

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 60304

Ref. Expediente N° NC2018/0002472

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 6 de marzo de 2018, con el N° NC2018/0002472, por ASTELLAS PHARMA INC., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “COMPUESTO DE TETRAHIDROOXEPINOPIRIDINA”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/JP2016/074145 del 18 de agosto de 2016.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 828 el 31 de mayo de 201, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 1956, notificado el 3 de mayo 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° NC2018/0002472 el 30 de julio de 2019, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 15 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 15 incluidas en el radicado bajo el N° NC2018/0002472 del 30 de julio de 2019, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren compuestos derivados de tetrahidrooxepinopiridina moduladores del receptor de acetilcolina nicotínico $\alpha 7$, que difiere del estado de la técnica más cercano, WO2010020672, en que divulga específicamente compuestos donde un hidrooxepino está unido a la piridina. Adicionalmente, esta diferencia no se encuentra sugerida en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto de tener un compuesto alternativo que module el receptor de acetilcolina nicotínico $\alpha 7$. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.



Resolución N° 60304

Ref. Expediente N° NC2018/0002472

En consecuencia, las reivindicaciones 1 - 15 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 el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2018/0002472 el 06 de marzo de 2018, tituló la invención como: “COMPUESTO DE TETRAHIDROOXEPINOPIRIDINA”. Sin embargo, no se acepta porque este título no se relaciona en su totalidad con el objeto de la solicitud contenido en la descripción, y de acuerdo con el objeto concedido, el título de la invención quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS DE TETRAHIDROOXEPINOPIRIDINA COMO MODULADORES DE RECEPTORES DE ACETILCOLINA NICOTINICO $\alpha 7$ ”.

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 DE TETRAHIDROOXEPINOPIRIDINA COMO MODULADORES DE RECEPTORES DE ACETILCOLINA NICOTINICO $\alpha 7$ ”

Clasificación IPC: C07D 491/044, A61K 31/501, A61K 31/5377, A61P 25/04, A61P 25/18, A61P 25/28, A61P 29/00

Reivindicaciones: 1 a 15 incluidas en el radicado bajo el No NC2018/0002472 el 30 de julio de 2019, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: ASTELLAS PHARMA INC.

Domicilio: 5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-ku, TOKIO 103-8411, KANTO JAPON.

Inventores: Shimpei KAWAKAMI, Shigeki KUNIKAWA, Yohei KOGANEMARU, Satoshi MIYAMOTO, Shinya NAGASHIMA, Akio KAMIKAWA, Koichi YONEZAWA, Yuka KOIZUMI, Satoshi AOKI, Takashi OGIYAMA, Ryo SATO, Junichi SHISHIKURA, Shuichirou KAKIMOTO, Hiroshi YAMADA, Keisuke TAMAKI

Prioridad N° 19/08/2015, JP (JAPON), 2015-162320

Solicitud internacional N°: PCT/JP2016/074145 **Fecha:** 18 de agosto de 2016.

Vigente desde: 18 de agosto de 2016 **Hasta:** 18 de agosto 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.



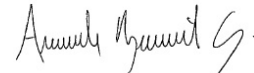
Resolución N° **60304**

Ref. Expediente N° NC2018/0002472

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a ASTELLAS PHARMA 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 5 de noviembre de 2019



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZALEZ
Fecha: 2019.11.15
18:51:27 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

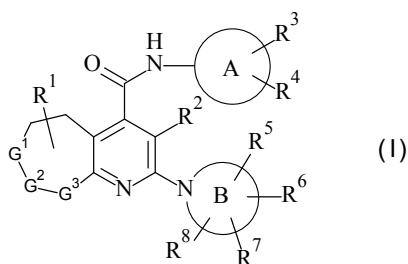
Resolución N° 60304

Ref. Expediente N° NC2018/0002472

ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto de la fórmula (I) o una de sus sales:



en la fórmula,

R¹ es H o alquilo inferior,

R² es H o CN,

cualquiera de G¹, G² y G³ es O, y los otros dos de G¹, G² y G³ son CH₂,

el anillo A es arilo C₆₋₁₀, o heteroarilo de 6 miembros que contiene nitrógeno,

el anillo B es amino cíclico,

R³ y R⁴ son iguales o diferentes entre sí, y son H, halógeno, alquilo inferior, –alquileo inferior–OH, halo–alquilo inferior, –O–alquilo inferior, –O–halo–alquilo inferior, cicloalquilo, CN, OH, –N(alquilo inferior)₂, o –C(=O)NH₂,

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son iguales o diferentes entre sí, y son H, halógeno, alquilo inferior, halo–alquilo inferior, –O–alquilo inferior, o CN, o

en el caso donde R⁵ y R⁶ están enlazados al mismo átomo de carbono, R⁵ y R⁶ pueden formar cicloalcano C₃₋₇ o éter cíclico C₃₋₈ junto con el átomo de carbono, y pueden formar un anillo espiro junto con el anillo B, o el anillo B puede formar 6,7–dihidro[1,3]oxazolo[4,5–c]piridin–5(4H)–ilo junto con R⁵ y R⁶.

2. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 1, donde:

R¹ es H,

R² es H,

G¹ es O,

G² y G³ son CH₂,

el anillo A es fenilo, o heteroarilo de 6 miembros que contiene nitrógeno,

el anillo B es amino cíclico de 5 o 6 miembros, y

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son iguales o diferentes entre sí, y son H, halógeno, alquilo inferior, halo–alquilo inferior, –O–alquilo inferior, o CN.

3. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 2, donde:

el anillo A es heteroarilo monocíclico de 6 miembros que contiene nitrógeno,

R³ es H o alquilo inferior, y

R⁴ es H, halógeno, alquilo inferior, –alquileo inferior–OH, halo–alquilo inferior, –O–alquilo inferior, –O–halo–alquilo inferior, cicloalquilo, CN, OH, –N(alquilo inferior)₂, o –C(=O)NH₂.

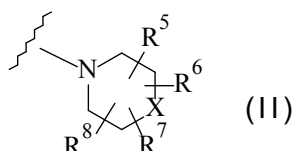
4. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 3, donde:



Resolución N° 60304

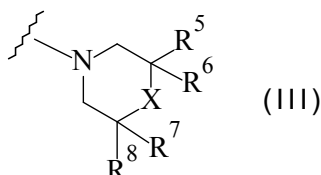
Ref. Expediente N° NC2018/0002472

el anillo B y R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son la fórmula (II):



X es CH₂, O, o un enlace,
en el caso donde X es CH₂, R⁵ y R⁶ pueden estar sustituidos con X, y
R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son iguales o diferentes entre sí, y son H, halógeno, alquilo inferior, o halo-
alquilo inferior.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde X es CH₂ u O.
6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, donde X es un enlace.
7. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 5, donde el anillo A es heteroarilo de 6 miembros que contiene nitrógeno que tiene uno o dos átomos de nitrógeno como átomos de anillo, el anillo B, y R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son la fórmula (III):

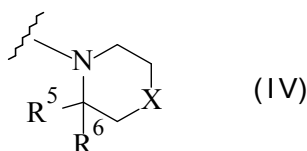


R⁵ es Halógeno o alquilo inferior,
R⁶ es H,
R⁷ es H, y
R⁸ es H o alquilo inferior.

8. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 7, donde:
el anillo A es piridilo,
X es CH₂,
R⁵ es halógeno, y
R⁸ es H.

9. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 7, donde:
el anillo A es piridilo,
X es O,
R⁵ es alquilo inferior, y
R⁸ es alquilo inferior.

10. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 6, donde:
el anillo A es heteroarilo de 6 miembros que contiene nitrógeno que tiene dos átomos de nitrógeno como átomos de anillo,
el anillo B y R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ son la fórmula (IV):



Resolución N° 60304

Ref. Expediente N° NC2018/0002472

R⁵ es halógeno o alquilo inferior,
R⁶ es H,
R⁷ es H, y
R⁸ es H.

11. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 1, que se selecciona del grupo que consiste en:

N-(5-cloropiridin-2-il)-2-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino [4,5-b]piridina-4-carboxamida,

N-(6-metoxipiridazin-3-il)-2-[(2R)-2-metilpirrolidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

N-(6-metilpirazin-2-il)-2-[(2S)-2-metilpirrolidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

2-[(2R)-2-etilmorfolin-4-il]-N-(6-metilpiridin-3-il)-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

2-(4-fluorpiriperidin-1-il)-N-(piridazin-3-il)-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

N-(5,6-dimetilpirazin-2-il)-2-[(2S)-2-metilpirrolidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino [4,5-b]piridina-4-carboxamida,

2-[(2S)-2-metilpiperidin-1-il]-N-(piridazin-3-il)-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida,

2-[(2S)-2-metilpiperidin-1-il]-N-(pirazin-2-il)-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida, y

N-(5-cloropiridin-2-il)-2-[(3S)-3-fluorpiriperidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida.

12. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 11, que es N-(5-cloropiridin-2-il)-2-[(2R,6S)-2,6-dimetilmorfolin-4-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino [4,5-b]piridina-4-carboxamida o una de sus sales.

13. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 11, que es N-(6-metoxipiridazin-3-il)-2-[(2R)-2-metilpirrolidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida o una de sus sales.

14. El compuesto o una de sus sales de acuerdo con la reivindicación 11, que es N-(5-cloropiridin-2-il)-2-[(3S)-3-fluorpiriperidin-1-il]-5,6,8,9-tetrahidrooxepino[4,5-b]piridina-4-carboxamida fosfato.

15. Una composición farmacéutica que comprende el compuesto o su sal de acuerdo con la reivindicación 1, y un excipiente farmacéuticamente aceptable.