

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 71563

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

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 8 de junio de 2018, con el N° NC2018/0005905, por BAYER PHARMA AKTIENGESSELLSCHAFT, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “DERIVADOS DE 2-FENIL-3-(PIPERAZINOMETIL)IMIDAZO[1,2-A]PIRIDINA COMO BLOQUEADORES DE LOS CANALES TASK-1 Y TASK-2 PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS RESPIRATORIOS RELACIONADOS CON EL SUEÑO”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2016/079973 del 7 de diciembre de 2016.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 832 el 10 de julio de 2018, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 9170, notificado el 30 de agosto 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° NC2018/0005905 el 26 de noviembre de 2019, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 7 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: Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 7 incluidas en el radicado bajo el N° NC2018/0005905 el 26 de noviembre de 2019, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a compuestos derivados de 2-fenil-3-(piperazinometil)imidazo[1,2 - a]piridina, que difieren del estado de la técnica más cercano, WO2013037914, en la ubicación de los nitrógenos en el anillo central y en las posibles sustituciones de la piperazina. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto como bloqueadores selectivos de los canales TASK-1 y TASK-3 para el tratamiento de trastornos respiratorios relacionados con el sueño, tales como apnea del sueño y ronquidos. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

Resolución N° 71563

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 7 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° NC2018/0005905 el 26 de noviembre 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 2-FENIL-3-(PIPERAZINOMETIL)IMIDAZO[1,2-A]PIRIDINA COMO BLOQUEADORES DE LOS CANALES TASK-1 Y TASK-2, ADECUADOS CONTRA TRASTORNOS RESPIRATORIOS RELACIONADOS CON EL SUEÑO, PROCESO PARA SU PREPARACIÓN Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS COMPRENDEN”.

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:

“DERIVADOS DE 2-FENIL-3-(PIPERAZINOMETIL)IMIDAZO[1,2-A]PIRIDINA COMO BLOQUEADORES DE LOS CANALES TASK-1 Y TASK-2, ADECUADOS CONTRA TRASTORNOS RESPIRATORIOS RELACIONADOS CON EL SUEÑO, PROCESO PARA SU PREPARACIÓN Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS COMPRENDEN”

Clasificación IPC: C07D 471/04, A61K 31/437, A61P 11/00.

Reivindicación(es): 1 a 7 incluidas en el radicado bajo el N° NC2018/0005905 el 26 de noviembre de 2019, de acuerdo con el Anexo 1.

Titular(es): BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT.

Domicilio(s): MÜLLERSTR. 178 13353, BERLIN, ALEMANIA.

Inventor(es): Klemens LUSTIG, Martina DELBECK, Michael HAHN, Thomas MÜLLER, Heinrich MEIER, Johanna MOSIG, Luisella TOSCHI, Udo ALBUS, Doris GEHRING y Björn ROSENSTEIN.

Prioridad(es) N° 10/12/2015, EP 15199270.8.
02/11/2016, EP 16196836.7.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2016/079973. **Fecha:** 7 de diciembre de 2016.

Vigente desde: 7 de diciembre de 2016.

Hasta: 7 de diciembre 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.

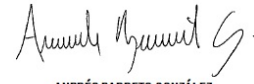
Resolución N° **71563**

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

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 9 de diciembre de 2019



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZÁLEZ
Fecha: 2019.12.09
12:04:03 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.



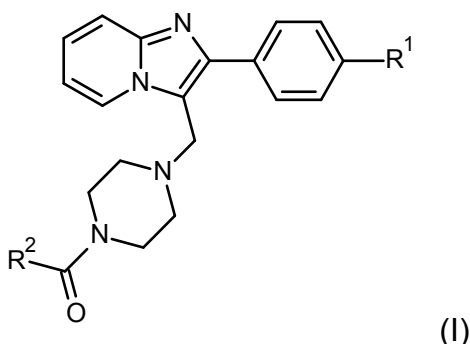
Resolución N° 71563

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Compuesto de la fórmula (I),



