

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 67636

Ref. Expediente N° NC2018/0011933

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 2 de noviembre de 2018, con el N° NC2018/0011933, por BAYER PHARMA AKTIENGESSELLSCHAFT, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “DERIVADOS DE PIRIDINILTRIAZOL SUSTITUIDOS CON AMIDA Y USOS DE ESTOS”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2017/060356 del 2 de mayo de 2017.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 845 el 22 de noviembre de 2018, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 200529, notificado el 30 de abril 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° NC2018/0011933 el 30 de julio de 2020, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 8 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 8 incluidas en el radicado bajo el N° NC2018/0011933 el 30 de julio de 2020, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a un compuesto de fórmula (I), su método de preparación y composiciones farmacéuticas que lo comprenden, que difiere del estado de la técnica más cercano, WO2011104322, en la posición del grupo carboxamida y el grupo



Resolución N° 67636

Ref. Expediente N° NC2018/0011933

piridino (Ar) presentes como sustituciones del anillo triazólico. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto como antagonista del receptor V1a de vasopresina. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 8 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° NC2018/0011933 el 30 de julio de 2020, tituló la invención como: “DERIVADOS DE PIRIDINILTRIAZOL SUSTITUIDOS CON AMIDA COMO ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR V1A DE VASOPRESINA”. Sin embargo, no se acepta porque no describe de manera específica el objeto de la invención, y de acuerdo con el objeto concedido, el título de la invención quedará de la siguiente manera: “DERIVADOS DE 3-({3-(4-CLOROFENIL)-5-OXO-4,5-DIHIDRO-1H-1,2,4-TRIAZOL-1-IL} METIL)- 1H-1,2,4-TRIAZOL-5-CARBOXAMIDA COMO ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR V1A DE VASOPRESINA”.

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 3-({3-(4-CLOROFENIL)-5-OXO-4,5-DIHIDRO-1H-1,2,4-TRIAZOL-1-IL} METIL)- 1H-1,2,4-TRIAZOL-5-CARBOXAMIDA COMO ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR V1A DE VASOPRESINA”

Clasificación IPC: C07D 401/14, A61K 31/4439, A61P 9/00.

Reivindicaciones: 1 a 8 incluidas en el radicado bajo el N° NC2018/0011933 el 30 de julio de 2020, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT.

Domicilio: MÜLLERSTR. 178 13353 BERLIN, ALEMANIA.

Inventores: Hanna TINEL, Pierre WASNAIRE, Peter KOLKHOF, Axel KRETSCHMER, Klemens LUSTIG, Elisabeth POOK, Heiko SCHIRMER, Marie-Pierre COLLIN, Thomas NEUBAUER, Chantal FÜRSTNER, Matthias Beat WITTEWER, Anja BUCHMÜLLER, Karoline DRÖBNER, Thomas MONDRITZKI, Carsten SCHMECK y Hana CERNECKA.

Resolución N° **67636**

Ref. Expediente N° NC2018/0011933

Prioridad N°: 3/05/2016, EP 16168165.5.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2017/060356

Fecha: 2 de mayo de 2017.

Vigente desde: 2 de mayo de 2017

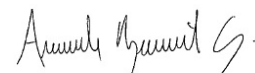
Hasta: 2 de mayo de 2037.

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.

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a BAYER PHARMA AKTIENGESSELLSCHAFT, 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 26 de octubre de 2020



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

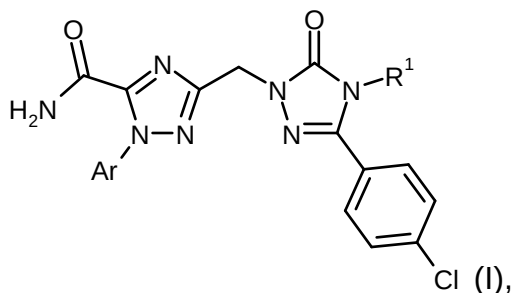
Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZÁLEZ
Fecha: 2020.10.26
17:02:46 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.



ANEXO 1

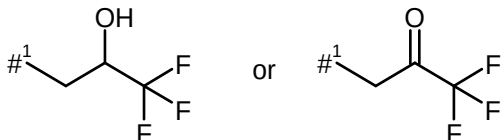
REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto de la fórmula general (I):



en donde

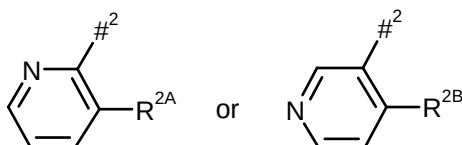
R¹ representa un grupo de la fórmula



en donde

#¹ representa el punto de unión al átomo de nitrógeno,

Ar representa un grupo de la fórmula



en donde

#² representa el punto de unión al átomo de nitrógeno,

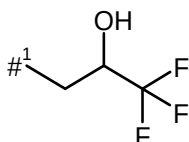
R^{2A} representa un grupo que se selecciona de un átomo de cloro, un átomo de bromo, trifluorometilo, trifluorometoxi, etoxycarbonilo y C(=O)NH₂,

R^{2B} representa un grupo que se selecciona de un átomo de cloro, trifluorometilo, y etoxycarbonilo,

o una sal, hidrato y/o solvato farmacéuticamente aceptables de esta.

