

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 40656

Ref. Expediente N° NC2019/0001995

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 febrero de 2019, con el N° NC2019/0001995, por NOVARTIS AG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "INHIBIDORES DE BETA-LACTAMASA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/IB2017/055973 del 28 de septiembre de 2017.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 854 el 8 de marzo de 2019, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 2415, notificado el 18 de febrero de 2020, 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° NC2019/0001995 el 12 de mayo de 2020, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 16 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 16 incluidas en el radicado bajo el N° NC2019/0001995 el 12 de mayo de 2020, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a un compuesto inhibidor de beta lactamasa de formula (A), que difiere del estado de la técnica más cercano, WO2009091856, la presencia de un enlace carbonilo entre el anillo N y el biciclo [3.2.1] diazabiciclooctano. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto de inhibir las betalactamasas y junto con un antibiótico betalactámico se evidencia un efecto de sinergia o potenciación con una reducción de la concentración mínima inhibitoria por la presencia de los compuestos reivindicados, en comparación con el antibiótico betalactámico solo. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.



Resolución N° 40656

Ref. Expediente N° NC2019/0001995

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 16 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 NC2019/0001995 el 12 de mayo de 2020 teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS DERIVADOS DE ÁCIDO SULFÓNICO (4R,5AS,8AS)-2,8-DIOXOHEXAHIDRO-2H-1,4-METANOPIRROLO[3,4-D][1,3]DIAZEPIN-3(4H)-ILO, COMO INHIBIDORES DE BETA LACTAMASA”.

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 DERIVADOS DE ÁCIDO SULFÓNICO (4R,5AS,8AS)-2,8-DIOXOHEXAHIDRO-2H-1,4-METANOPIRROLO[3,4-D][1,3]DIAZEPIN-3(4H)-ILO, COMO INHIBIDORES DE BETA LACTAMASA”

Clasificación IPC: C07D 519/06, A61K 31/535, A61P 31/04, C07D 471/18.

Reivindicaciones: 1 a 16 incluidas en el radicado bajo el No NC2019/0001995 el 12 de mayo de 2020, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: NOVARTIS AG.

Domicilio: Lichtstrasse 35, 4056 Basel, BASEL, SUIZA.

Inventores: Xiaodong LIN, Folkert RECK, Robert Lowell SIMMONS, Qingming ZHU, Anthony CASAREZ, Markus FUREGATI, Guido KOCH y Flavio OSSOLA.

Prioridad N° 28/09/2016, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/401,022.

Solicitud internacional N°: PCT/IB2017/055973

Fecha: 28 de septiembre de 2017.

Vigente desde: 28 de septiembre de 2017

Hasta: 28 de septiembre de 2037.

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.



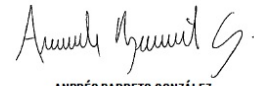
Resolución N° 40656

Ref. Expediente N° NC2019/0001995

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a NOVARTIS AG, 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 22 de julio de 2020



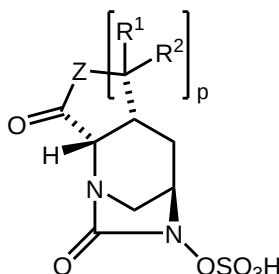
ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZÁLEZ
Fecha: 2020.07.22
23:03:52 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto de la Fórmula (A):



en donde p es 1 o 2;

R¹ y R² se seleccionan independientemente a partir de H y alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido por hasta tres grupos seleccionados a partir de halo, CN, -OR, oxo, y -NRR';

Z es NR³ o N-OR³;

R³ se selecciona independientemente en cada ocurrencia a partir de H, Cy, y alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido por hasta tres grupos seleccionados a partir de Cy, halo, CN, -OR, y -NRR';

Cy es un anillo de cicloalquilo C₃-C₆ o anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados a partir de N, O y S como miembros del anillo, y Cy está opcionalmente sustituido por hasta tres grupos seleccionados a partir de oxo, halo, alquilo C₁-C₂, CN, -OR, y -NRR'; y

R y R' se seleccionan independientemente a partir de H y alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido por uno o dos grupos seleccionados a partir de halo, -OH, -CN, -O-(alquilo C₁-C₄), oxo, -NH₂, -NH(alquilo C₁-C₄), y -N(alquilo C₁-C₄)₂,

