

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° **38006**

Ref. Expediente N° NC2019/0013706

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 24 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 5 de diciembre de 2019 con el N° NC2019/0013706, por NOVARTIS AG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “COMPUESTOS Y COMPOSICIONES PARA INDUCIR LA CONDRÓGENESIS”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/IB2018/054123 del 7 de junio de 2018.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 888 el 1 de abril de 2020, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio No.19615, 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° NC2019/0013706 el 4 de marzo de 2022, respondió oportunamente el requerimiento formulado y mediante escrito radicado bajo el N° NC2019/0013706 el 4 de marzo de 2022 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.

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 dichas reivindicaciones cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que se refiere a compuestos derivados de 5-hidroxi-3-(piridin-3-il)-7-oxabicyclo [2.2.1]heptan-2-carboxamida y composiciones farmacéuticas que los contienen para inducir la condrogénesis, que difiere de la información del estado de la técnica más cercano WO 2015/175487 en la presencia de un grupo hidroxilo en la posición R1a. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia que mejora la solubilidad y reduce la inhibición de CPY3A4 y el aclaramiento intrínseco de los compuestos en cromosomas hepáticos de rata como en humanos.



Resolución N° 38006

Ref. Expediente N° NC2019/0013706

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 esta Oficina encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

Que de acuerdo con el objeto concedido, el título de la invención quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS DERIVADOS DE 5-HIDROXI-3-(PIRIDIN-3-IL)-7-OXABICICLO [2.2.1]HEPTAN-2-(CARBOXILO O CARBOXAMIDA) Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS 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:

“COMPUESTOS DERIVADOS DE 5-HIDROXI-3-(PIRIDIN-3-IL)-7-OXABICICLO [2.2.1]HEPTAN-2-(CARBOXILO O CARBOXAMIDA) Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS CONTIENEN”

Clasificación IPC: C07D 493/08, A61K 31/444, A61K 31/4427, A61P 19/02.

Reivindicaciones: 1 a 16 incluidas en el radicado bajo el No NC2019/0013706 del 04 de marzo de 2022, de acuerdo con el Anexo No. 1.

Titular: NOVARTIS AG.

Dirección: Lichtstrasse 35, 4056 Basel, SUIZA.

Inventores: Ha-Soon CHOI, Jiqing JIANG, James Paul LAJINESS, Bao NGUYEN, Hank Michael James PETRASSI y Zhicheng WANG.

Prioridades N° 9/06/2017, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/517,394.

Solicitud internacional N°: PCT/IB2018/054123

Fecha: 7 de junio de 2018.

Vigente desde: 7 de junio de 2018

Hasta: 7 de junio de 2038.

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 NOVARTIS AG, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de



Resolución N° **38006**

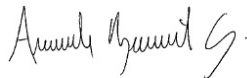
Ref. Expediente N° NC2019/0013706

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 16 de junio de 2022

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

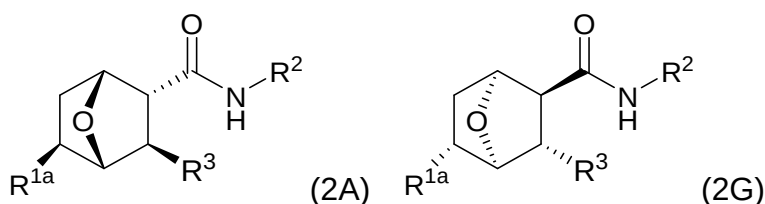
Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZALEZ
Fecha: 2022.06.16
17:00:57 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

ANEXO No. 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de Fórmula (2A) o (2G), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:



caracterizado porque

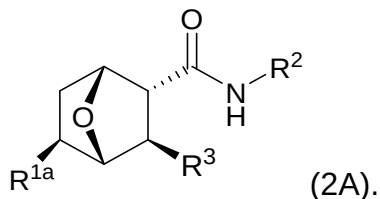
R^{1a} es hidroxilo.

R² es fenilo; donde R² está no sustituido o sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados de manera independiente de halo; C₁₋₆alquilo; C₁₋₆alquilo sustituido con halo; C₁₋₆alcoxi; C₁₋₆alcoxi sustituido con halo; ciano; C₁₋₆alquilosulfonilo; fenilo no sustituido o sustituido con halo o C₁₋₆ alquilo;

R³ es piridilo, no sustituido o sustituido con 1 a 2 sustituyentes seleccionados de manera independiente de halo; C₁₋₆alquilo; C₁₋₆alquilo sustituido con halo; C₁₋₆alcoxi o -NR⁵R⁶; y

R⁵ y R⁶ son cada uno de manera independiente hidrógeno o C₁₋₆alquilo.

