo, hidroximetilo, metoxi o difluorometoxi,
 R^{13E} es hidrógeno, flúor, metilo, hidroxilo, hidroximetilo o metoxi,
 R^{13F} es flúor, metilo, hidroxilo, hidroximetilo o ciano,
 R^{13G} es flúor o hidroxilo,
 R^{13H} es hidrógeno, metilo, hidroximetilo, aminocarbonilo o metoxycarbonilo,
 R^{13J} es oxo, hidroximetilo o difluorometilo,
 R^{13K} es hidrógeno, metilo o 2-hidroxietilo,
 R^{13L} es hidrógeno o metilo,
 R^{13M} es etilo, 2-hidroxietilo o ciano,
 R^{13N} es hidrógeno o etilo,
 R^{13O} es hidrógeno o hidroxilo,
 R¹⁴ es metilo, metoxycarbonilo o aminocarbonilo,
 q es el número 0, 1 o 2,
 r es el número 0, 1, 2 o 3,
 s es el número 0 o 1,
 t es el número 0, 1, 2, 3 o 4,
 donde en el caso que los sustituyentes R^{13A}, R^{13D}, R^{13E}, R^{13F}, R^{13G}, R^{13J} y R^{13L} ocurran más de una vez, las definiciones de los mismos pueden cada una ser las mismas o diferentes,

y

Ar¹ es un grupo de la fórmula



donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

R^{3A} es flúor o cloro,

R^{3B} es hidrógeno o flúor,

y

R^{3C} es hidrógeno, flúor o cloro

y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

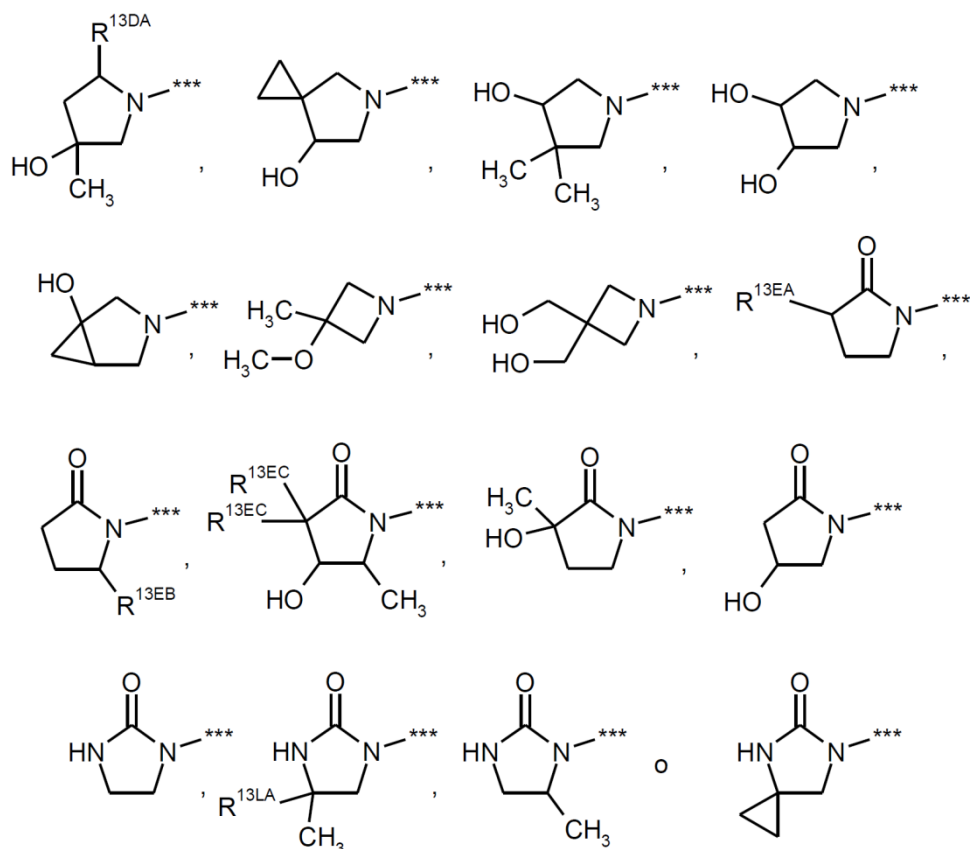
4. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3

