

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547

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 mayo de 2019, con el N° NC2019/0004547, por DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “DERIVADO DE UREA”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/JP2017/036272 del 5 de octubre de 2017.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 859 el 10 de mayo de 2019, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 11997, notificado el 25 de septiembre 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° NC2019/0004547 el 15 de diciembre de 2020, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 27 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 27 incluidas en el radicado bajo el N° NC2019/0004547 del 15 de diciembre de 2020, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior toda vez que refieren compuestos derivados de piridina bicíclicos fusionados, que difieren del estado de la técnica más cercano, WO2013070600, en los significados para R1, R2 y Ar. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia un efecto mejorado de los compuestos como inhibidores de triptofanasa, inhibidores de producción de indol y una mejor eficacia sin empeorar la función renal (Descripción, Tabla 10, pág. 104-105; Tabla 11, pág. 107). Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 27 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.

Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547

SÉPTIMO: Que el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0004547 el 5 de octubre de 2017, tituló la invención como: “DERIVADO DE UREA”. Sin embargo, no se acepta porque no especifica los compuestos y composiciones farmacéuticas a los que cuales se se refieren las reivindicaciones, y de acuerdo con el objeto concedido, el título de la invención quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS DERIVADOS DE ÁCIDO (FENIL SUSTITUIDO)CARBAMOIL-AMINO-BUTANOICO, SU FORMA CRISTALINA Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS CONTIENEN”.

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 (FENIL SUSTITUIDO)CARBAMOIL-AMINO-BUTANOICO, SU FORMA CRISTALINA Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS CONTIENEN”

Clasificación IPC: A61K 31/198, A61K 31/381, A61K 31/40, A61K 31/4453, A61P 13/12, A61P 43/00, C07C 275/28, C07C 275/30, C07C 275/34, C07C 275/42, C07C 323/44, C07D 207/10, C07D 295/135, C07D 333/36.

Reivindicaciones: 1 a 27 incluidas en el radicado bajo el N° NC2019/0004164 el 10 de diciembre de 2020, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED.

Domicilio: 3-5-1, Nihonbashi Honcho CHUO-KU 103-8426 TOKYO JAPON.

Inventor: Tsuyoshi SONEDA, Yuji NAKAMURA, Koji MATSUMOTO, Naomi TANAKA, Taichi FUKUNAGA.

Prioridad N°: 6/10/2016, JP (JAPON), 2016-197867.

Solicitud internacional N°: PCT/JP2017/036272 **Fecha:** 5 de octubre de 2017.

Vigente desde: 5 de octubre de 2017 **Hasta:** 5 de octubre 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.



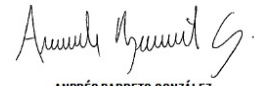
Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED, 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 29 de enero de 2021



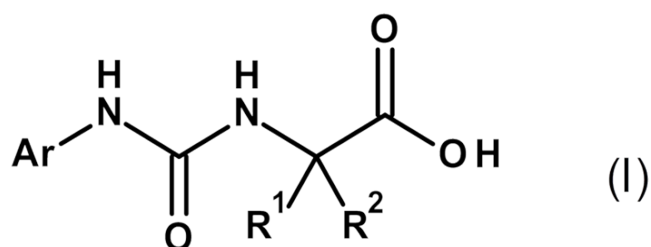
ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZÁLEZ
Fecha: 2021.01.29
23:02:18 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

ANEXO 1

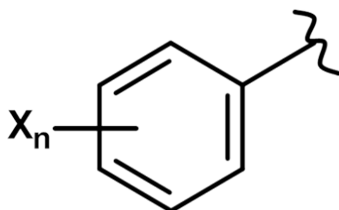
REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto representado por la siguiente fórmula general (I) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:



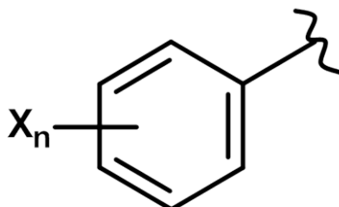
en donde

(A) Ar representa un grupo representado por la siguiente fórmula:



en donde R¹ representa un grupo metilo, R² representa un grupo etilo o un grupo alquilo C₄-C₆, n representa 1 o 2, cada X independientemente representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆ halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ ciano, un grupo cicloalquilo C₃-C₆ ciano, un grupo alcoxi C₁-C₆ halógeno, un grupo alquiltio C₁-C₆ halógeno, un grupo amino cíclico saturado, un grupo amino cíclico saturado halógeno, un grupo fenilo o un grupo fenilo halógeno;