2. El compuesto de la reivindicación 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, caracterizado porque dicho compuesto es de Fórmula (2A)



3. El compuesto de la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque R² es fenilo, sustituido con 1-2 sustituyentes seleccionados de manera independiente de cloro, flúor, trifluormetilo, trifluormetoxi, ciano, fenilo sustituido con halo.

4. El compuesto de la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque R² es



Resolución N° 38006

Ref. Expediente N° NC2019/0013706

fenilo sustituido con 3,4-dicloro; 2-trifluormetilo; 3-trifluormetilo; 3-ciano-4-cloro; 2-ciano-4-cloro; 3-fluor-4-cloro; 3-trifluormetoxi; 3-fluor-4-trifluormetoxi; o 3-cloro-4-(2-fluorfenilo).

5. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque R³ es piridilo no sustituido o sustituido con 1 a 2 sustituyentes seleccionados de manera independiente a partir de flúor, trifluormetilo, metilo y metoxi.

6. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque R³ es piridin-4-ilo no sustituido o sustituido con 2-metilo; 2-trifluormetilo; 2-metoxi; 2-amino; 2-fluor; 2,3-difluor; o 2,5-difluor.

7. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque dicho compuesto es (1R,2R,3S,4R,5S)-N-(3,4-diclorofenil)-5-hidroxi-3-(2-metilpiridin-4-il)-7-oxabicyclo[2.2.1]heptano-2-carboxamida, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

8. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque dicho compuesto es (1S,2S,3R,4S,5R)-N-(3,4-diclorofenil)-5-hidroxi-3-(2-metilpiridin-4-il)-7-oxabicyclo[2.2.1]heptano-2-carboxamida, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

9. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque dicho compuesto es (1R,2R,3S,4R,5S)-N-(3,4-diclorofenil)-3-(2-fluorpiridin-4-il)-5-hidroxi-7-oxabicyclo[2.2.1]heptano-2-carboxamida, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque dicho compuesto es (1S,2S,3R,4S,5R)-N-(3,4-diclorofenil)-3-(2-fluorpiridin-4-il)-5-hidroxi-7-oxabicyclo[2.2.1]heptano-2-carboxamida, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

11. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque dicho compuesto es (1R,2R,3S,4R,5S)-N-(3,4-diclorofenil)-5-hidroxi-3-(2-(trifluormetil)piridin-4-il)-7-

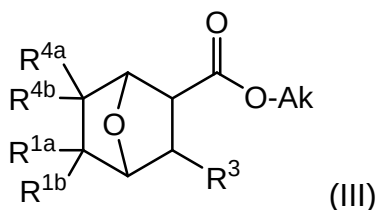
Resolución N° 38006

Ref. Expediente N° NC2019/0013706

oxabicyclo[2.2.1]heptano-2-carboxamida, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

12. El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque dicho compuesto es (1S,2S,3R,4S,5R)-N-(3,4-diclorofenil)-5-hidroxi-3-(2-(trifluormetil)piridin-4-il)-7-oxabicyclo[2.2.1]heptano-2-carboxamida, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

13. Un compuesto que tiene la Fórmula (III)



caracterizado porque Ak es C₁₋₆ alquilo;

R³ es un heteroarilo de 5 o 6 miembros que tiene 1 a 2 heteroátomos seleccionados de N, O y S; donde R³ está no sustituido o sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados de manera independiente de halo, C₁₋₆alquilo, C₁₋₆alquilo sustituido con halo, C₁₋₆alcoxi o -NR⁵R⁶;

R^{1a} es hidroxilo;

R^{1b}, R^{4a}, y R^{4b} son hidrógeno;

R⁵ y R⁶ son cada uno de manera independiente hidrógeno o C₁₋₆alquilo;

alternativamente, R⁵ y R⁶ junto con átomo de nitrógeno al cual están unidos en -NR⁵R⁶ forman un heterociclilo de 5 o 6 miembros que tiene 1-3 heteroátomos seleccionados de N, O y S.

14. Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho compuesto, y un portador farmacéuticamente aceptable o portadores farmacéuticamente aceptables.

15. Un método para inducir la producción de cartílago hialino, o un método para inducir la diferenciación de células progenitoras condrogénicas en condrocitos maduros, caracterizado porque comprende el contacto de células progenitoras condrogénicas *in vitro* con una cantidad terapéuticamente eficaz de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, y opcionalmente, en combinación con un



Resolución N° **38006**

Ref. Expediente N° NC2019/0013706

segundo agente terapéutico; de modo de inducir la diferenciación de células progenitoras de condrocitos en condrocitos maduros productores de matriz extracelular de cartílago hialino.

16. Un método de la reivindicación 15, caracterizado porque dicha etapa de contacto se produce en una matriz o un andamio biocompatible.