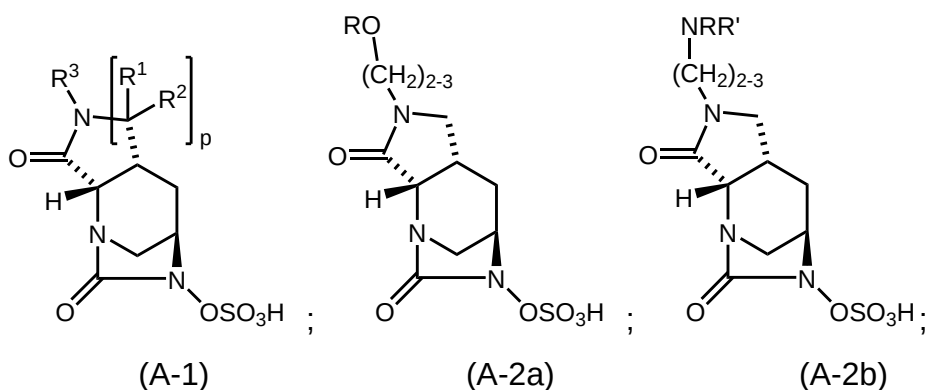
o R y R' tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo seleccionado a partir de piperidina, morfolina, pirrolidina, y azetidina, en donde el anillo es opcionalmente sustituido por uno o dos grupos seleccionados a partir de halo, alquilo C₁-C₂, -OH, -CN, -O-(alquilo C₁-C₄), oxo, -NH₂, -NH(alquilo C₁-C₄), y -N(alquilo C₁-C₄)₂;

o una sal o forma zwitteriónica del mismo.

Resolución N° 40656

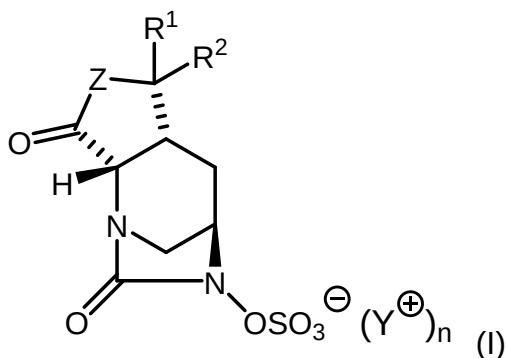
Ref. Expediente N° NC2019/0001995

2. El compuesto de la Reivindicación 1, que es un compuesto de una de las siguientes Fórmulas:



o una sal o forma zwitteriónica del mismo.

3. Un compuesto de la Reivindicación 1, el cual es un compuesto de la Fórmula (I):



en donde:

R^1 y R^2 se seleccionan independientemente a partir de H y alquilo C_1 - C_4 opcionalmente sustituidos por hasta tres grupos seleccionados a partir de halo, CN, -OR, oxo, y -NRR';

Z es NR^3 o $N-OR^3$;

R^3 se selecciona independientemente en cada ocurrencia a partir de H, Cy, y alquilo C_1 - C_4 opcionalmente sustituido por hasta tres grupos seleccionados a partir de Cy, halo, CN, -OR, y -NRR';

Cy es un anillo de cicloalquilo C_3 - C_6 o anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados a partir de N, O y S como miembros del anillo, y Cy es opcionalmente sustituido por hasta tres grupos seleccionados a partir de oxo, halo, alquilo C_1 - C_2 , CN, -OR, y -NRR'; y

Resolución N° 40656

Ref. Expediente N° NC2019/0001995

R y R' se seleccionan independientemente a partir de H y alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido por uno o dos grupos seleccionados a partir de halo, -OH, -CN, -O-(alquilo C₁-C₄), oxo, -NH₂, -NH(alquilo C₁-C₄), y -N(alquilo C₁-C₄)₂,

o R y R' tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo seleccionado a partir de piperidina, morfolina, pirrolidina, y azetidina, en donde el anillo es opcionalmente sustituido por uno o dos grupos seleccionados a partir de halo, alquilo C₁-C₂, -OH, -CN, -O-(alquilo C₁-C₄), oxo, -NH₂, -NH(alquilo C₁-C₄), y -N(alquilo C₁-C₄)₂;

Y es un grupo catiónico;

n es 0 o 1; y

cuando n es 0, el compuesto de la Fórmula I está en una forma zwitteriónica.

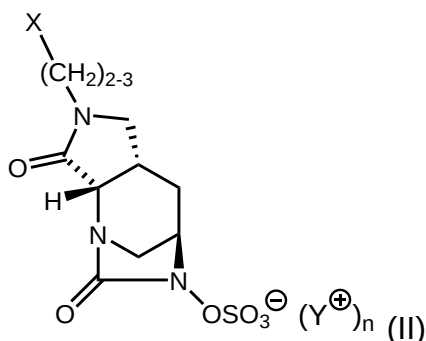
4. El compuesto de la Reivindicación 1, en el que Z es NR³ y R³ es H o alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido por -OR o -NRR', o una sal o forma zwitteriónica del mismo.

5. El compuesto de la Reivindicación 4, en donde R³ es alquilo C₁-C₂ opcionalmente sustituido por -OR o -NRR', o una sal o forma zwitteriónica del mismo.

