

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270

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 F. HOFFMANN-LA ROCHE AG, presentó solicitud divisional, la cual fue aceptada para trámite mediante el N° NC2020/0011270 para la invención titulada “TETRAHIDRO-PIRIDO[3,4-B]INDOLES MODULADORES DE RECEPTORES DE ESTRÓGENOS”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2015/080119 del 17 de diciembre de 2015.

SEGUNDO: Que la mencionada solicitud se presentó como división de la solicitud N° NC2017/0003070, la cual fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 798 el 11 de julio de 2017, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2020/0011570 el 21 de septiembre de 2020, presentó las reivindicaciones 1 a 24 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.

CUARTO: 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*”.

QUINTO: Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 24 incluidas en el radicado bajo el N° NC2020/0011570 el 21 de septiembre de 2020, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a compuestos tetrahidro-pirido[3,4-b]indoles moduladores de receptores de estrógenos que difiere del estado de la técnica más cercano, WO2013090836, en la presencia del tetrahidro-pirido[3,4-b]indol en la solicitud en lugar del fenil benzopirano. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto antiproliferativo en el tumor en modelo *in vivo* con injerto de células MCF7 de cáncer de mama resistentes a tamoxifeno. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.



Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 24 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.

SEXTO: Que el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2020/0011270 el 11 de septiembre de 2020, tituló la invención como: “TETRAHIDRO-PIRIDO[3,4-B]INDOLES MODULADORES DE RECEPTORES DE ESTRÓGENOS”. Sin embargo, no se acepta porque es una generalización de los compuestos reclamados y no los particulariza, y de acuerdo con el objeto concedido, el título de la invención quedará de la siguiente manera: “TETRAHIDRO-PIRIDO[3,4-B]INDOLES SUSTITUIDOS CON OXI-AZETIDIN MODULADORES DEL RECEPTOR DE ESTRÓGENOS ALFA (ER - α)”.

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:

“TETRAHIDRO-PIRIDO[3,4-B]INDOLES SUSTITUIDOS CON OXI-AZETIDIN COMO MODULADORES DEL RECEPTOR DE ESTRÓGENOS ALFA (ER - α)”

Clasificación IPC: C07D 471/04, A61K 31/437, A61P 35/00.

Reivindicaciones: 1 a 24 incluidas en el radicado bajo el N° NC2020/0011570 el 21 de septiembre de 2020, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.

Domicilio: GRENZACHERSTRASSE 124, 4070 BASEL, SUIZA.

Inventores: Xiaojing WANG, Simon Charles GOODACRE, Nicholas Charles RAY, Sharada LABADIE, Daniel Fred ORTWINE, Jason ZBIEG, Jun LIANG y Birong ZHANG.

Prioridades N°: 18/12/2014, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/093,929.
02/02/2015, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/110,998.
02/04/2015, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/142,077.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2015/080119 **Fecha:** 17 de diciembre de 2015.

Vigente desde: 17 de diciembre de 2015 **Hasta:** 17 de diciembre de 2035.

Resolución N° 16076

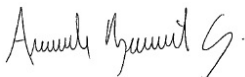
Ref. Expediente N° NC2020/0011270

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 F. HOFFMANN-LA ROCHE 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 23 de marzo de 2021



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

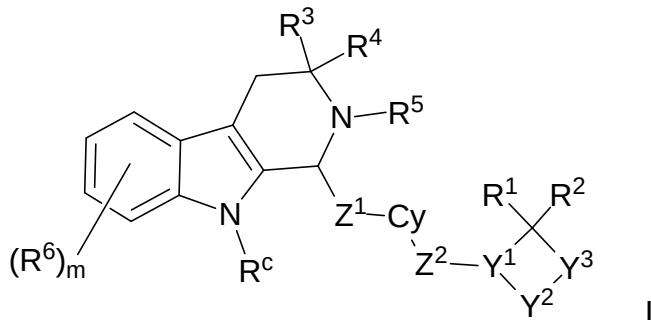
Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZALEZ
Fecha: 2021.03.23
17:02:01 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.



ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto elegido de la fórmula I:



o un estereoisómero, tautómero o sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en el que:

Y¹ es CR^b o N;

Y² es -(CH₂)-, -(CH₂CH₂)- o NR^a;

Y³ es NR^a o C(R^b)₂;

en los que uno de Y¹, Y² e Y³ es N o NR^a;

R^a es independientemente H, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₈, propargilo, cicloalquilo C₃-C₆ o heterociclilo C₃-C₆, opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados independientemente de F, Cl, Br, I, CN, OH, OCH₃ o SO₂CH₃;

R^b es independientemente H, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₈, propargilo, -(alquildiilo C₁-C₆)-(cicloalquilo C₃-C₆), cicloalquilo C₃-C₆ y heterociclilo C₃-C₆, opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados independientemente de F, Cl, Br, I, CN, -CH₂F, -CHF₂, -CF₃, -CH₂CF₃, -CH₂CHF₂, -CH₂CH₂F, OH, OCH₃ o SO₂CH₃;

R^c es independientemente H, alquilo C₁-C₆, alilo, propargilo, opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados independientemente de F, Cl, Br, I, CN, OH, OCH₃ o SO₂CH₃;

Z¹ es un enlace;

Cy es arildiilo C₆-C₂₀ o heteroarildiilo de 5 a 6 miembros;

Z² es O o O-(alquildiilo C₁-C₆) ;

R¹, R², R³ y R⁴ son cada uno independientemente H, F, Cl, Br, I, -CN, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH(CH₃)₂, -CH₂CH(CH₃)₂, -CH₂OH, -CH₂OCH₃, -CH₂CH₂OH, -C(CH₃)₂OH, -CH(OH)CH(CH₃)₂, -C(CH₃)₂CH₂OH, -CH₂CH₂SO₂CH₃, -CH₂OP(O)(OH)₂, -CH₂F, -CHF₂, -CH₂NH₂, -CH₂NHSO₂CH₃, -CH₂NHCH₃, -CH₂N(CH₃)₂, -CF₃, -CH₂CF₃, -CH₂CHF₂, -CH(CH₃)CN, -C(CH₃)₂CN, -CH₂CN, -CO₂H, -COCH₃, -CO₂CH₃, -CO₂C(CH₃)₃, -COCH(OH)CH₃, -CONH₂, -CONHCH₃, -CONHCH₂CH₃, -CONHCH(CH₃)₂, -CON(CH₃)₂, -C(CH₃)₂CONH₂, -NH₂, -NHCH₃, -N(CH₃)₂, -NHCOCH₃, -N(CH₃)COCH₃, -NHS(O)₂CH₃, -N(CH₃)C(CH₃)₂CONH₂, -N(CH₃)CH₂CH₂S(O)₂CH₃, -NO₂, =O, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -OCH₂CH₂OCH₃, -OCH₂CH₂OH, -OCH₂CH₂N(CH₃)₂, -OP(O)(OH)₂, -S(O)₂N(CH₃)₂, -SCH₃, -S(O)₂CH₃, -S(O)₃H, ciclopropilo, ciclopropilamida, ciclobutilo, oxetanilo, azetidino, 1-metilazetidin-3-il)oxi, N-metil-N-oxetan-3-ilamino, azetidin-1-ilmetilo,

Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270

benciloxifenilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-1-il-metanona, piperazin-1-ilo, morfolinometilo, morfolino-metanona o morfolino;

R⁵ es H, alquilo C₁-C₉, cicloalquilo C₃-C₉, heterociclo C₃-C₉, arilo C₆-C₉, heteroarilo C₆-C₉, -(alquildiilo C₁-C₆)-(cicloalquilo C₃-C₉), -(alquildiilo C₁-C₆)-(heterociclo C₃-C₉), C(O)R^b, C(O)NR^a, SO₂R^a y SO₂NR^a, opcionalmente sustituido con uno o más de halógeno, CN, OR^a, N(R^a)₂, alquilo C₁-C₉, cicloalquilo C₃-C₉, heterociclo C₃-C₉, arilo C₆-C₉, heteroarilo C₆-C₉, C(O)R^b, C(O)NR^a, SO₂R^a y SO₂NR^a;

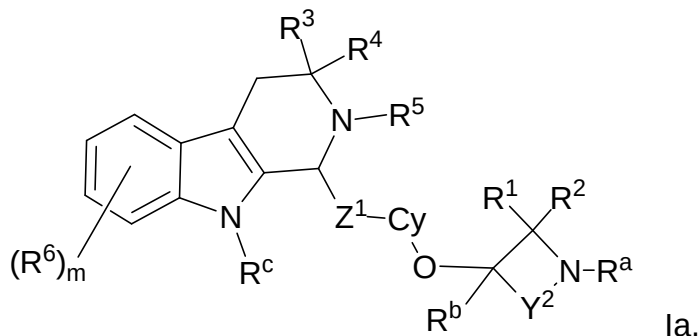
R⁶ es F, Cl, Br, I, -CN, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH(CH₃)₂, -CH₂CH(CH₃)₂, -CH₂OH, -CH₂OCH₃, -CH₂CH₂OH, -C(CH₃)₂OH, -CH(OH)CH(CH₃)₂, -C(CH₃)₂CH₂OH, -CH₂CH₂SO₂CH₃, -CH₂OP(O)(OH)₂, -CH₂F, -CHF₂, -CH₂NH₂, -CH₂NHSO₂CH₃, -CH₂NHCH₃, -CH₂N(CH₃)₂, -CF₃, -CH₂CF₃, -CH₂CHF₂, -CH₂CH₂F, -CH(CH₃)CN, -C(CH₃)₂CN, -CH₂CN, -CO₂H, -COCH₃, -CO₂CH₃, -CO₂C(CH₃)₃, -COCH(OH)CH₃, -CONH₂, -CONHCH₃, -CONHCH₂CH₃, -CONHCH(CH₃)₂, -CON(CH₃)₂, -C(CH₃)₂CONH₂, -NH₂, -NHCH₃, -N(CH₃)₂, -NHCOCH₃, -N(CH₃)COCH₃, -NHS(O)₂CH₃, -N(CH₃)C(CH₃)₂CONH₂, -N(CH₃)CH₂CH₂S(O)₂CH₃, -NO₂, =O, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -OCH₂CH₂OCH₃, -OCH₂CH₂OH, -OCH₂CH₂N(CH₃)₂, -OP(O)(OH)₂, -S(O)₂N(CH₃)₂, -SCH₃, -S(O)₂CH₃, -S(O)₃H, ciclopropilo, ciclopropilamida, ciclobutilo, oxetanilo, azetidino, 1-metilazetidin-3-il)oxi, N-metil-N-oxetan-3-ilamino, azetidin-1-ilmetilo, benciloxifenilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-1-il-metanona, piperazin-1-ilo, morfolinometilo, morfolino-metanona o morfolino; y m es 0, 1, 2, 3 o 4;

en donde alquildiilo, fluoralquildiilo, arildiilo, carbocicildiilo, heterocicildiilo y heteroarildiilo están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos seleccionados independientemente del grupo que consiste de F, Cl, Br, I, -CN, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH(CH₃)₂, -CH₂CH(CH₃)₂, -CH₂OH, -CH₂OCH₃, -CH₂CH₂OH, -C(CH₃)₂OH, -CH(OH)CH(CH₃)₂, -C(CH₃)₂CH₂OH, -CH₂CH₂SO₂CH₃, -CH₂OP(O)(OH)₂, -CH₂F, -CHF₂, -CF₃, -CH₂CF₃, -CH₂CHF₂, -CH₂CH₂F, -CH(CH₃)CN, -C(CH₃)₂CN, -CH₂CN, -CH₂NH₂, -CH₂NHSO₂CH₃, -CH₂NHCH₃, -CH₂N(CH₃)₂, -CO₂H, -COCH₃, -CO₂CH₃, -CO₂C(CH₃)₃, -COCH(OH)CH₃, -CONH₂, -CONHCH₃, -CON(CH₃)₂, -C(CH₃)₂CONH₂, -NH₂, -NHCH₃, -N(CH₃)₂, -NHCOCH₃, -N(CH₃)COCH₃, -NHS(O)₂CH₃, -N(CH₃)C(CH₃)₂CONH₂, -N(CH₃)CH₂CH₂S(O)₂CH₃, -NO₂, =O, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -OCH₂CH₂OCH₃, -OCH₂CH₂OH, -OCH₂CH₂N(CH₃)₂, -OP(O)(OH)₂, -S(O)₂N(CH₃)₂, -SCH₃, -S(O)₂CH₃, -S(O)₃H, ciclopropilo, ciclopropilamida, ciclobutilo, oxetanilo, azetidino, 1-metilazetidin-3-il)oxi, N-metil-N-oxetan-3-ilamino, azetidin-1-ilmetilo, benciloxifenilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-1-il-metanona, piperazin-1-ilo, morfolinometilo, morfolino-metanona y morfolino.