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

R¹ representa un grupo de la fórmula



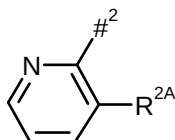
Resolución N° 67636

Ref. Expediente N° NC2018/0011933

en donde

#¹ representa el punto de unión al átomo de nitrógeno,

Ar representa un grupo de la fórmula



en donde

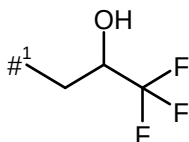
#² representa el punto de unión al átomo de nitrógeno,

R^{2A} representa un grupo que se selecciona de un átomo de cloro, un átomo de bromo, trifluorometilo, trifluorometoxi, etoxycarbonilo y C(=O)NH₂,

o una sal, hidrato y/o solvato farmacéuticamente aceptables de esta.

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

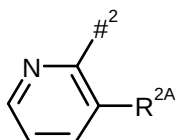
R¹ representa un grupo de la fórmula



en donde

#¹ representa el punto de unión al átomo de nitrógeno,

Ar representa un grupo de la fórmula



en donde

#² representa el punto de unión al átomo de nitrógeno,

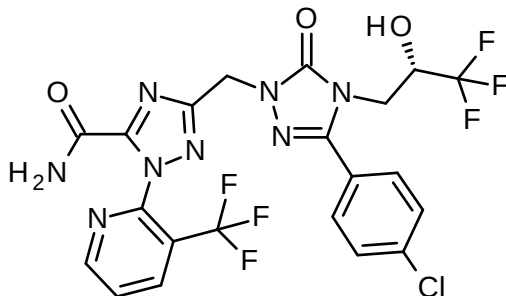
R^{2A} representa un grupo que se selecciona de un átomo de cloro, trifluorometilo, y trifluorometoxi,

o una sal, hidrato y/o solvato farmacéuticamente aceptables de esta.

4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde dicho compuesto es 3-({3-(4-clorofenil)-5-oxo-4-[(2S)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxipropil]-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-1-il}metil)-1-[3-(trifluorometil)piridin-2-il]-1H-1,2,4-triazol-5-carboxamida de la siguiente fórmula

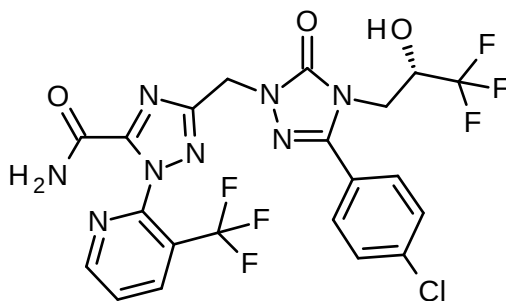
Resolución N° 67636

Ref. Expediente N° NC2018/0011933

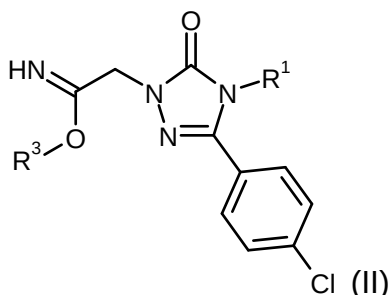


o una sal, hidrato y/o solvato farmacéuticamente aceptable de esta.

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en donde dicho compuesto es 3-({3-(4-clorofenil)-5-oxo-4-[(2S)-3,3,3-trifluoro-2-hidroxiopropil]-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-1-il}metil)-1-[3-(trifluorometil)piridin-2-il]-1H-1,2,4-triazol-5-carboxamida de la siguiente fórmula



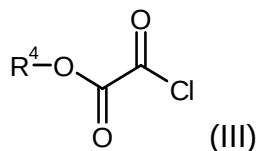
6. Un método para preparar un compuesto de fórmula general (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 5, dicho método comprende el paso de
- [A] de permitir un compuesto intermedio de fórmula (II):



en donde R¹ es como se define para el compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,

R³ representa un grupo alquilo-(C₁-C₄), en particular un grupo metilo,

para reaccionar en un primer paso en presencia de una base y opcionalmente una sal de cobre, con un compuesto de fórmula general (III):