6. El compuesto de la Reivindicación 4, en donde R³ es H, o una sal o forma zwitteriónica del mismo.

7. El compuesto de la Reivindicación 1, en donde R¹ y R² son ambos H, o una sal o forma zwitteriónica del mismo.

8. El compuesto de la Reivindicación 1, que tiene la estructura:

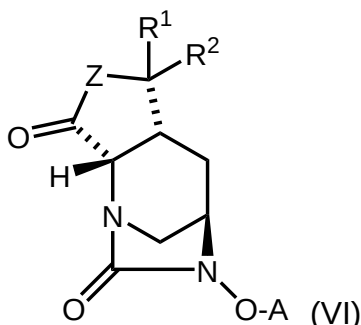


en donde X es -OR o -NRR'; como una sal o forma zwitteriónica del mismo.



Resolución N° 40656

Ref. Expediente N° NC2019/0001995



en donde:

R¹ y R² se seleccionan independientemente a partir de H y alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituidos por hasta tres grupos seleccionados a partir de halo, CN, -OR, oxo, y -NRR';

Z es NR³ o N-OR³;

R³ se selecciona independientemente en cada ocurrencia a partir de H, Cy, y alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituidos por hasta tres grupos seleccionados a partir de Cy, halo, CN, -OR, y -NRR';

Cy es un anillo de cicloalquilo C₃-C₆ o un anillo heterocíclico de 4-6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados a partir de N, O y S como miembros del anillo, y Cy es opcionalmente sustituido por hasta tres grupos seleccionados a partir de oxo, halo, alquilo C₁-C₂, CN, -OR, y -NRR'; y

R y R' se seleccionan independientemente a partir de H y alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido por uno o dos grupos seleccionados a partir de halo, alquilo C₁-C₂, -OH, -CN, -O-(alquilo C₁-C₄), oxo, -NH₂, -NH(alquilo C₁-C₄), y -N(alquilo C₁-C₄)₂,

o R y R' tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo seleccionado a partir de piperidina, morfolina, pirrolidina, y azetidina, en donde el anillo es opcionalmente sustituido por uno o dos grupos seleccionados a partir de halo, alquilo C₁-C₂, -OH, -CN, -O-(alquilo C₁-C₄), oxo, -NH₂, -NH(alquilo C₁-C₄), y -N(alquilo C₁-C₄)₂;

A es H o -CH₂-Ph, donde Ph representa fenilo opcionalmente sustituido por uno o dos grupos seleccionados a partir de halo, alquilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₄;

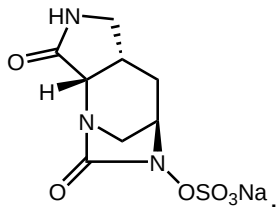
o una sal del mismo.



Resolución N° 40656

Ref. Expediente N° NC2019/0001995

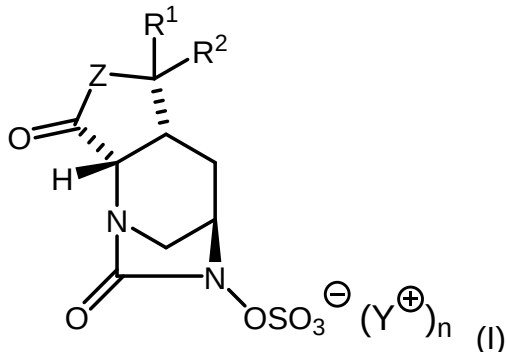
11. El compuesto de la Fórmula (VII):



12. El compuesto de la Reivindicación 11 en forma cristalina, en donde el compuesto es caracterizado por picos de XRPD en ángulos de difracción (2Teta) de 8,3 y 16,6 grados y uno o más picos XRPD adicionales en ángulos de difracción (2Teta) de 25,1 o 31,3 grados.

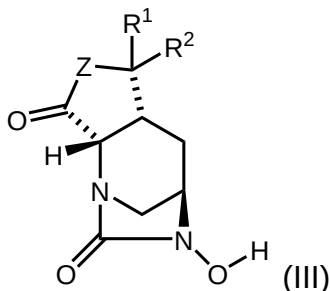
13. El compuesto de la Reivindicación 12, que exhibe una endoterma en calorimetría diferencial de barrido entre 283 °C y 350 °C.

14. Un proceso para hacer un compuesto de la Fórmula (I),



de acuerdo con la Reivindicación 3;

en donde el proceso comprende poner en contacto un compuesto de la Fórmula (III)



en donde Z, R¹, R² y R³ son como se definen en la Reivindicación 3, con un agente sulfonilante en presencia de una base.

Resolución N° **40656**

Ref. Expediente N° NC2019/0001995

15. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de la Reivindicación 1 y al menos un excipiente farmacéuticamente aceptable.
16. Una composición farmacéutica, que comprende un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 y un antibiótico beta-lactámico.