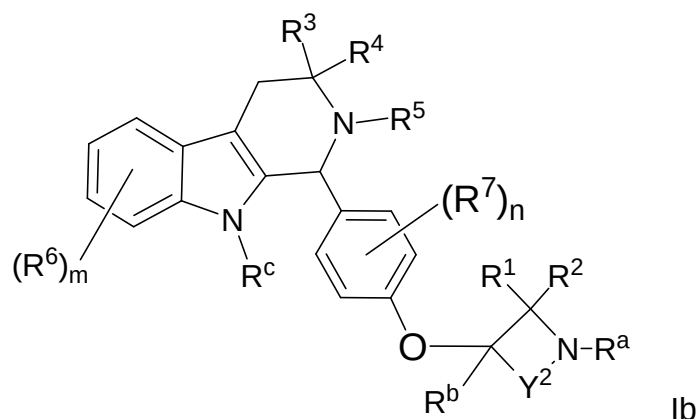
2. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la fórmula la:

Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



3. El compuesto de la reivindicación 2 que tiene la fórmula Ib:

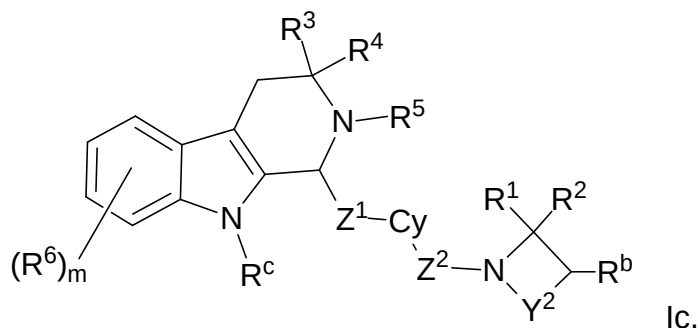


en la que R⁷ es F, Cl, Br, I, -CN, -CH₃, -CH₂CH₃, -CH(CH₃)₂, -CH₂CH(CH₃)₂, -CH₂OH, -CH₂OCH₃, -CH₂CH₂OH, -C(CH₃)₂OH, -CH(OH)CH(CH₃)₂, -C(CH₃)₂CH₂OH, -CH₂CH₂SO₂CH₃, -CH₂OP(O)(OH)₂, -CH₂F, -CHF₂, -CH₂NH₂, -CH₂NHSO₂CH₃, -CH₂NHCH₃, -CH₂N(CH₃)₂, -CF₃, -CH₂CF₃, -CH₂CHF₂, -CH(CH₃)CN, -C(CH₃)₂CN, -CH₂CN, -CO₂H, -COCH₃, -CO₂CH₃, -CO₂C(CH₃)₃, -COCH(OH)CH₃, -CONH₂, -CONHCH₃, -CONHCH₂CH₃, -CONHCH(CH₃)₂, -CON(CH₃)₂, -C(CH₃)₂CONH₂, -NH₂, -NHCH₃, -N(CH₃)₂, -NHCOCH₃, -N(CH₃)COCH₃, -NHS(O)₂CH₃, -N(CH₃)C(CH₃)₂CONH₂, -N(CH₃)CH₂CH₂S(O)₂CH₃, -NO₂, =O, -OH, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -OCH₂CH₂OCH₃, -OCH₂CH₂OH, -OCH₂CH₂N(CH₃)₂, -OP(O)(OH)₂, -S(O)₂N(CH₃)₂, -SCH₃, -S(O)₂CH₃, -S(O)₃H, ciclopropilo, ciclopropilamida, oxetanilo, azetidino, 1-metilazetidin-3-il)oxi, N-metil-N-oxetan-3-ilamino, azetidin-1-ilmetilo, benciloxifenilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-1-il-metanona, piperazin-1-ilo, morfolinometilo, morfolino-metanona o morfolino; y
n es 0, 1, 2, 3 o 4.

4. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la fórmula Ic:

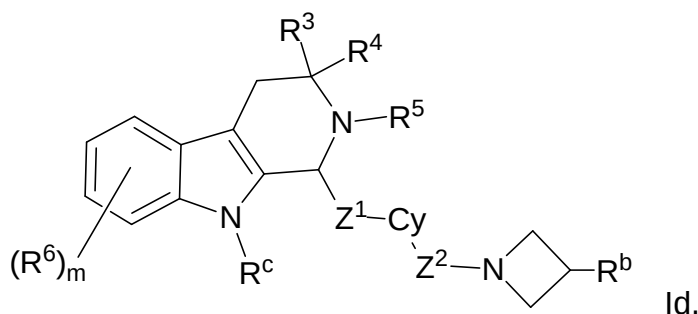
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



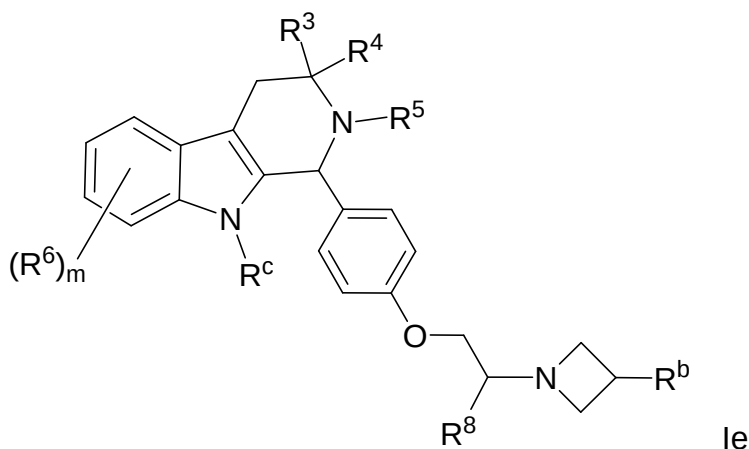
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en la que Z² es O- (alquildiilo C₁-C₆).

5. El compuesto de la reivindicación 4 que tiene la fórmula Id:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en la que Z² es O- (alquildiilo C₁-C₆).

6. El compuesto de la reivindicación 5 que tiene la fórmula le:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en el que R⁸ es H o -CH₃.

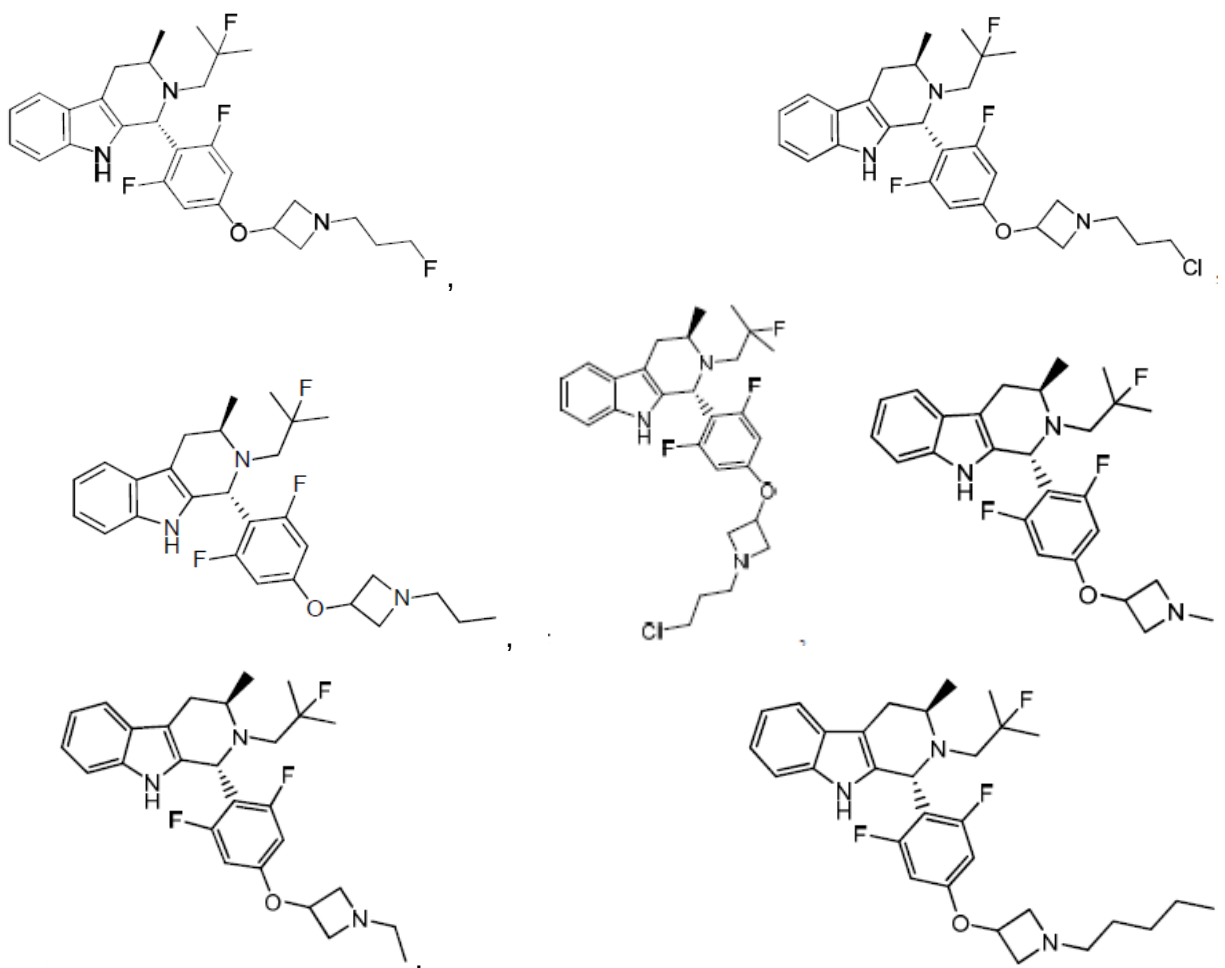
7. El compuesto de la reivindicación 1, en el que Y¹ es CR^b e Y³ es NR^a.
8. El compuesto de la reivindicación 1, en el que Y¹ es N e Y³ es C(R^b)₂.
9. El compuesto de la reivindicación 1, en el que Y² es -(CH₂)- o -(CH₂CH₂)-.



Resolución N° 16076

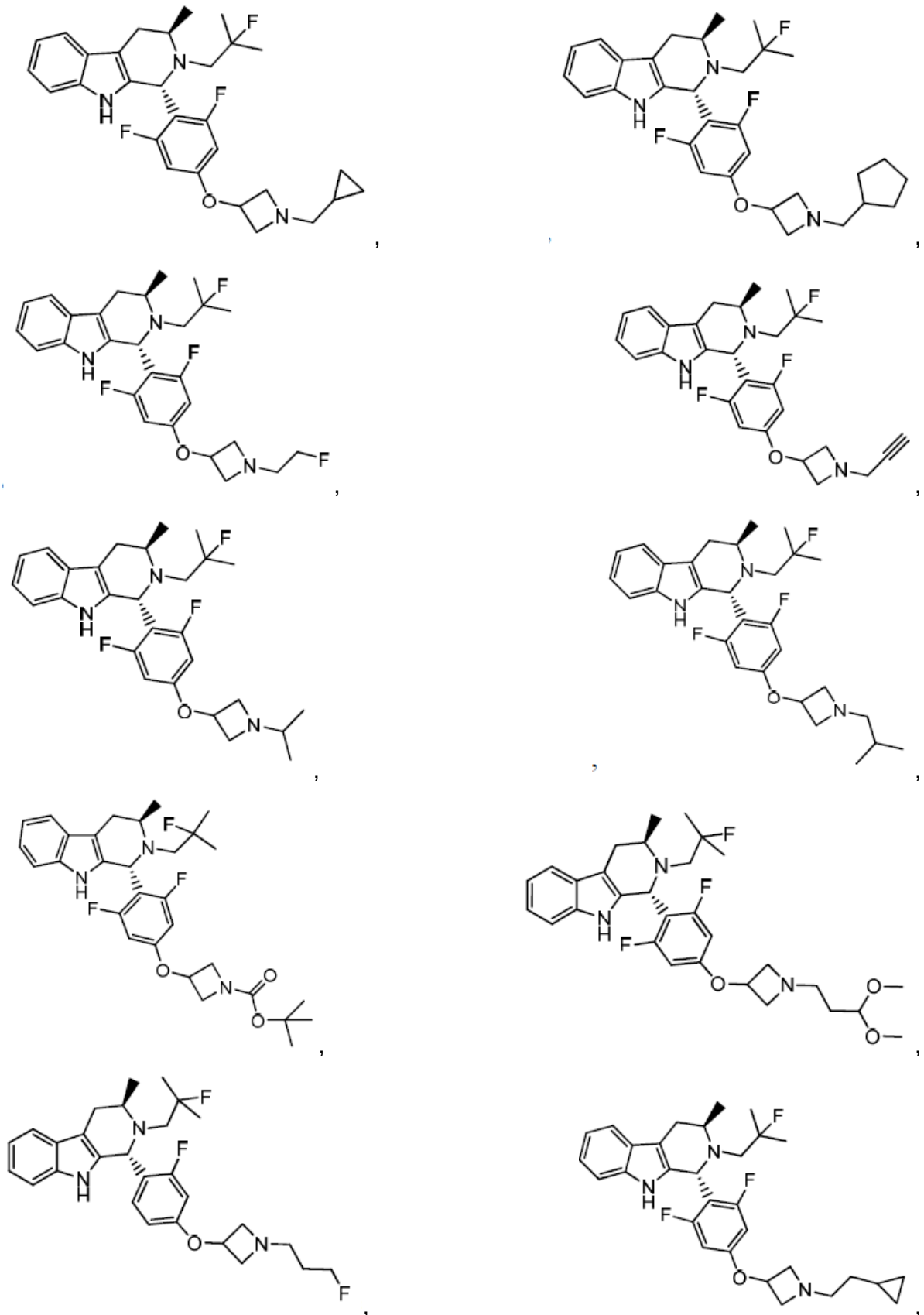
Ref. Expediente N° NC2020/0011270

10. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R^c es H.
11. El compuesto de la reivindicación 1, en el que Cy es fenildiilo.
12. El compuesto de la reivindicación 11, en el que el fenildiilo está sustituido con uno o más F.
13. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R¹ y R² son H.
14. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R³ es H y R⁴ es –CH₃.
15. El compuesto de la reivindicación 1, en el que R⁵ es fluoralquilo C₁–C₆.
16. El compuesto de la reivindicación 1, en el que m es 0.
17. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la fórmula:



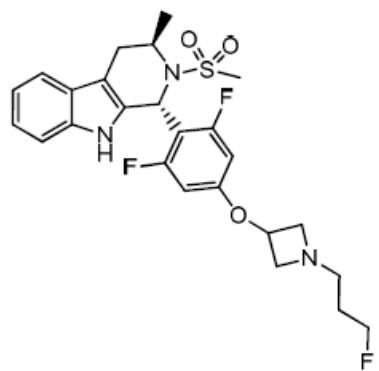
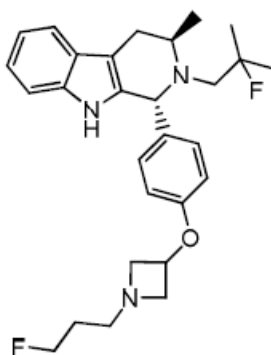
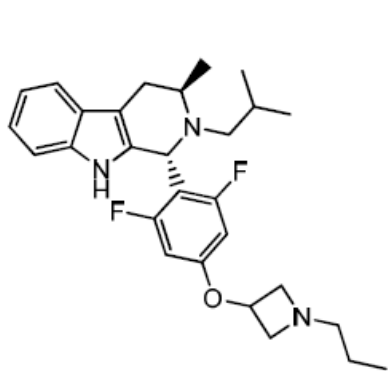
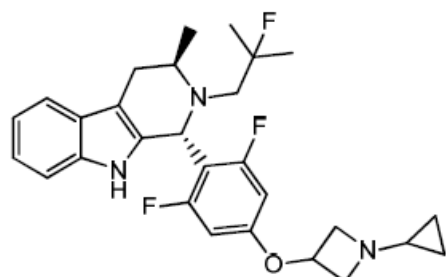
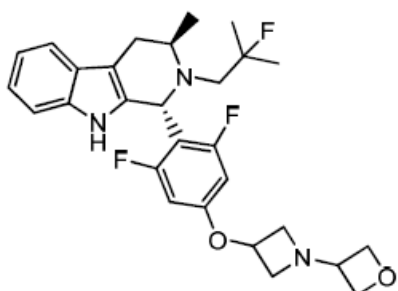
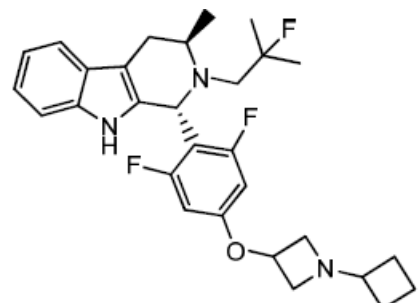
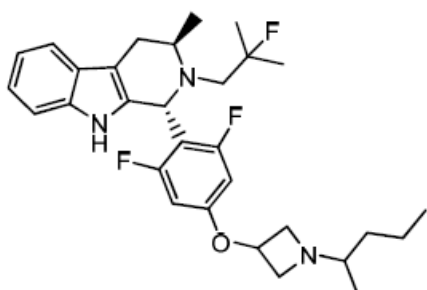
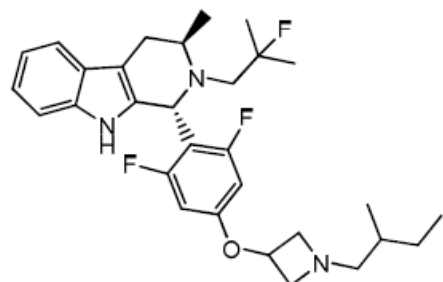
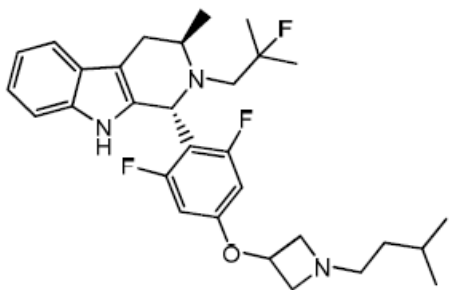
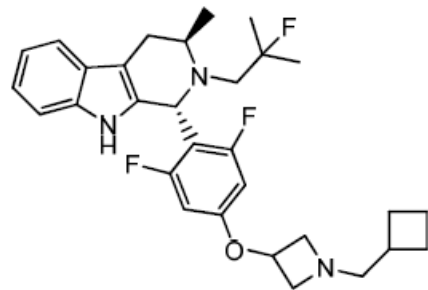
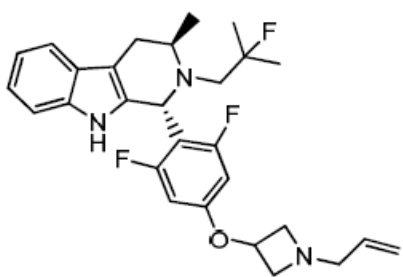
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



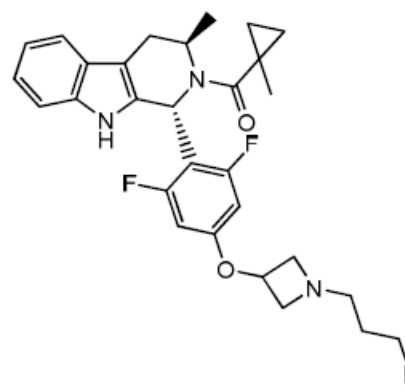
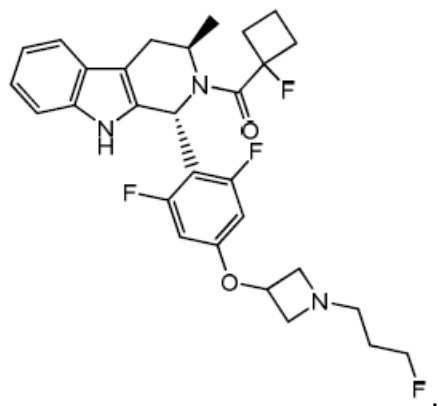
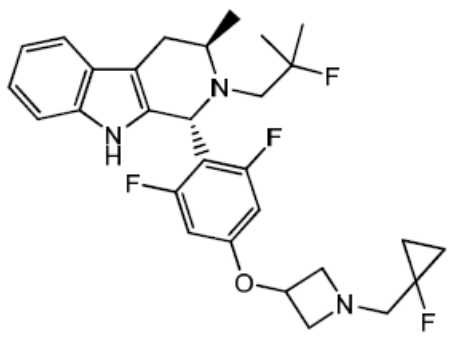
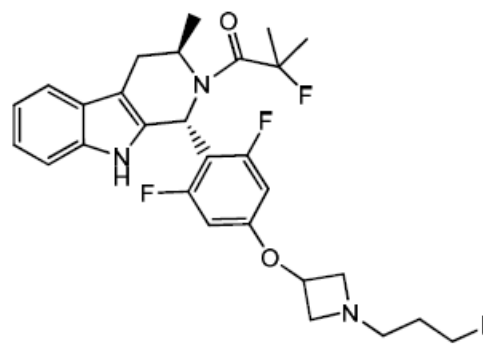
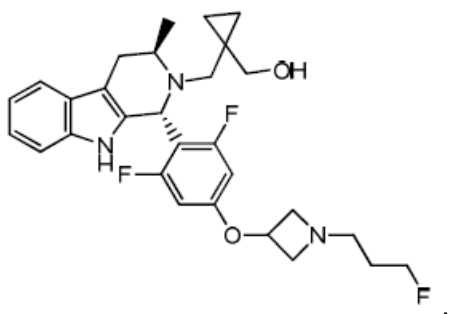
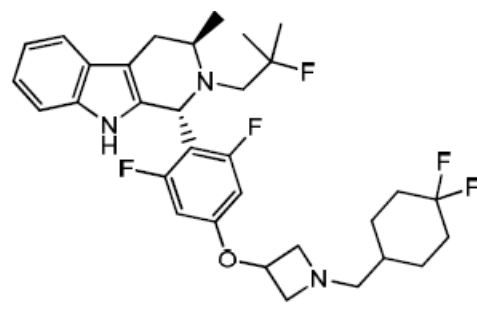
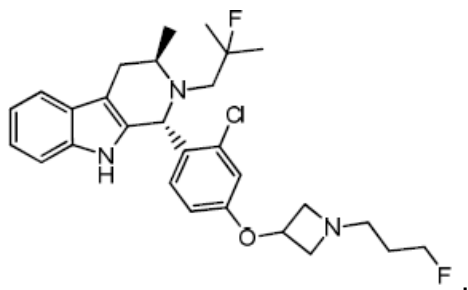
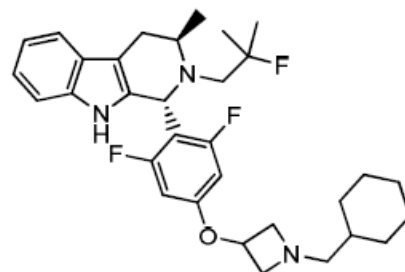
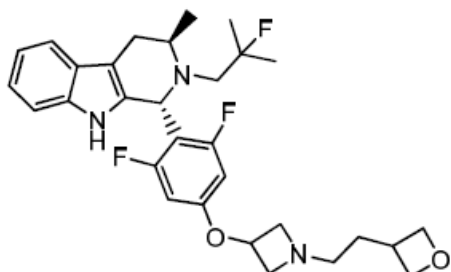
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



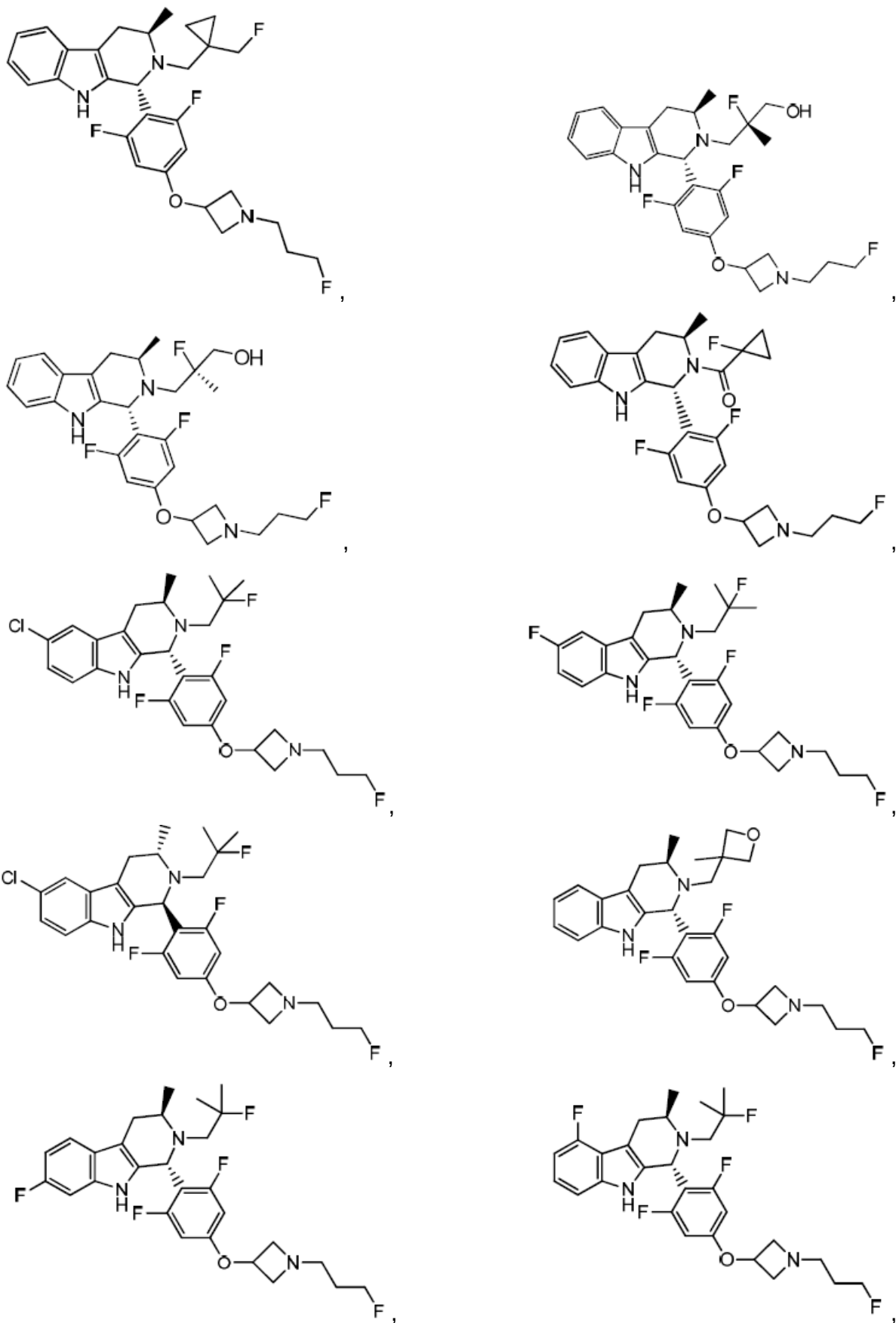
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