(B) Ar representa un grupo representado por la siguiente fórmula:



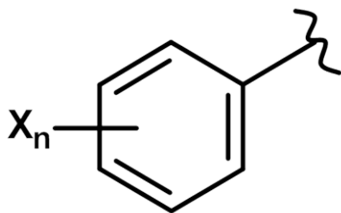
en donde R¹ representa un grupo cicloalquilo C₃-C₆, R² representa un grupo alquilo C₂-C₆ o un grupo cicloalquilo C₃-C₆, n representa 0, 1 o 2, y cada X independientemente representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C₁-C₆ halógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ ciano, un grupo cicloalquilo C₃-C₆ ciano, un grupo alcoxi C₁-C₆ halógeno, un grupo alquiltio C₁-C₆ halógeno, un grupo amino cíclico

Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547

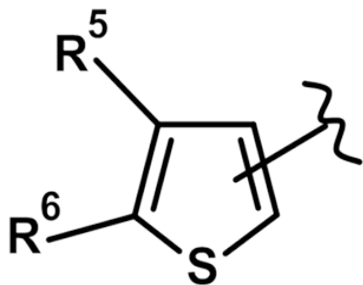
saturado, un grupo amino cíclico saturado halógeno, un grupo fenilo o un grupo fenilo halógeno;

(C) Ar representa un grupo representado por la siguiente fórmula:



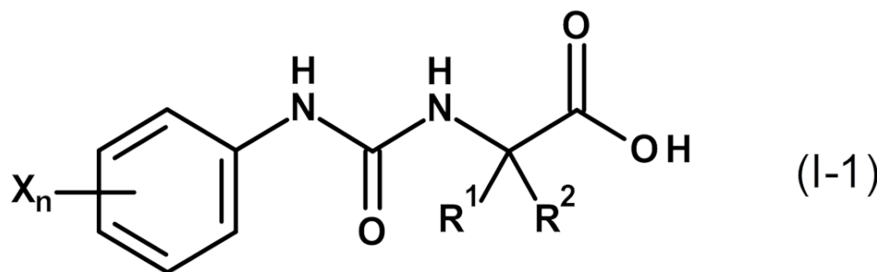
en donde R^1 y R^2 son el mismo o diferente y representan un grupo alquilo C_2-C_6 , n representa 1 o 2, y cada X independiente representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 halógeno, un grupo alquilo C_2-C_6 ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_6 ciano, un grupo alcoxi C_1-C_6 halógeno, un grupo alquiltio C_1-C_6 halógeno, un grupo amino cíclico saturado, un grupo amino cíclico saturado halógeno, un grupo fenilo o un grupo fenilo halógeno, siempre y cuando X no represente un átomo de halógeno o un grupo ciano cuando n representa 1; o

(D) Ar representa un grupo representado por la siguiente fórmula:



en donde R^1 y R^2 son el mismo o diferente y representa un grupo alquilo C_1-C_6 o un grupo cicloalquilo C_3-C_6 , R^5 representa un átomo de hidrógeno, y R^6 representa un átomo de halógeno.

- El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 representado por la siguiente fórmula general (I-1) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

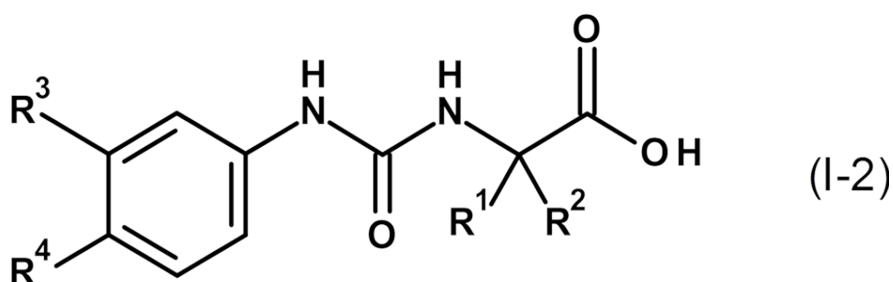


Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547

en donde R^1 representa un grupo metilo, R^2 representa un grupo etilo o un grupo alquilo C_4-C_6 , n representa 1 o 2, y cada X independientemente representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo ciano, un grupo cicloalquilo C_1-C_6 halógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_6 ciano, un grupo alcoxi C_1-C_6 halógeno, un grupo alquiltio C_1-C_6 halógeno, un grupo amino cíclico saturado, un grupo amino cíclico saturado halógeno, un grupo fenilo o un grupo fenilo halógeno.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 representado por la siguiente fórmula general (I-2) o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:



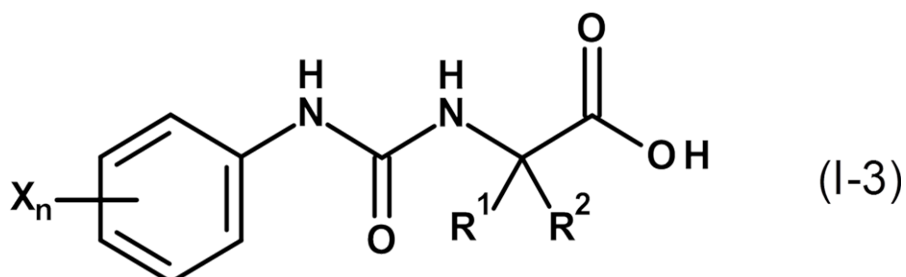
en donde R^1 representa un grupo metilo, R^2 representa un grupo etilo o un grupo alquilo C_4-C_6 , R^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo ciano, y R^4 representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 halógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_6 ciano, un grupo alcoxi C_1-C_6 halógeno, un grupo alquiltio C_1-C_6 halógeno, un grupo amino cíclico saturado, un grupo amino cíclico saturado halógeno, un grupo fenilo o un grupo fenilo halógeno.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 o 3, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^2 representa un grupo etilo.
5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3 o 4, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o un grupo ciano.
6. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 3 a 5, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^4 representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo difluorometoxi o un grupo trifluorometoxi.

Resolución N° 2765

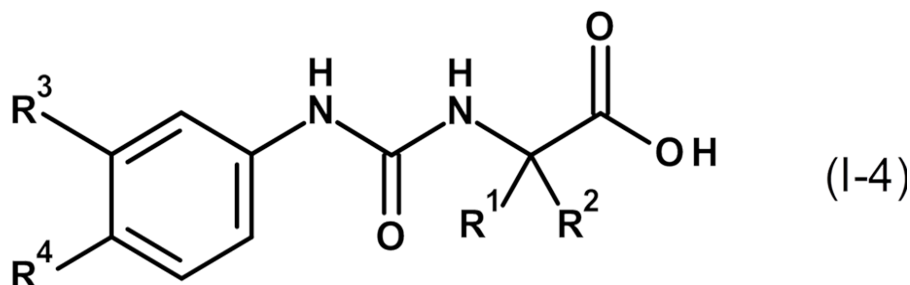
Ref. Expediente N° NC2019/0004547

7. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 representado por la siguiente fórmula general (I-3), o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:



en donde R^1 representa un grupo cicloalquilo C_3-C_6 , R^2 representa un grupo alquilo C_2-C_6 o un grupo cicloalquilo C_3-C_6 , n representa 0, 1 o 2, y cada X independientemente representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 halógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_6 ciano, un grupo alcoxi C_1-C_6 halógeno, un grupo alquiltio C_1-C_6 halógeno, un grupo amino cíclico saturado, un grupo amino cíclico saturado halógeno, un grupo fenilo o un grupo fenilo halógeno.

8. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7 representado por la siguiente fórmula general (I-4), o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:



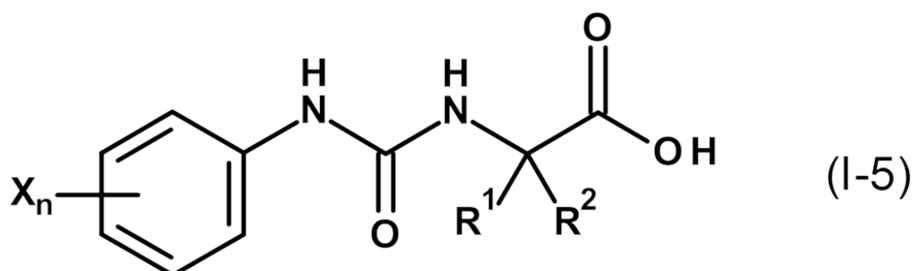
en donde R^1 representa un grupo cicloalquilo C_3-C_6 , R^2 representa un grupo alquilo C_2-C_6 o un grupo cicloalquilo C_3-C_6 , R^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo ciano, y R^4 representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 halógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_6 ciano, un grupo alcoxi C_1-C_6 halógeno, un grupo alquiltio C_1-C_6 halógeno, un grupo amino cíclico saturado, un grupo amino cíclico saturado halógeno, un grupo fenilo o un grupo fenilo halógeno;

9. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 7 o 8, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^1 representa un grupo ciclopropilo.

Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547

10. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^2 representa un grupo etilo o un grupo ciclopropilo.
11. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 8 a 10, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^3 representa un átomo de hidrógeno, y R^4 representa un átomo de flúor, un grupo ciano, un grupo cianometilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo difluorometoxi o un grupo trifluorometoxi.
12. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 8 a 10, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^3 representa un grupo ciano, y R^4 representa un átomo de hidrógeno.
13. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 representado por la siguiente fórmula general (I-5), o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

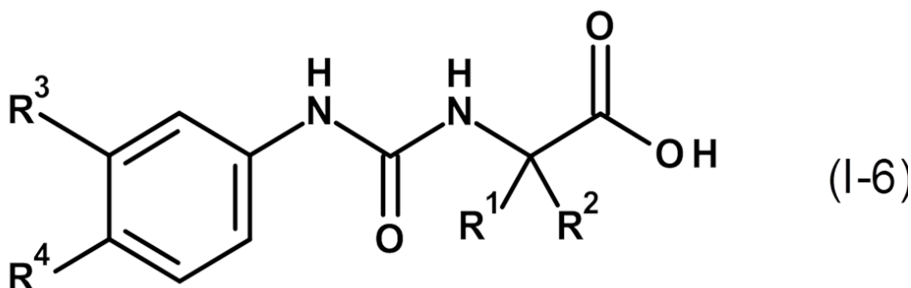


en donde R^1 y R^2 son el mismo o diferente y representan un grupo alquilo C_2-C_6 , n representa 1 o 2, y cada X independientemente representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 halógeno, un grupo alquilo C_2-C_6 ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_6 ciano, un grupo alcoxi C_1-C_6 halógeno, un grupo alquiltio C_1-C_6 halógeno, un grupo amino cíclico saturado, un grupo amino cíclico saturado halógeno, un grupo fenilo o un grupo fenilo halógeno, siempre y cuando X no represente un átomo de halógeno o un grupo ciano cuando n representa 1.

14. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 13 representado por la siguiente fórmula general (I-6), o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:

Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547



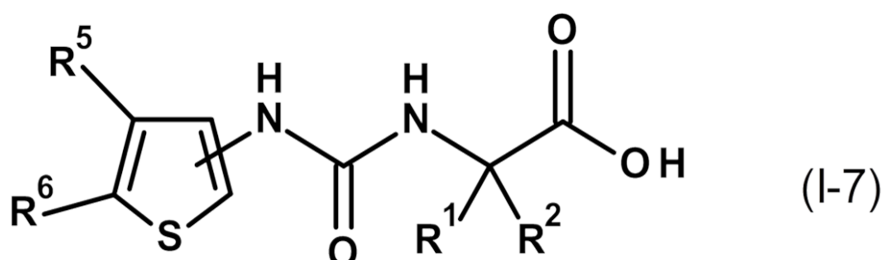
en donde R^1 y R^2 son el mismo o diferente y representan un grupo alquilo C_2-C_6 , R^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, o un grupo ciano, y R^4 representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo ciano, un grupo alquilo C_1-C_6 halógeno, un grupo alquilo C_2-C_6 ciano, un grupo cicloalquilo C_3-C_6 ciano, un grupo alcoxi C_1-C_6 halógeno, un grupo alquiltio C_1-C_6 halógeno, un grupo amino cíclico saturado, un grupo amino cíclico saturado halógeno, un grupo fenilo o un grupo fenilo halógeno, siempre y cuando R^4 no represente un átomo de halógeno o un grupo ciano cuando R^3 representa un átomo de hidrógeno.

15. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 13 o 14, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^1 y R^2 son el mismo o diferente y representan un grupo etilo, un grupo propilo o un grupo isopropilo.
16. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 13 o 14, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^1 y R^2 representan una combinación de un grupo etilo y un grupo etilo, o un grupo etilo y un grupo propilo.
17. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 13 o 14, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^1 y R^2 ambos representan un grupo etilo.
18. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 14 a 17, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^3 representa un átomo de hidrógeno.
19. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 14 a 17, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R^4 representa un grupo trifluorometilo, un grupo monofluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo trifluorometiltio, un grupo fenilo o un grupo 2-fluorofenilo.

Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547

20. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 representado por la siguiente fórmula general (I-7), o una sal farmacológicamente aceptable del mismo:



en donde R¹ y R² son el mismo o diferente y representan un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo cicloalquilo C₃-C₆, R⁵ representa un átomo de hidrógeno, y R⁶ representa un átomo de halógeno.

21. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 20, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R¹ y R² ambos representan un grupo etilo.
22. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 20 o 21, o una sal farmacológicamente aceptable del mismo, en donde R⁶ representa un átomo de cloro.
23. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado del grupo que consiste de ácido diciclopropil({[4-(trifluorometoxi)fenil]carbamoil}amino)acético, ácido 2-ciclopropil-2-({[4-(trifluorometoxi)fenil]carbamoil}amino)butanoico, N-{[4-(difluorometoxi)fenil]carbamoil}-D-isovalina, ácido 2-ciclopropil-2-({[4-(difluorometoxi)fenil]carbamoil}amino)butanoico, N-{[4-(2,2,2-trifluoroetil)fenil]carbamoil}-D-isovalina, N-{[4-(difluorometoxi)-3-fluorofenil]carbamoil}-D-isovalina, ácido 2-ciclopropil-2-[(fenilcarbamoil)amino]butanoico, ácido 2-ciclopropil-2-[(4-fluorofenil)carbamoil]amino}butanoico, N-[(4-clorofenil)carbamoil]-D-isovalina, ácido 2-[(5-clorotiofen-3-il)carbamoil]amino}-2-etilbutanoico, N-[(4-iodofenil)carbamoil]-D-isovalina y ácido 2-[(3-cianofenil)carbamoil]amino}-2-ciclopropilbutanoico; o una sal farmacológicamente aceptable del mismo.
24. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del grupo que consiste de: N-{[4-(difluorometoxi)fenil]carbamoil}-D-isovalina, N-{[4-(difluorometoxi)-3-fluorofenil]carbamoil}-D-isovalina, N-[(4-clorofenil)carbamoil]-D-

Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547

isovalina, N-[(4-iodofenil)carbamoil]-D-isovalina, ácido (2R)-2-[[[(3-cianofenil)carbamoil]amino]-2-ciclopropilbutanoico, ácido (2S)-2-[[[(3-cianofenil)carbamoil]amino]-2-ciclopropilbutanoico y 2-[[[(5-clorotiofen-3-il)carbamoil]amino]-2-etilbutanoico; o una sal farmacológicamente aceptable del mismo.

25. Una composición farmacéutica que comprende, como ingrediente activo, el compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 24, o una sal farmacológicamente aceptable de mismo.

26. Una forma cristalina del compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionada del grupo que consiste de:

N-[[4-(difluorometoxi)fenil]carbamoil]-D-isovalina cristalina que tiene picos característicos en espacios interplanares d de 7.51, 7.33, 6.67, 6.15, 5.32, 5.24, 4.98, 4.79, 3.96 y 3.59 angstroms;

N-[[4-(difluorometoxi)-3-fluorofenil]carbamoil]-D-isovalina cristalina que tiene picos característicos en espacios interplanares de 9.52, 6.10, 5.45, 5.29, 4.94, 4.89, 4.75, 3.80, 3.48 y 3.44 angstroms;

N-[(4-clorofenil)carbamoil]-D-isovalina cristalina que tiene picos característicos en espacios interplanares de 15.60, 6.23, 5.68, 5.34, 5.20, 4.59, 4.53, 3.83, 3.37 y 3.15 angstroms;

N-[(4-iodofenil)carbamoil]-D-isovalina cristalina que tiene picos característicos en espacios interplanares de 16.92, 6.62, 4.99, 4.44, 4.30, 4.18, 3.30, 3.21, 3.07 y 3.02 angstroms;

ácido (+)-2-[[[(3-cianofenil)carbamoil]amino]-2-ciclopropilbutanoico cristalino que tiene picos principales característicos en espacios interplanares de 11.30, 8.35, 7.66, 5.64, 5.46, 5.22, 4.73, 4.50, 4.35 y 4.02 angstroms;

ácido (-)-2-[[[(3-cianofenil)carbamoil]amino]-2-ciclopropilbutanoico cristalino que tiene picos característicos en espacios interplanares de 15.66, 11.62, 11.30, 8.35, 7.80, 6.84, 5.45, 5.22, 4.5 y 4.02 angstroms; y

ácido 2-[[[(5-clorotiofen-3-il)carbamoil]amino]-2-etilbutanoico cristalino que tiene picos característicos en espacios interplanares de 15.82, 9.42, 6.53, 5.85, 5.48, 5.24, 4.69, 4.46, 3.58 y 3.12 angstroms,

todos en difracción de rayos X en polvo obtenido a través de irradiación con radiación K α de cobre (longitud de onda λ = 1.54 angstroms).

Resolución N° 2765

Ref. Expediente N° NC2019/0004547

27. Una composición farmacéutica que comprende, como ingrediente activo, cualquiera de las formas cristalinas del compuesto de acuerdo con la reivindicación 26.

