

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 4807

Ref. Expediente N° NC2019/0012494

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:

Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 7 de noviembre de 2019, con el N° NC2019/0012494, por BRISTOL - MYERS SQUIBB COMPANY, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "TIENOPIRIDINAS Y BENZOTIOFENOS ÚTILES COMO INHIBIDORES DE QUINASA 4 ASOCIADA AL RECEPTOR DE INTERLEUCINA 1 (IRAK4)", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2018/031945 del 10 de mayo de 2018.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 883 el 17 de enero de 2020, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 14511, notificado el 13 de septiembre de 2021, 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.

Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2019/0012494 el 9 de diciembre de 2021, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 7 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.

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."*

Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 7 incluidas en el radicado bajo el N° NC2019/0012494 el 9 de diciembre de 2021, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que se refieren a compuestos derivados de 3-((5-oxopirrolidin-2-il) metoxi) tienopiridin/benzotiofen-6-carboxamida, que difieren del estado de la técnica más cercano, WO/2016/144849, en la inclusión del núcleo tieno[3,2-*b*]piridina, tieno[2,3-*b*]piridina o benzo[*b*]tiofeno en lugar del sistema de anillos tieno[3,2-*b*]pirazina, así como en la adición de los sustituyentes periféricos amida y alcoxi R₁, R₃. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto de inhibir la quinasa 4 asociada al receptor de interleucina 1 (IRAK4) a concentraciones IC₅₀ de hasta 0.0006 µM para el



Resolución N° 4807

Ref. Expediente N° NC2019/0012494

tratamiento de enfermedades proliferativas, alérgicas, autoinmunitarias o inflamatorias. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

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.

Que el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0012494 el 9 de diciembre de 2021, solicitó la modificación del título a: “DERIVADOS DE OXOPIRROLIDIN METOXI TIENOPIRIDINA/BENZOTIOFENO CARBOXAMIDA COMO INHIBIDORES DE QUINASA 4 ASOCIADA AL RECEPTOR DE INTERLEUCINA 1 Y LAS COMPOSICIONES QUE LOS CONTIENEN”, la cual no se acepta porque no incluye la posición de los sustituyentes en el nombre químico de los compuestos, ni tampoco la abreviatura “IRAK4”. Teniendo en cuenta lo anterior, el título quedará de la siguiente manera: “DERIVADOS DE 3-((5-OXOPIRROLIDIN-2-IL) METOXI) TIENOPIRIDIN/BENZOTIOFEN-6-CARBOXAMIDA COMO INHIBIDORES DE QUINASA 4 ASOCIADA AL RECEPTOR DE INTERLEUCINA 1 (IRAK4) Y LAS COMPOSICIONES QUE LOS CONTIENEN”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE

ARTÍCULO 1: 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-((5-OXOPIRROLIDIN-2-IL) METOXI)
TIENOPIRIDIN/BENZOTIOFEN-6-CARBOXAMIDA COMO INHIBIDORES DE QUINASA
4 ASOCIADA AL RECEPTOR DE INTERLEUCINA 1 (IRAK4) Y LAS COMPOSICIONES
QUE LOS CONTIENEN”**

Clasificación IPC: C07D 409/12, C07D 495/04, A61P 35/00, A61K 31/4365

Reivindicaciones: 1 a 7 incluidas en el radicado bajo el N° NC2019/0012494 el 9 de diciembre de 2021, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: BRISTOL - MYERS SQUIBB COMPANY.

Domicilio: ROUTE 206 AND PROVINCE LINE ROAD, PRINCETON, NEW JERSEY 08543-4000, PRINCETON NEW JERSEY, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA.

Inventores: Saleem AHMAD, Ling LI, Lidet A. NEGASH y John HYNES.

Prioridad N°: 11/05/2017, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/504,956.

Solicitud internacional N°: PCT/US2018/031945

Fecha: 10 de mayo de 2018.

Vigente desde: 10 de mayo de 2018

Hasta: 10 de mayo de 2038.



Resolución N° 4807

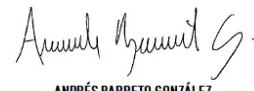
Ref. Expediente N° NC2019/0012494

ARTÍCULO 2: 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 3: Notificar el contenido de la presente resolución a BRISTOL - MYERS SQUIBB COMPANY, 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 febrero de 2022



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZALEZ
Fecha: 2022.02.09
12:01:57 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

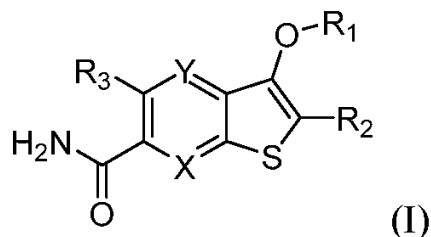
Resolución N° 4807

Ref. Expediente N° NC2019/0012494

ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

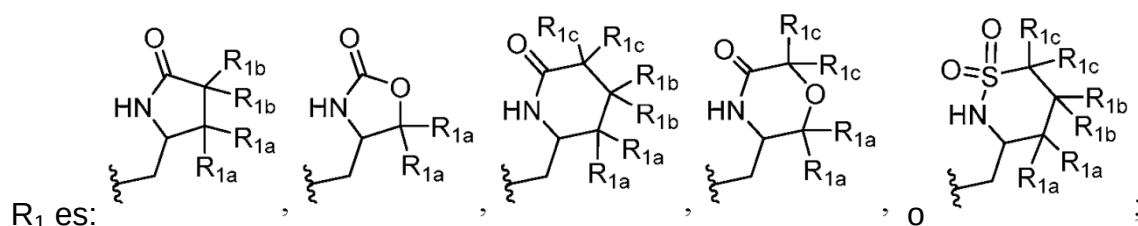
1. Un compuesto de la Fórmula (I)



o una sal del mismo, caracterizado porque:

X es CR₄ o N;

Y es CR₅ o N; siempre que solo uno de X e Y sea N;



cada R_{1a} es independientemente H o alquilo C₁₋₂;

cada R_{1b} es independientemente H, F, -CH₃, -CHF₂ o ciclopropilo; o dos R_{1b}, junto con el átomo de carbono al que están unidos, pueden formar un anillo de espirocicloalquilo de 3 miembros;

cada R_{1c} es H;

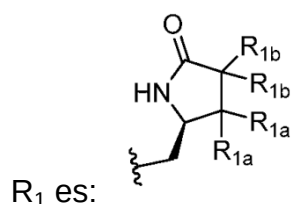
R₂ es H o CH₃;

R₃ es -OCH₃, -OCH(CH₃)₂ o -O(ciclopropilo);

R₄ es H; y

R₅ es H.

2. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 1, o una sal del mismo, caracterizado porque:



3. El compuesto de conformidad con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 2, o una sal del mismo, caracterizado porque:

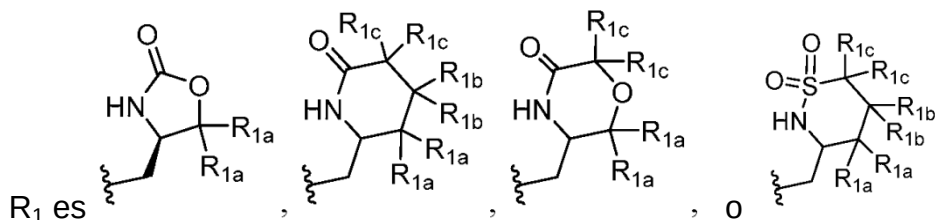
Resolución N° 4807

Ref. Expediente N° NC2019/0012494

cada R_{1a} es independientemente H o alquilo C_{1-2} ; y

cada R_{1b} es independientemente H, F, $-CH_3$, $-CHF_2$ o ciclopropilo; o dos R_{1b} , junto con el átomo de carbono al que están unidos, forman un anillo de espirocicloalquilo de 3 miembros.

4. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 1, o una sal del mismo, caracterizado porque:



5. El compuesto de conformidad con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4, o una sal del mismo, caracterizado porque:

cada R_{1a} es independientemente H o alquilo C_{1-2} .

cada R_{1b} es independientemente H, F, $-CH_3$, $-CHF_2$ o ciclopropilo; y

cada R_{1c} es H.

6. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 o una sal del mismo, caracterizado porque se selecciona de:

3-(((2S,3S)-3-etil-4,4-difluoro-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3S,4S)-3-etil-4-fluoro-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

(S)-5-metoxi-3-((5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)tieno[2,3-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3S,4S)-3-etil-4-fluoro-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxibenzo[b]tiofen-6-carboxamida;

(S)-5-metoxi-3-((5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)tieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3R)-3-etil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

5-metoxi-3-((5-oxomorfolin-3-il)metoxi)tieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3S,4R)-3-etil-4-fluoro-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((6S,7R)-7-etil-4-oxo-5-azaspiro[2.4]heptan-6-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-



Resolución N° 4807

Ref. Expediente N° NC2019/0012494

b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3R)-3-etil-4,4-dimetil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,4R)-4-fluoro-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3R)-3-(difluorometil)-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

5-metoxi-3-(((2S)-4-metil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)tieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S)-4-etil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

5-metoxi-3-(((2S,3R)-3-metil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)tieno[3,2-b] piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3S,4R)-3-ciclopropil-4-fluoro-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3R)-3-etil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxi-2-metiltieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

5-ciclopropoxi-3-(((2S,3R)-3-etil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)tieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3S)-4,4-difluoro-3-metil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3S,4S)-3-etil-4-fluoro-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxi-2-metiltieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3S,4S)-3-etil-4-fluoro-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-isopropoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

5-ciclopropoxi-3-(((2S,3S,4S)-3-etil-4-fluoro-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)tieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

(S)-5-metoxi-2-metil-3-((5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)tieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((4R,5S)-5-etil-2-oxooxazolidin-4-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3S,4R)-4-fluoro-3-metil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida;

3-(((2S,3S,4S)-4-fluoro-3-metil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxitieno[3,2-b]piridin-6-carboxamida; y



Resolución N° **4807**

Ref. Expediente N° NC2019/0012494

3-(((2S,3R)-3-etil-5-oxopirrolidin-2-il)metoxi)-5-metoxibenzo[b]tiofen-6-carboxamida.

7. Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende uno o más compuestos de conformidad con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 6 y un portador o diluyente farmacéuticamente aceptables.