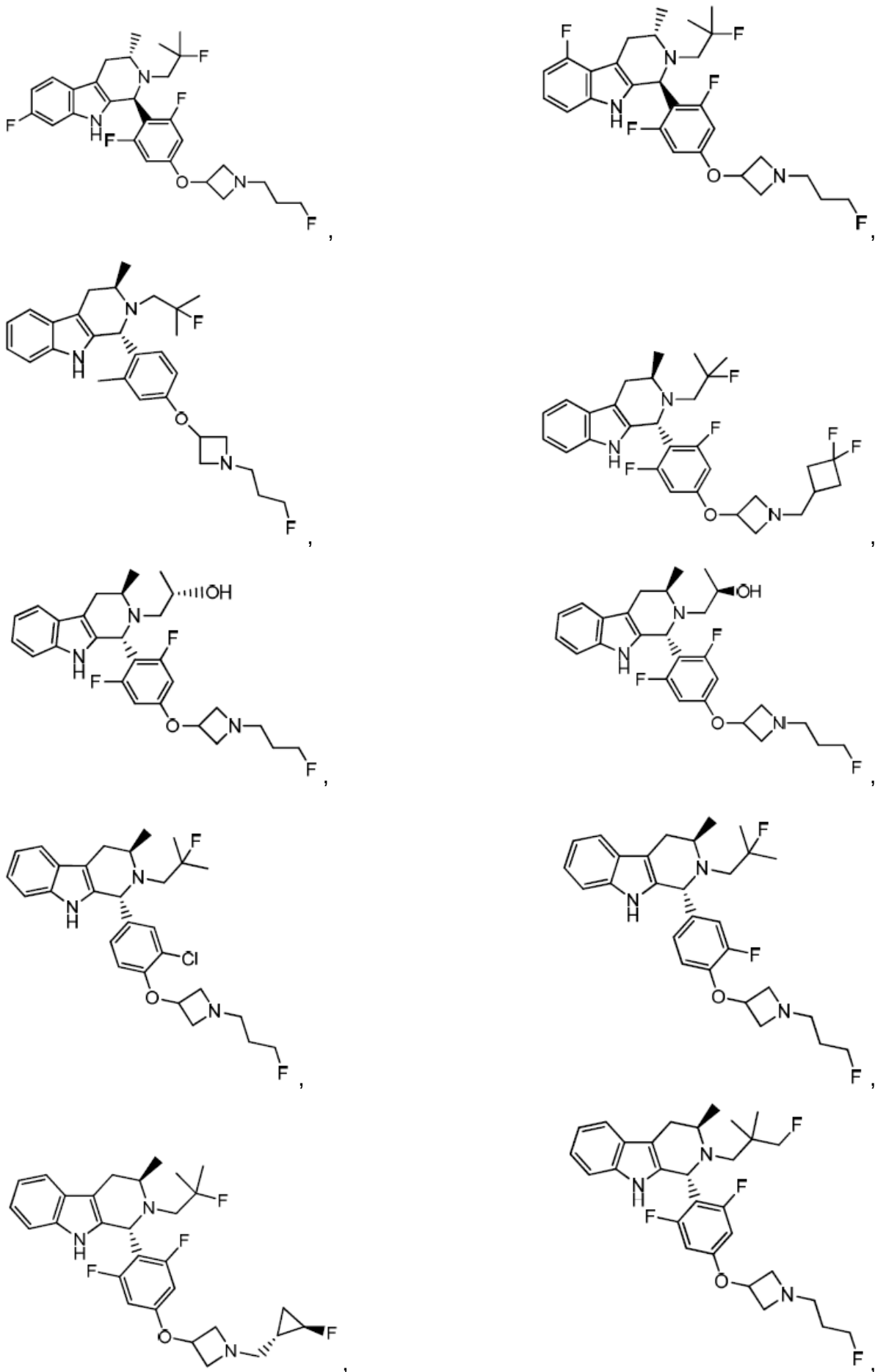
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



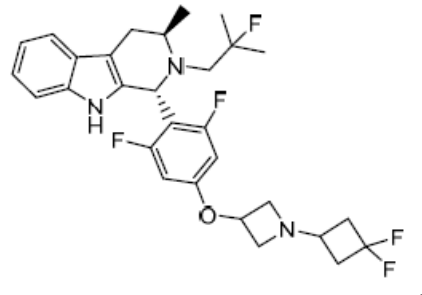
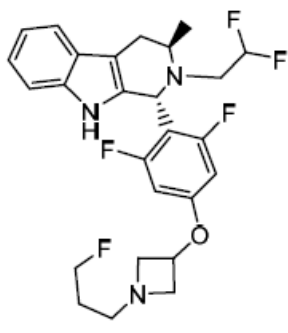
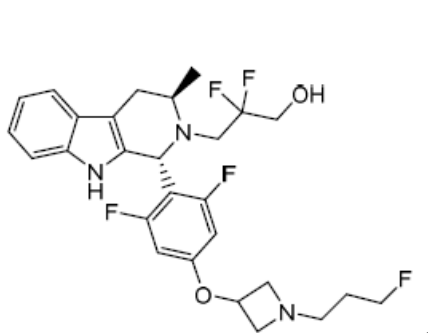
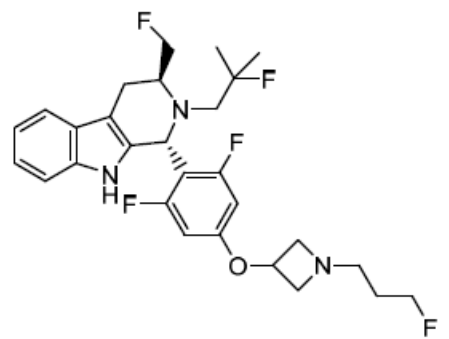
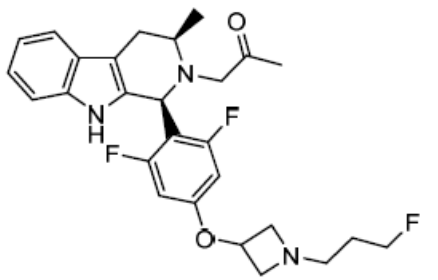
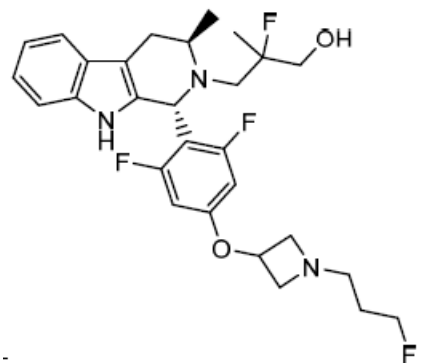
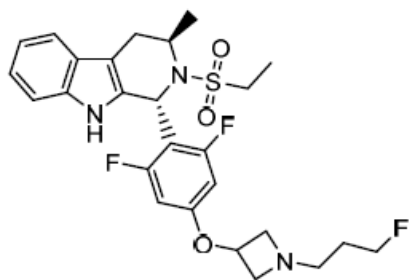
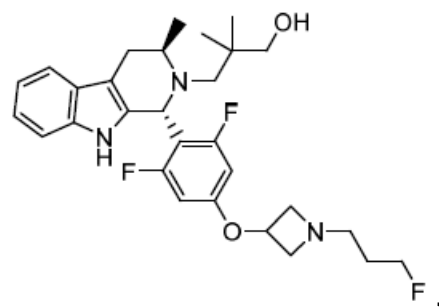
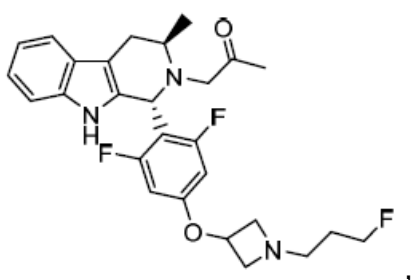
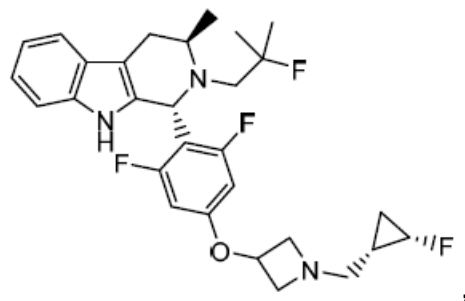
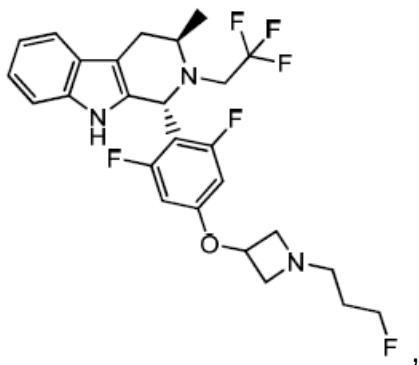
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



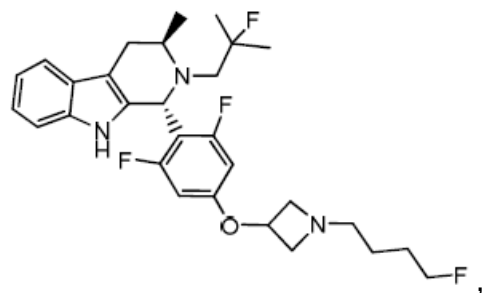
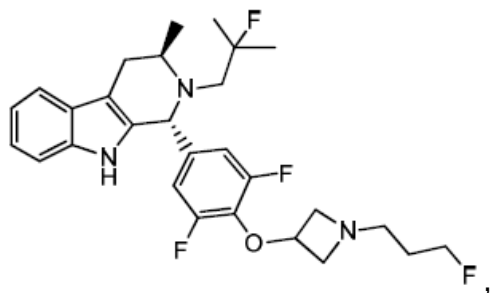
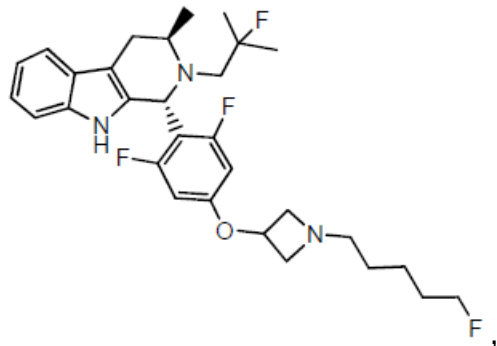
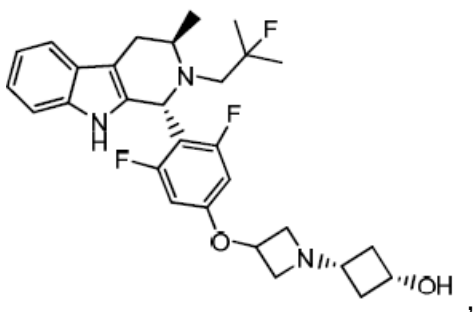
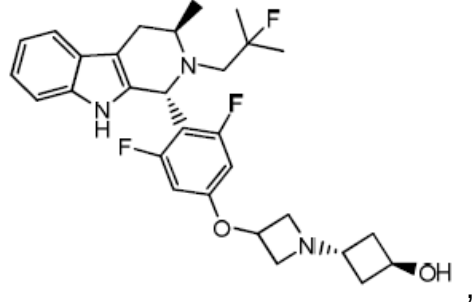
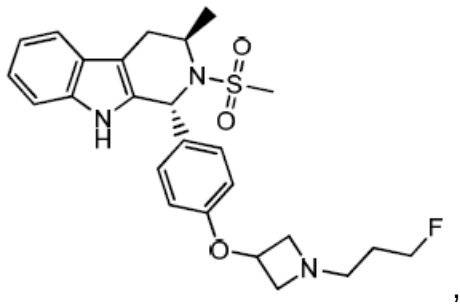
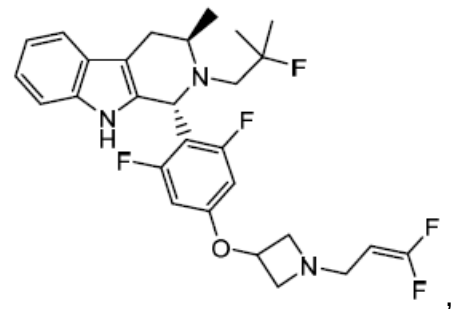
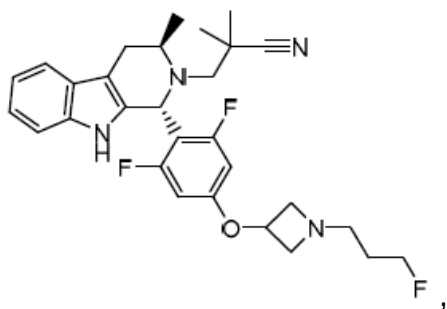
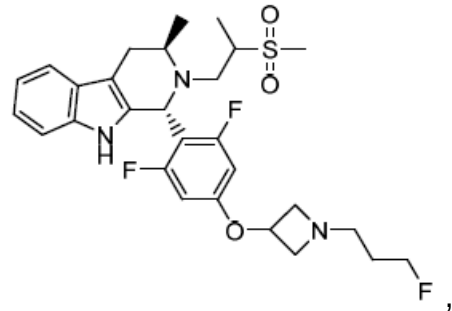
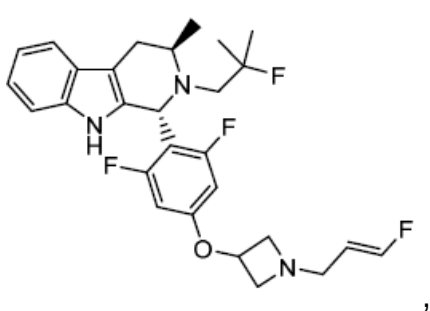
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