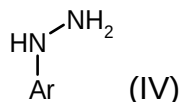
donde



Resolución N° 67636

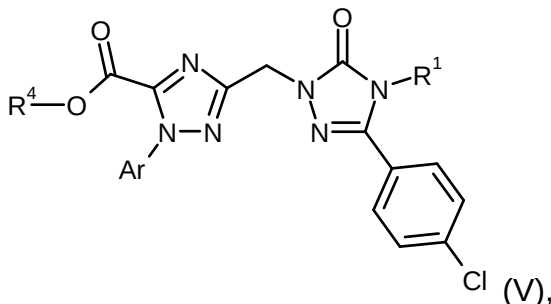
Ref. Expediente N° NC2018/0011933

R⁴ representa un grupo alquilo-(C₁-C₄), en particular un grupo metilo, para proporcionar un compuesto intermedio, que luego se deja reaccionar en presencia de una base, en un segundo paso con un compuesto de hidrazina de la fórmula general (IV) o una respectiva sal de este



en donde Ar es como se define para el compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,

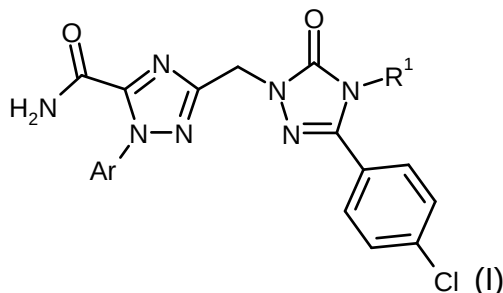
proporcionando así un compuesto de la fórmula general (V):



en donde R¹ y Ar son como se define para el compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, y

R⁴ representa un grupo alquilo-(C₁-C₄), en particular un grupo metilo, seguido por un paso posterior

[B] de permitir que el compuesto de fórmula (V) obtenido en el paso [A] reaccione con amoníaco proporcionando así un compuesto de la fórmula general (I):



en donde R¹ y Ar son como se define para el compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, y

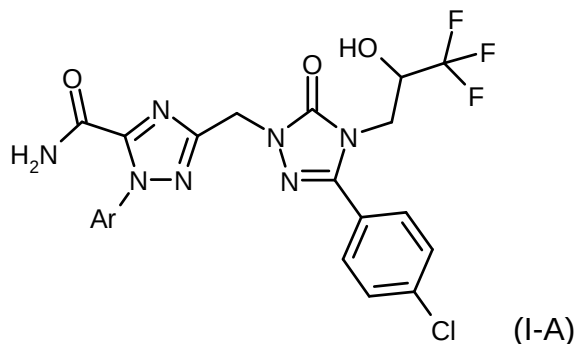
opcionalmente seguido por el paso

[C] conversión de los alcoholes de la fórmula general (I-A):



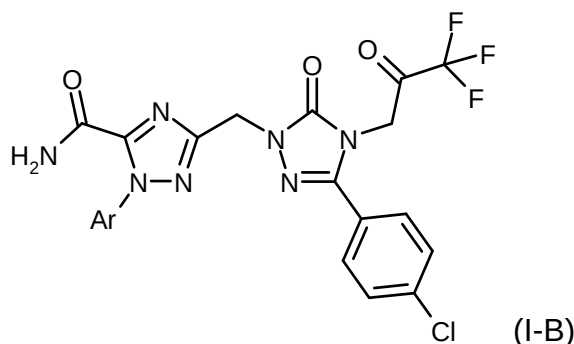
Resolución N° 67636

Ref. Expediente N° NC2018/0011933



en donde Ar es como se define para el compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,

a las cetonas de la fórmula general (I-B):



en donde Ar es como se define para el compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,

usando métodos de oxidación conocidos,

cada [A], [B] y [C] opcionalmente seguidos, si corresponde, por (i) separar los compuestos de fórmula (I) así obtenidos en sus respectivos enantiómeros, y/o (ii) convertir los compuestos de fórmula (I) en sus respectivos hidratos, solvatos, sales y/o hidratos o solvatos de las sales por el tratamiento con los correspondientes solventes y/o ácidos o bases.

7. Composición farmacéutica que comprende un compuesto como se define en cualesquiera de las reivindicaciones 1 a 3 y un excipiente farmacéuticamente aceptable.
8. Composición farmacéutica de la reivindicación 7 que comprende un primer ingrediente activo, en particular compuestos de fórmula general (I) de acuerdo con cualesquiera de las reivindicaciones 1 a 4, y un ingrediente activo adicional, en particular un agente terapéutico adicional que se selecciona del grupo que consiste en diuréticos, antagonistas de angiotensina AII, inhibidores de ACE, bloqueadores del receptor beta, antagonistas del receptor mineralocorticoide, antidiabéticos, nitratos orgánicos y donantes de NO, activadores y estimuladores de la guanilato ciclasa soluble (sGC), agentes antiinflamatorios, agentes inmunosupresores, aglutinantes de fosfato y/o compuestos que modulan el metabolismo de vitamina D.