donde

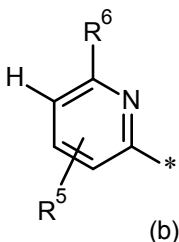
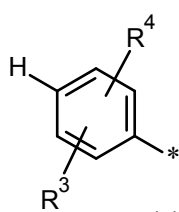
R¹ representa halógeno, ciano, alquilo-(C₁-C₄), ciclopropilo o ciclobutilo

y

R² representa cicloalquilo-(C₄-C₆) en el cual un grupo de anillo CH₂ puede remplazarse por -O-

o

representa un grupo fenilo de la fórmula (a) o un grupo piridilo de la fórmula (b)



en el cual * marca el enlace al grupo carbonilo adyacente y

R³ representa flúor, cloro, bromo, ciano, alquilo-(C₁-C₃) o alcoxi-(C₁-C₃), donde alquilo-(C₁-C₃) y alcoxi-(C₁-C₃) pueden estar sustituidos hasta tres veces por flúor,

R⁴ representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo o metilo,

R⁵ representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo o metilo

y

R⁶ representa hidrógeno, alcoxi-(C₁-C₃), ciclobutiloxi, oxetan-3-iloxi, tetrahidrofuran-3-iloxi o tetrahydro-2H-piran-4-iloxi, donde alcoxi-(C₁-C₃) puede estar sustituido hasta tres veces por flúor,

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

2. Un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, donde

R¹ representa flúor, cloro, bromo, metilo, isopropilo, *terc*-butilo o ciclopropilo

y

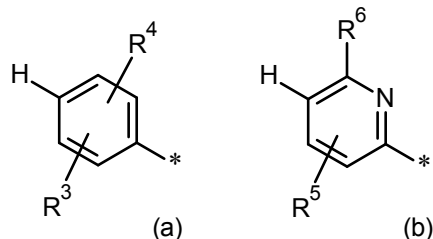
R² representa ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo

o

representa un grupo fenilo de la fórmula (a) o un grupo piridilo de la fórmula (b)

Resolución N° 71563

Ref. Expediente N° NC2018/0005905



en el cual * marca el enlace al grupo carbonilo adyacente y

R³ representa flúor, cloro, ciano, alquilo-(C₁-C₃), alcoxi-(C₁-C₃), o trifluorometoxi,

R⁴ representa hidrógeno, flúor o cloro,

R⁵ representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo o metilo

y

R⁶ representa hidrógeno o alcoxi-(C₁-C₃) que puede estar sustituido hasta tres veces por flúor,

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

3. Un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, donde

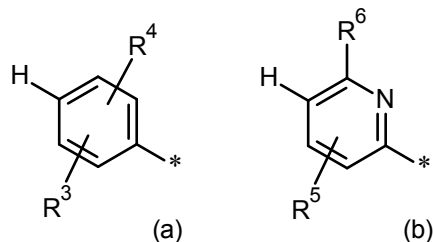
R¹ representa cloro, bromo, isopropilo o ciclopropilo

y

R² representa ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo

o

representa un grupo fenilo de la fórmula (a) o un grupo piridilo de la fórmula (b)



en el cual * marca el enlace al grupo carbonilo adyacente y

R³ representa flúor, cloro, ciano, metilo, isopropilo, metoxi o etoxi,

R⁴ representa hidrógeno, flúor o cloro,

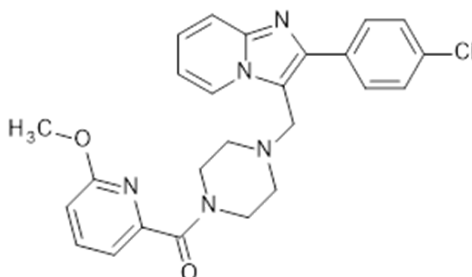
R⁵ representa hidrógeno, cloro o bromo

y

R⁶ representa metoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi o isopropoxi,

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

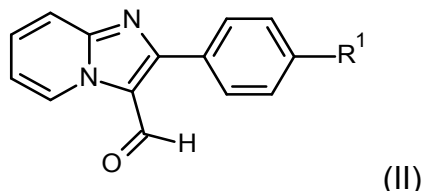
4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, que es (4-{[2-(4-clorofenil)imidazo[1,2-a]piridin-3-il]metil}piperazin-1-il)(6-metoxipiridin-2-il)metanona de fórmula (I-a)