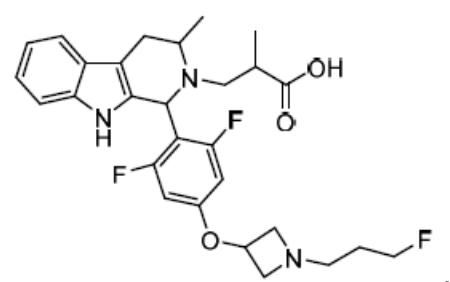
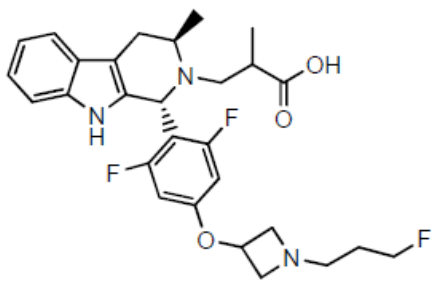
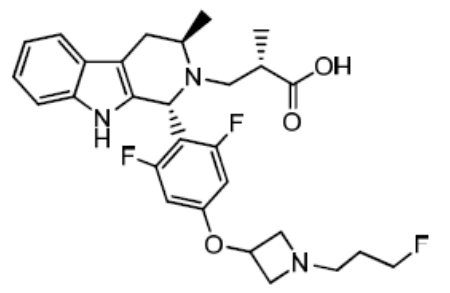
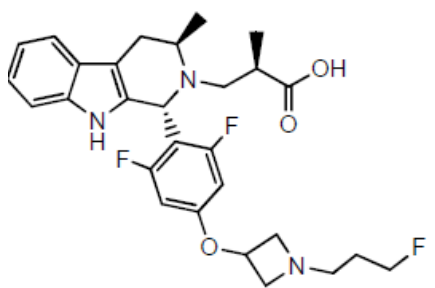
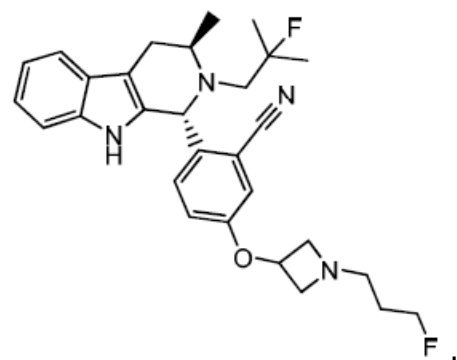
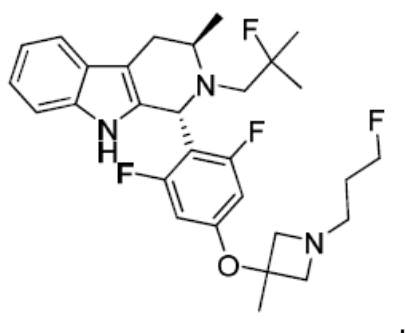
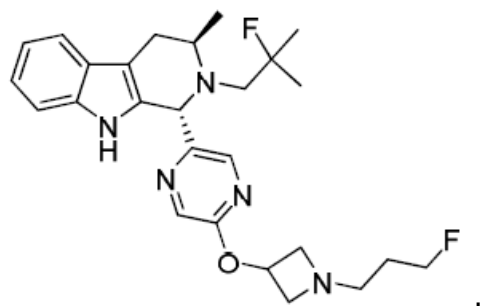
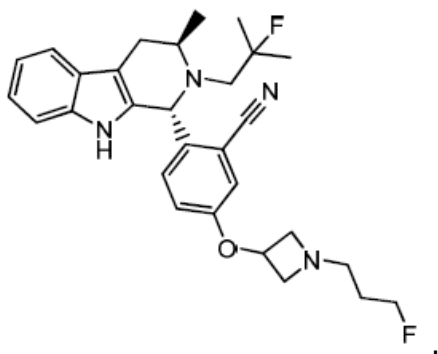
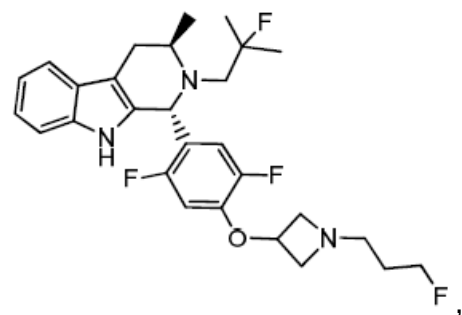
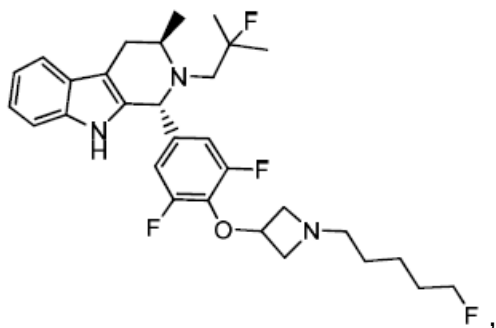
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



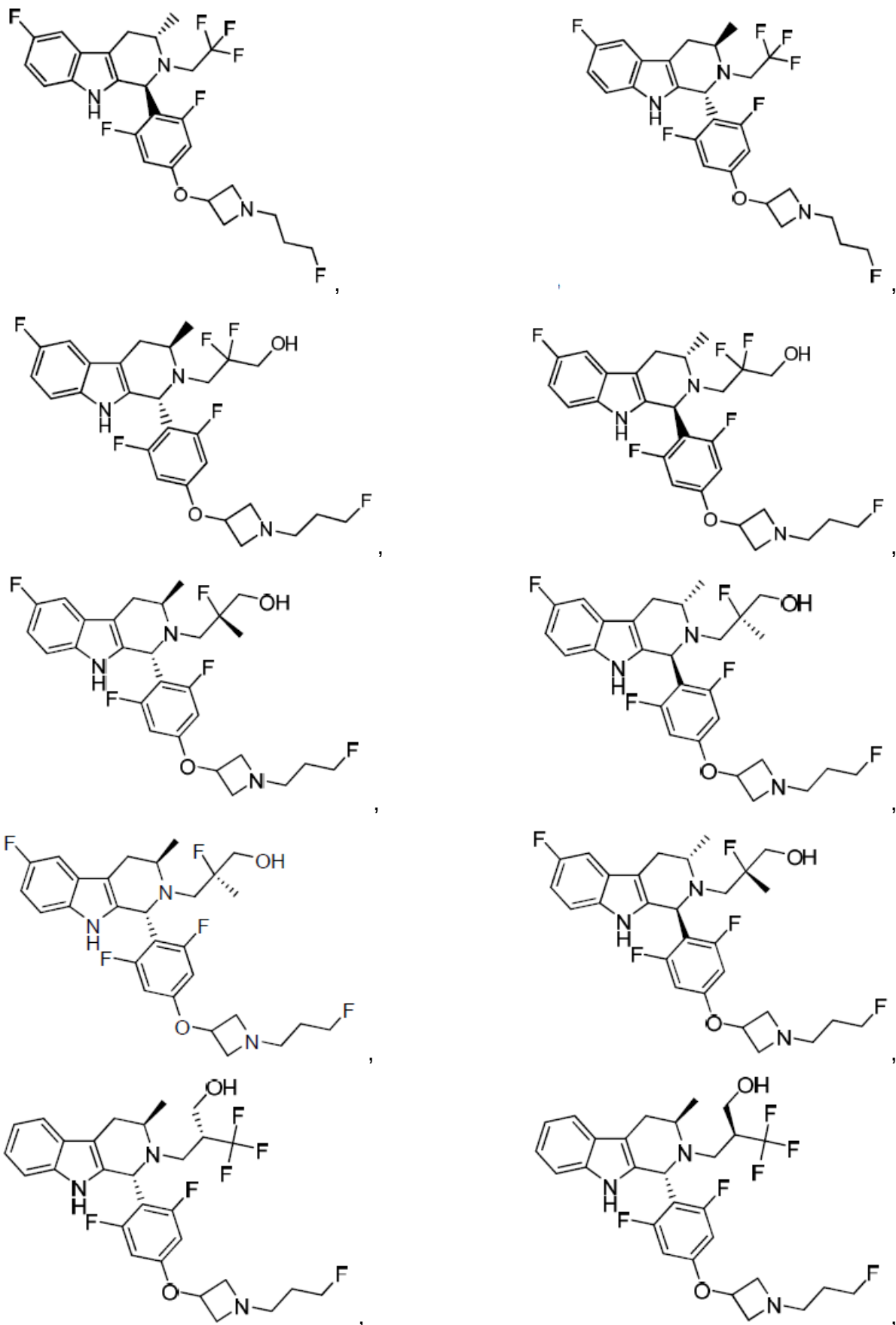
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



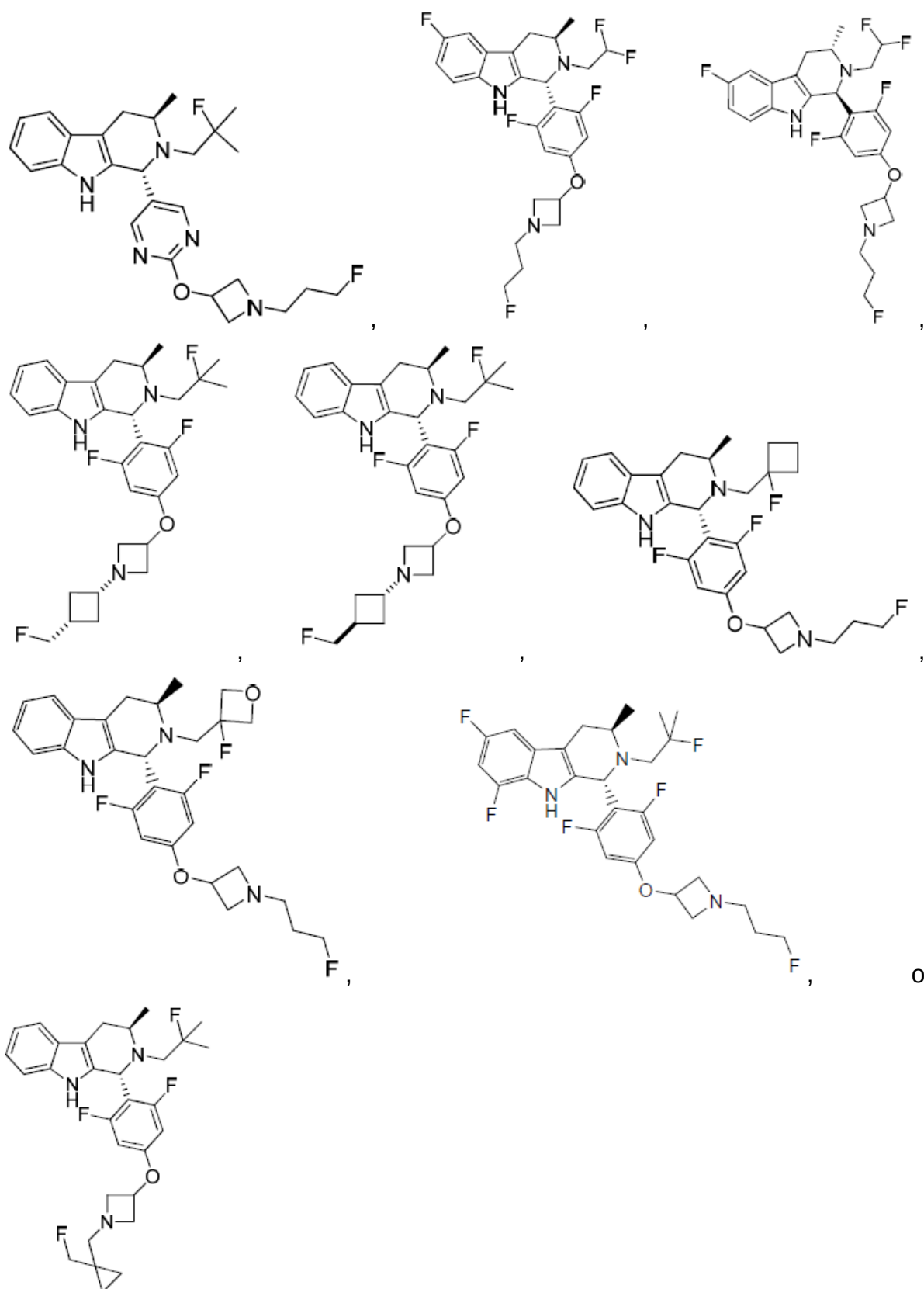
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