donde

R¹ es un grupo de la fórmula

Resolución N° 220269

Ref. Expediente N° NC2017/0012622



donde

*** marca el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de piridina,

R^{13DA} es hidrógeno o metilo,

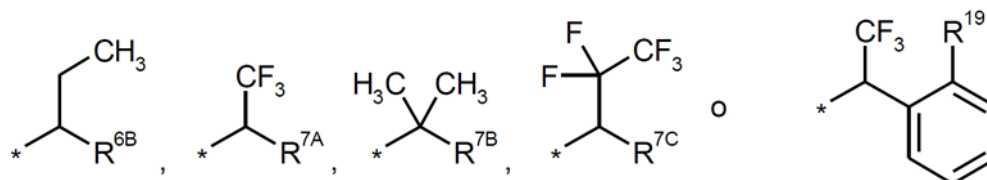
R^{13EA} es hidroxilo o hidroximetilo,

R^{13EB} es metilo o hidroximetilo,

R^{13EC} es hidrógeno o metilo,

R^{13LA} es hidrógeno o metilo,

R² es un grupo de la fórmula



donde

* marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno del resto amida,

R^{6B} es trifluorometoximetilo,

R^{7A} es metilo, etilo, trifluorometilo o ciclopropilo,

R^{7B} es trifluorometilo, difluorometilo o 2,2,2-trifluoroetilo,

R^{7C} es metilo o etilo,

R¹⁹ es cloro,

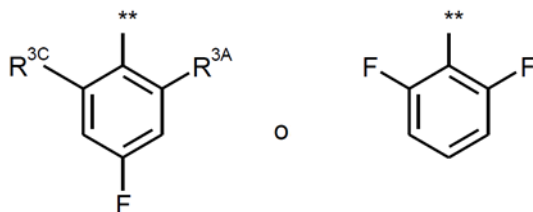
y

Ar¹ es un grupo de la fórmula



Resolución N° 220269

Ref. Expediente N° NC2017/0012622



donde

** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,

R^{3A} es flúor o cloro, y

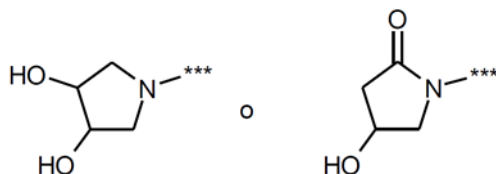
R^{3C} es hidrógeno o flúor,

y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

5. Compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4

donde

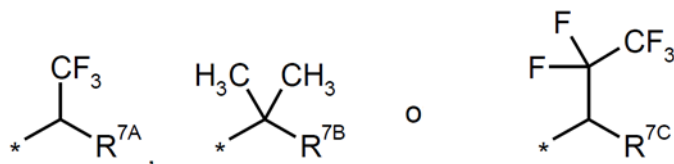
R¹ es un grupo de la fórmula



donde

*** marca el sitio de enlace al átomo de carbono del anillo de piridina,

R² es un grupo de la fórmula



donde

* marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno del resto amida,

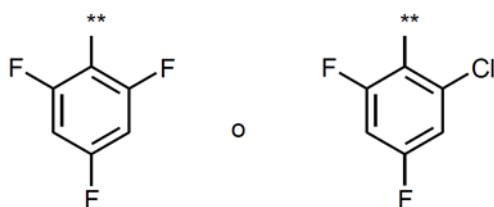
R^{7A} es etilo, trifluorometilo o ciclopropilo,

R^{7B} es trifluorometilo,

R^{7C} es metilo o etilo,

y

Ar¹ es un grupo de la fórmula



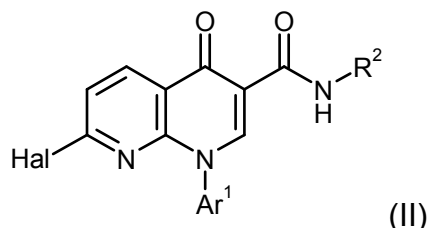
Resolución N° 220269

Ref. Expediente N° NC2017/0012622

donde

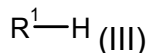
** marca el sitio de enlace al átomo de nitrógeno,
y las sales, solvatos y solvatos de las sales de los mismos.

6. Proceso para preparar los compuestos de la fórmula (I) tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5, caracterizado por que
[A] un compuesto de la fórmula (II)

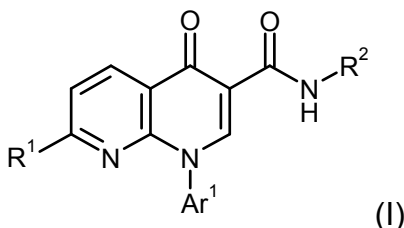


donde R² y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente
y

Hal es flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente cloro,
se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula (III)



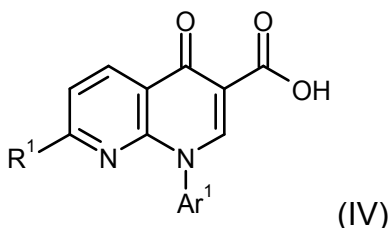
donde R¹ tiene la definición provista anteriormente
para proporcionar la carboxamida de la fórmula (I)



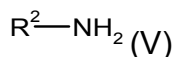
donde R¹, R² y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente,

o

- [B] un compuesto de la fórmula (IV)



donde R¹ y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente
se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula (V)

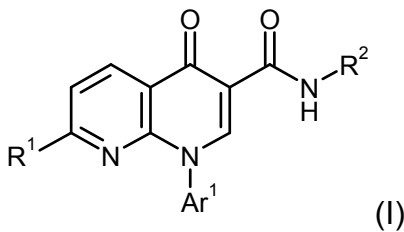


donde R² tiene la definición provista anteriormente
para proporcionar la carboxamida de la invención de la fórmula (I)



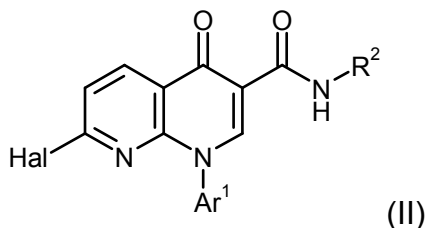
Resolución N° **220269**

Ref. Expediente N° NC2017/0012622



donde R¹, R² y Ar¹ tienen las definiciones provistas anteriormente.

7. Compuesto de la fórmula (II),

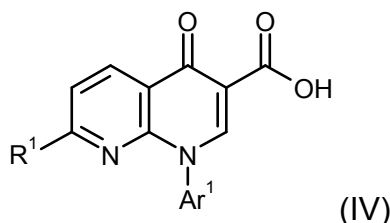


donde R² y Ar¹ tienen las definiciones que se proporcionan anteriormente para los compuestos de la fórmula (I)

y

Hal es flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente cloro.

8. Compuesto de la fórmula (IV)



donde R¹ y Ar¹ tienen las definiciones que se proporcionan anteriormente para los compuestos de la fórmula (I).

9. Medicamento que comprende un compuesto tal como se define en cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5 en combinación con un excipiente inerte, no tóxico, farmacéuticamente adecuado.