Resolución N° 71563

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

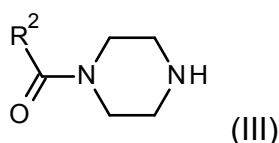
5. Proceso para preparar un compuesto de la fórmula (I) tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque un compuesto de fórmula (II)



donde R¹ tiene el significado que se proporciona en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,

se hace reaccionar en presencia de un agente de reducción que es un borohidruro de metal alcalino, ya sea

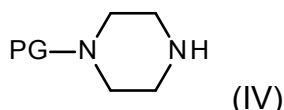
[A] con un compuesto de la fórmula (III)



donde R² tiene el significado provisto en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3

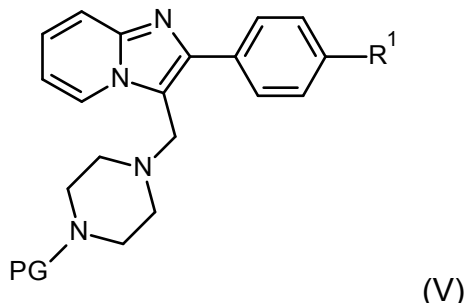
o

[B] con un derivado de piperazina protegida de la fórmula (IV)

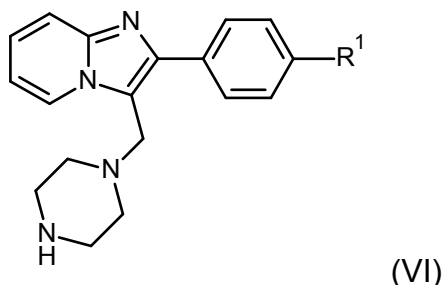


donde PG representa un grupo amino protector seleccionado del grupo que consiste en *tert*-butoxicarbonilo (Boc), benciloxycarbonilo (Z) y (9*H*-fluoren-9-ilmetoxy)carbonilo (Fmoc),

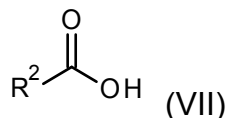
para proporcionar inicialmente un compuesto de fórmula (V)



donde PG y R¹ tienen los significados provistos anteriormente, el grupo protector PG se retira posteriormente y el compuesto resultante de la fórmula (VI)



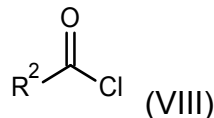
donde R¹ tiene el significado provisto anteriormente, se hace reaccionar posteriormente con un ácido carboxílico de la fórmula (VII)



Resolución N° 71563

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

donde R² tiene el significado provisto en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,
con activación de la función del ácido carboxílico en (VII) o se hace reaccionar con el cloruro de ácido correspondiente de la fórmula (VIII)



donde R² tiene el significado provisto en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,

y los compuestos resultantes de la fórmula (I) se convierten opcionalmente en sus solvatos, sales y/o solvatos de las sales.

6. Composición farmacéutica que comprende un compuesto tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en combinación con uno o más excipientes inertes, no tóxicos, farmacéuticamente adecuados.
7. Medicamento que comprende un compuesto tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en combinación con uno o más compuestos activos adicionales seleccionados del grupo formado por teofilina, doxapram, nicetamida o cafeína como estimulantes respiratorios; modafinil o armodafinil como compuestos psicoestimulantes, fluoxetina, paroxetina, citalopram, escitalopram, sertralina, fluvoxamina o trazodona como inhibidores de la reabsorción de serotonina; mirtazapina, amitriptilina, protriptilina, doxepina, trimipramina, imipramina, clomipramina o desipramina como, antidepresivos noradrenérgicos, serotoninérgicos y tricíclicos; estimulantes de sGC; antagonistas de receptores mineralcorticoides, fármacos antiinflamatorios; agentes inmunomoduladores; agentes inmunosupresores; y fumarato de dimetilo, fingolimod, acetato de glatiramer, β-interferones, natalizumab, teriflunomida, mitoxantrona, inmunoglobulinas, acetilcisteína, montelukast, tielukast, azatioprina, ciclofosfamida, hidroxycarbamida, azitromicina, interferon-γ, pirfenidona o etanercept como fármacos citotóxicos.