Resolución N° 16076

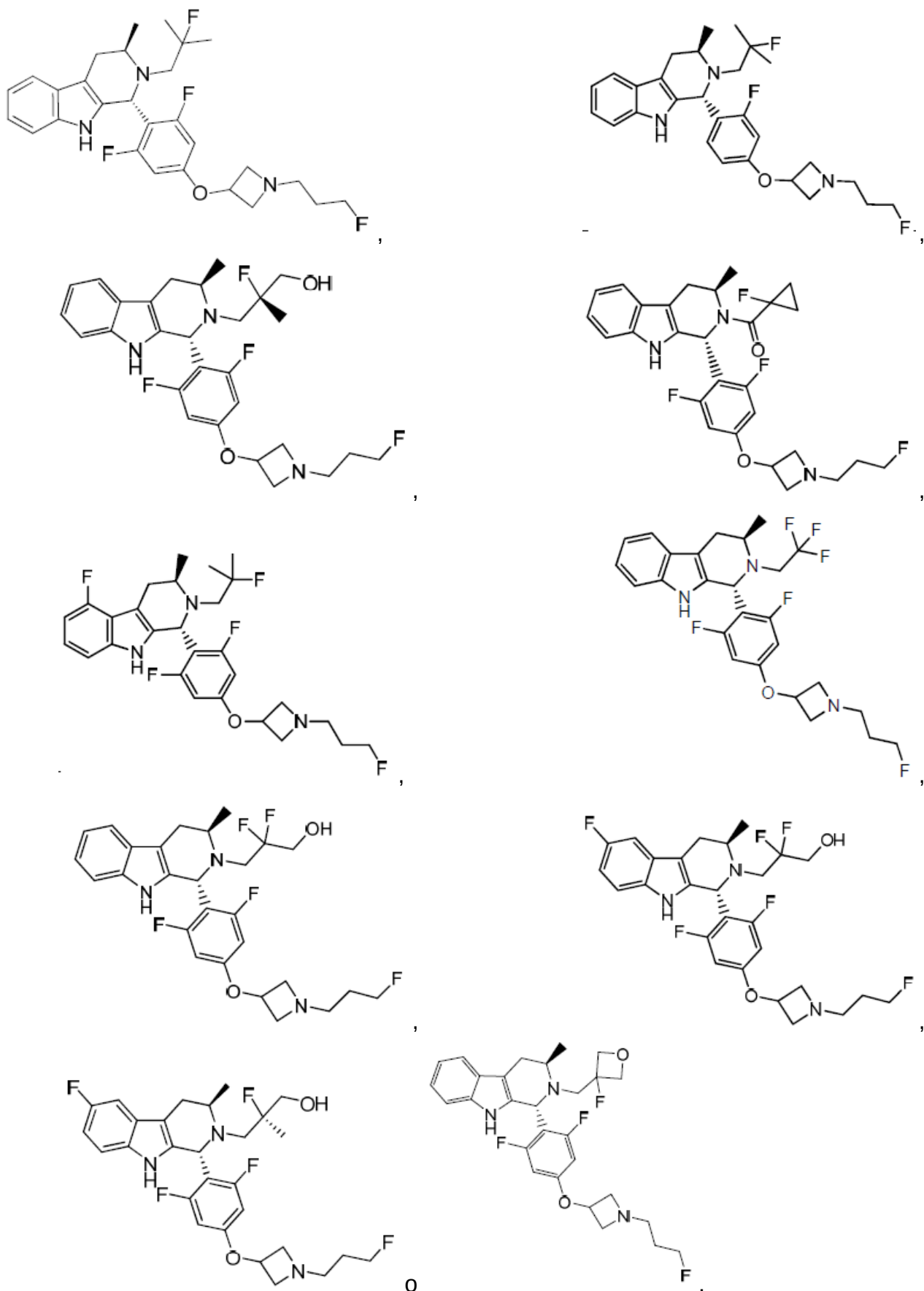
Ref. Expediente N° NC2020/0011270



18. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270

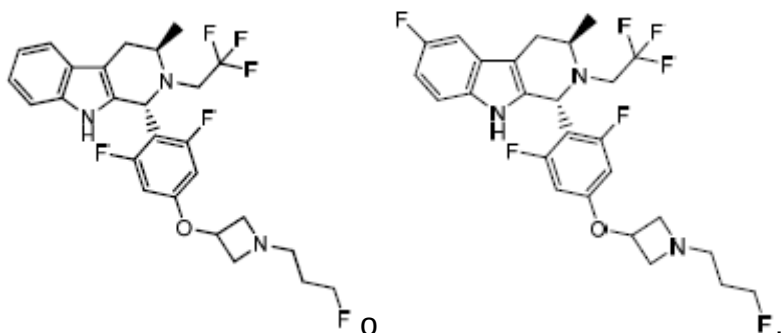


19. Una composición farmacéutica que contiene un compuesto de la reivindicación 1 y al menos un excipiente farmacéuticamente aceptable.

Resolución N° 16076

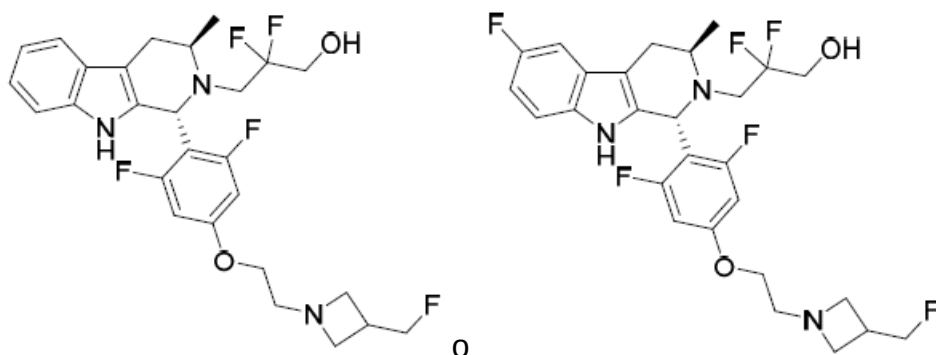
Ref. Expediente N° NC2020/0011270

20. El compuesto de la reivindicación 1, en donde el compuesto es:



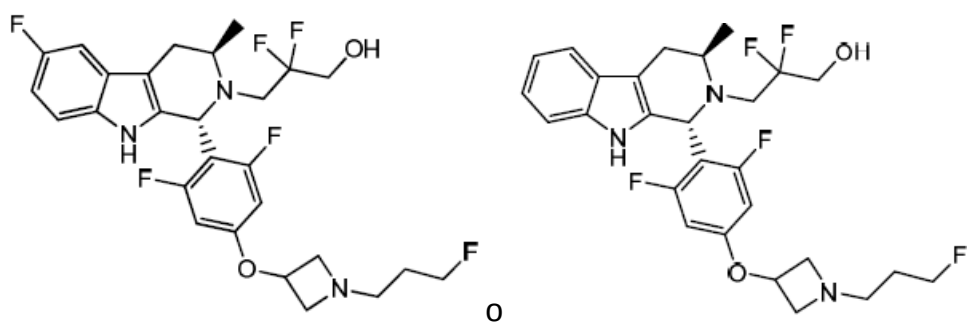
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

21. El compuesto de la reivindicación 1, en donde el compuesto es:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

22. El compuesto de la reivindicación 1, en donde el compuesto es:

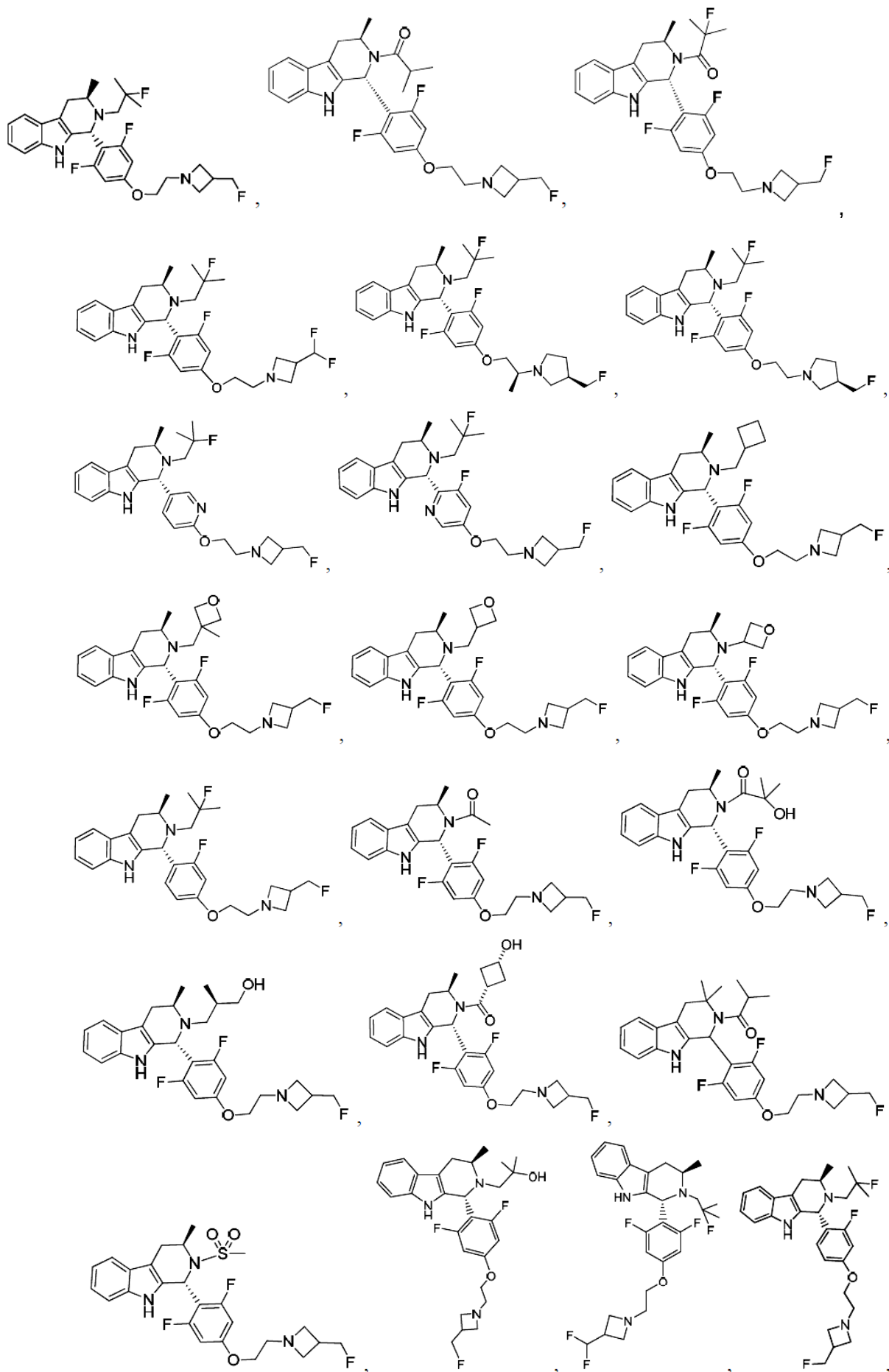


o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

23. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

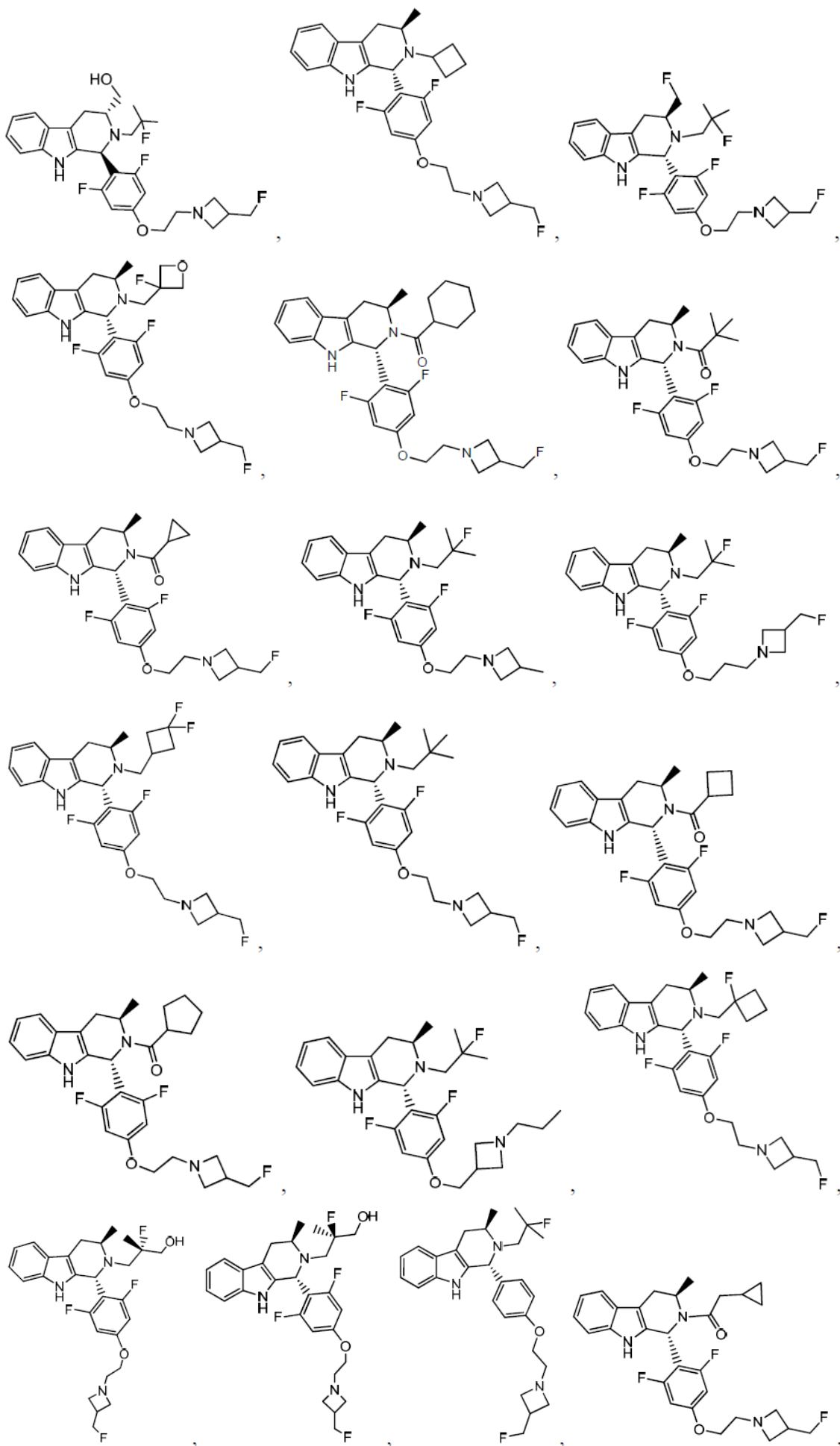
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



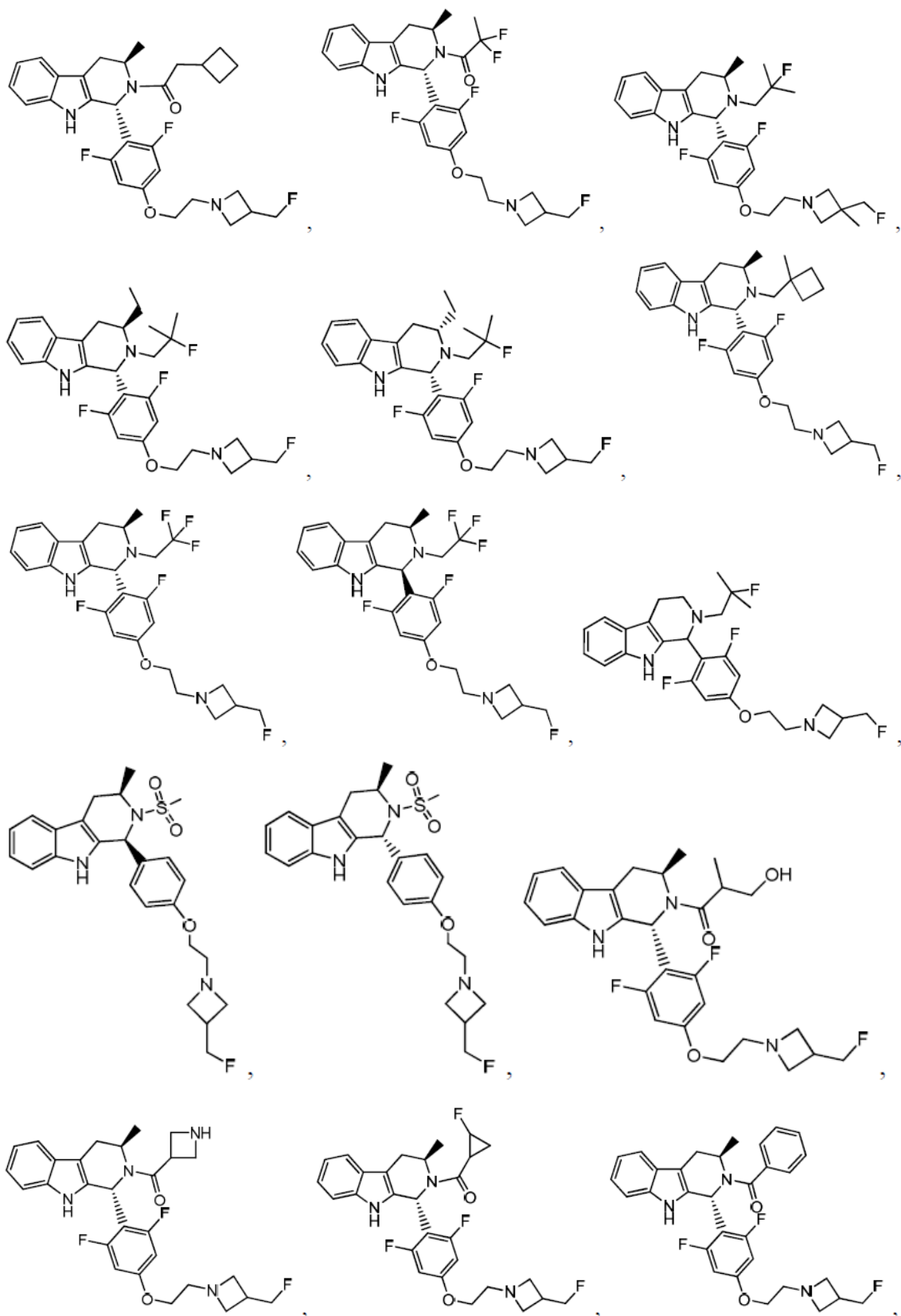
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



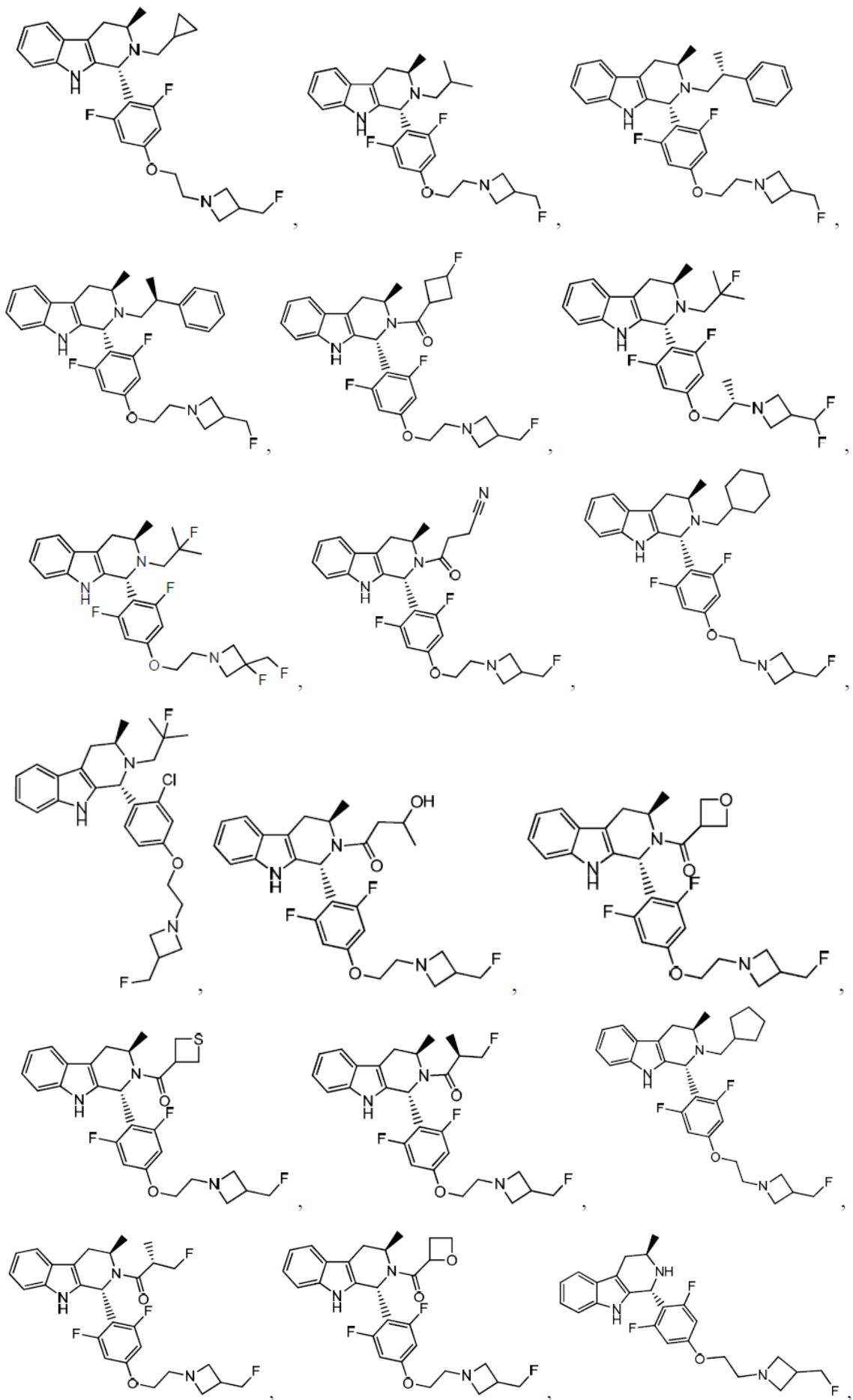
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



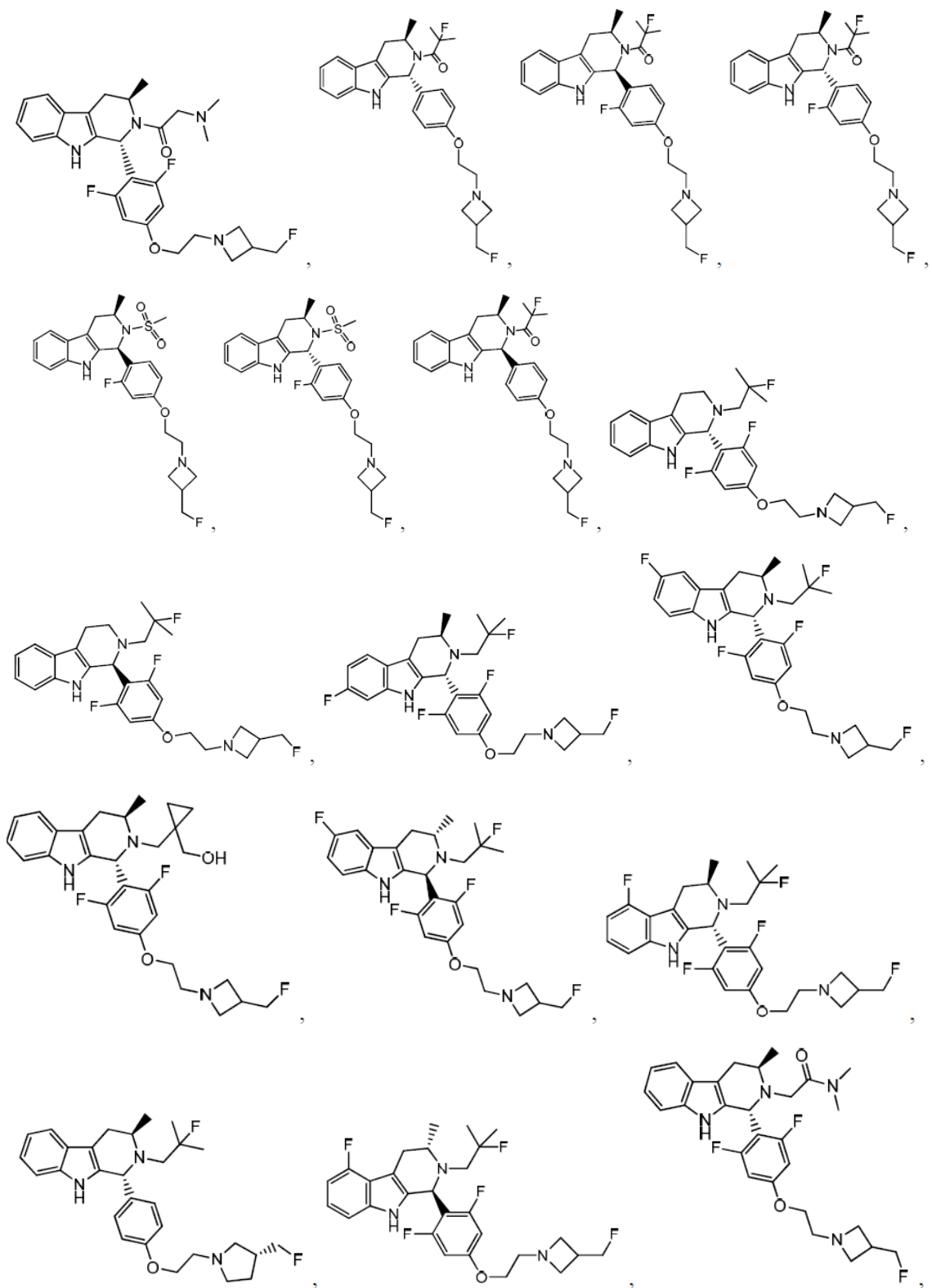
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



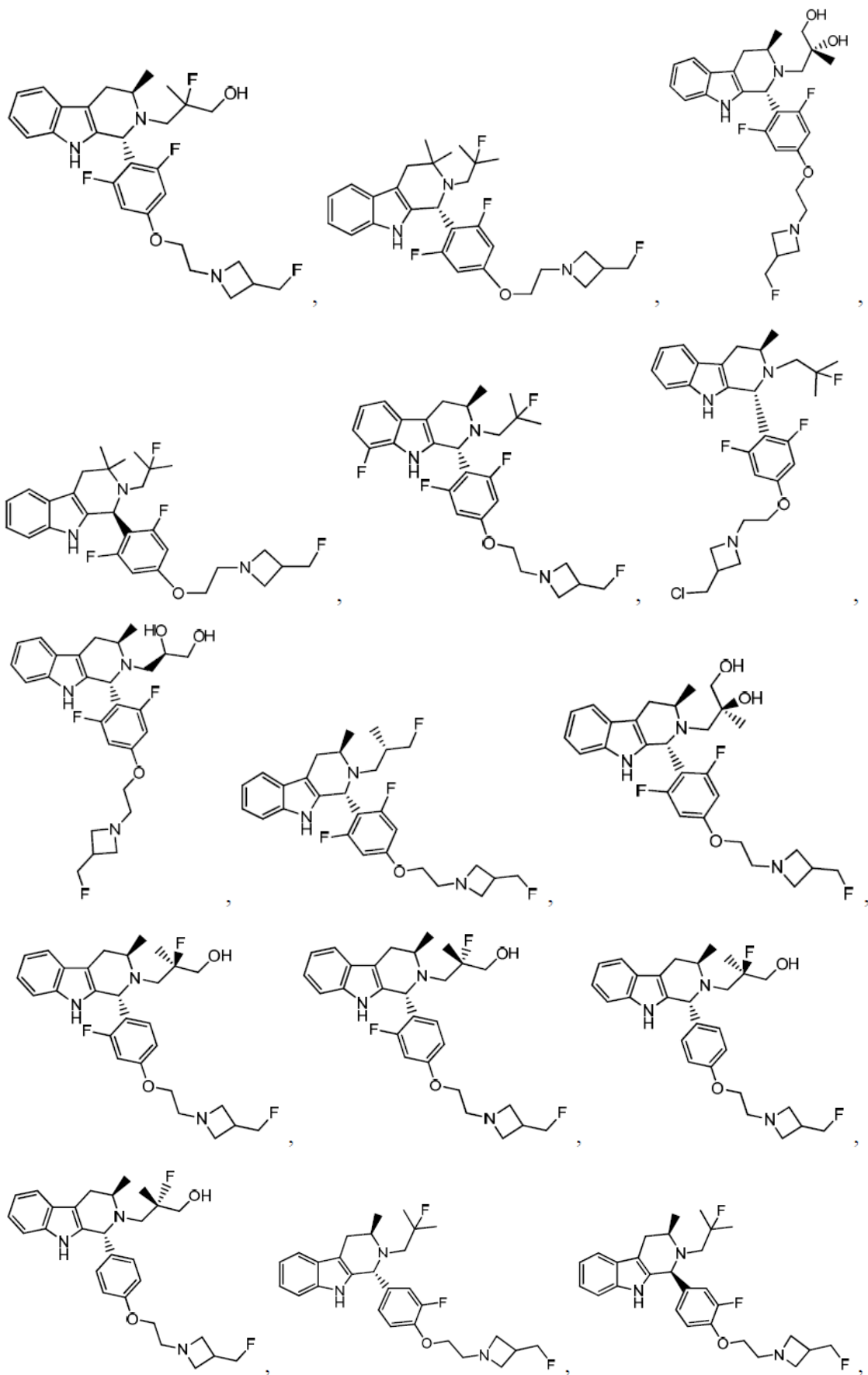
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



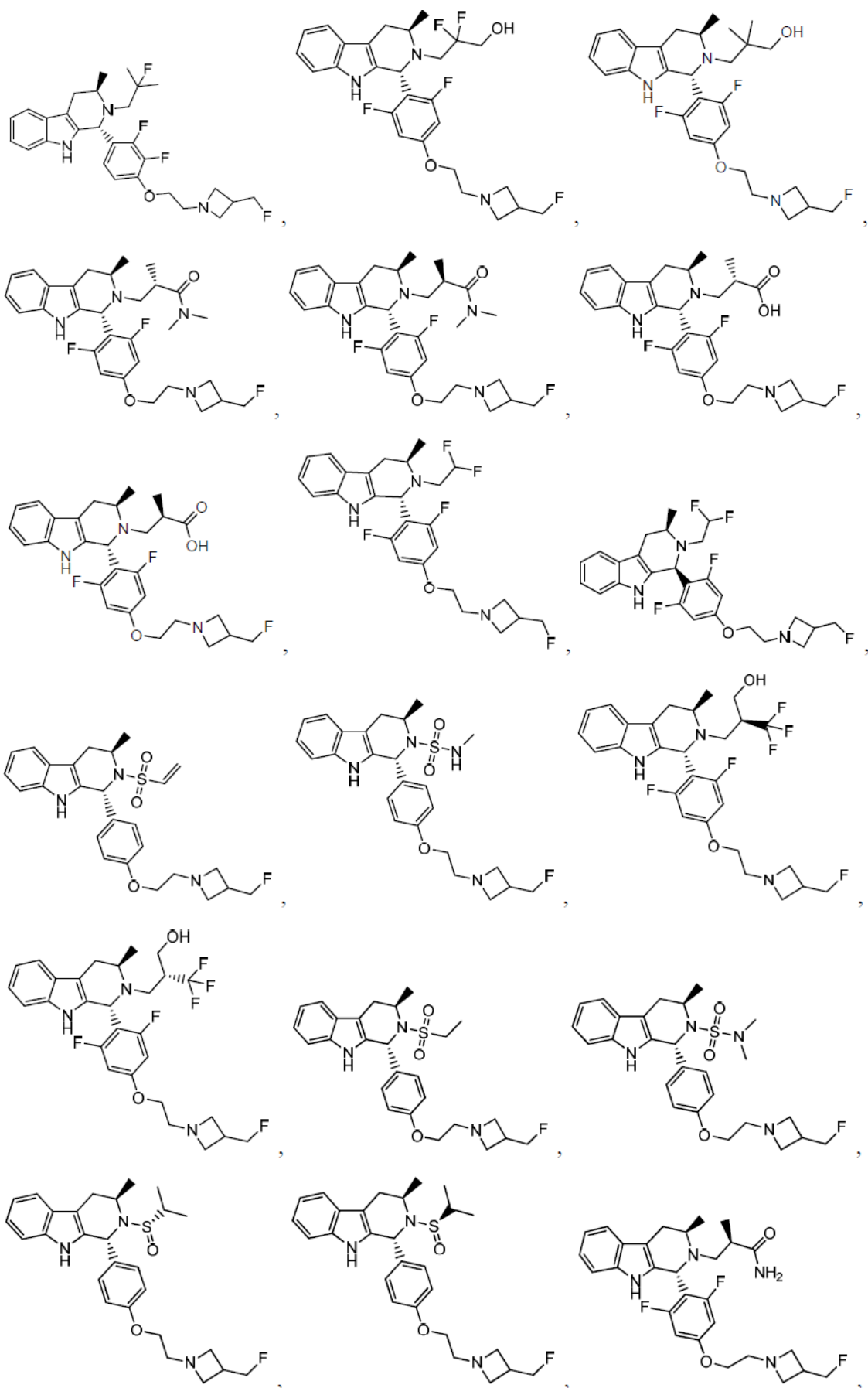
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



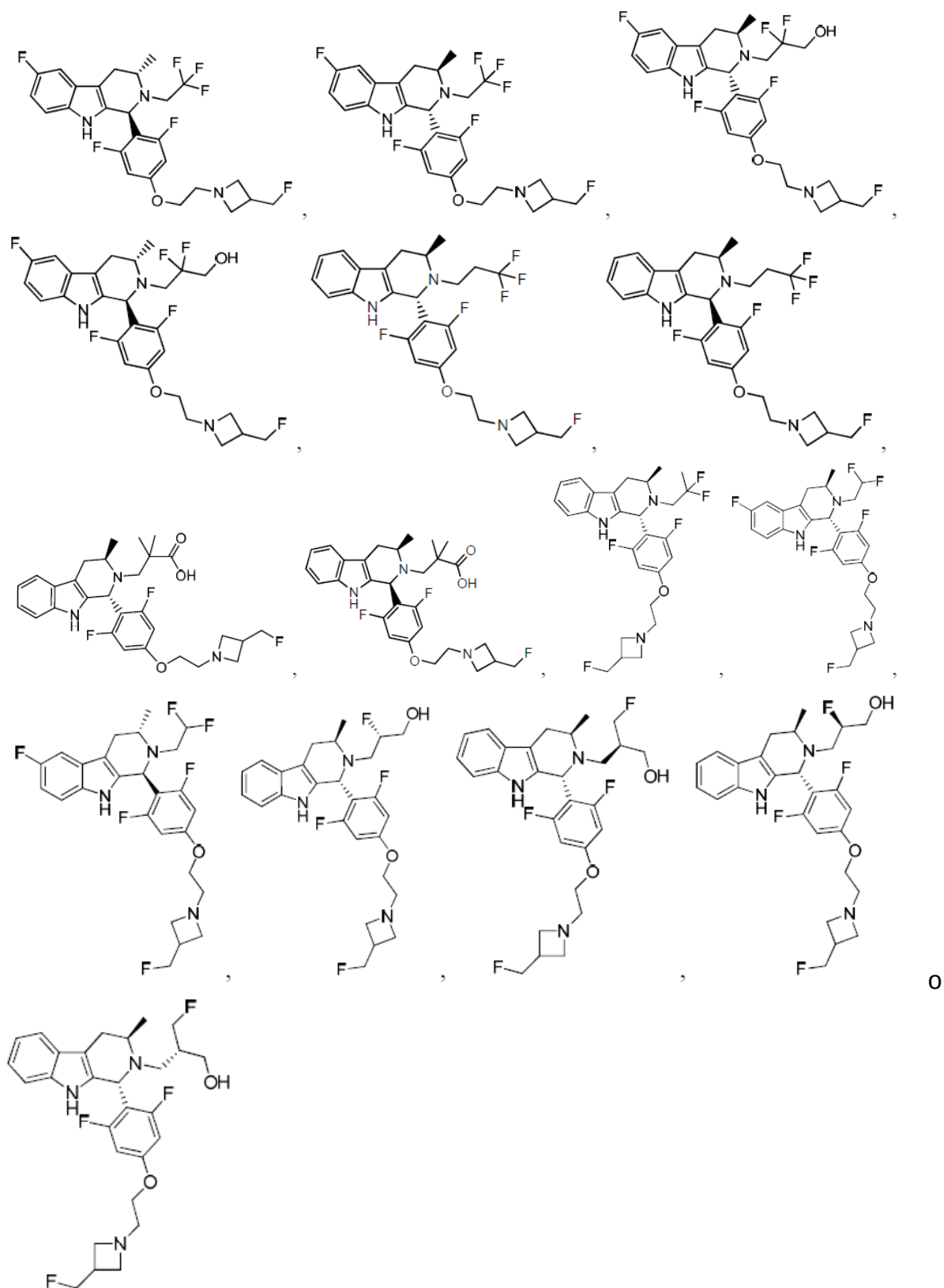
Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270



24. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la fórmula:

Resolución N° 16076

Ref. Expediente N° NC2020/0011270

