

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 90180

Ref. Expediente N° NC2019/0011877

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 25 de octubre de 2019, con el N° NC2019/0011877, por BAYER ANIMAL HEALTH GMBH, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “NUEVOS DERIVADOS DE PIRAZOL BICÍCLICOS”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2018/060313 del 23 de abril 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° 6978 del 10 de mayo de 2022, 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° NC2019/0011877 el 29 de noviembre de 2021, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 6 que reemplazan las originalmente presentadas. Posteriormente, mediante escrito radicado bajo el N° NC2022/0016534 el 16 de noviembre de 2022, el solicitante presentó las reivindicaciones 1 a 6 para que sean tenidas en cuenta al momento de realizar el examen definitivo de la solicitud. 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 6 incluidas en el radicado bajo el N° NC2022/0016534 del 16 de noviembre de 2022, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a compuestos derivados de pirazol bicíclicos, procedimientos para la elaboración de dichos compuestos, compuestos intermedios útiles para la elaboración de dichos compuestos y composiciones farmacéuticas, que difieren del estado de la técnica más cercano, Holden P, et al.¹, en el núcleo de pirazolo[5,1-b]tiazol-2-carboxamida y en el patrón de sustitución del mismo. Adicionalmente, estas

¹ Holden P, et al. (16/12/2014). Anthelmintic drugs and nematicides: studies in *Caenorhabditis elegans*. *WormBook*. Páginas 1-29. Recuperado de: http://www.wormbook.org/chapters/www_anthelminticdrugs.2/anthelminticdrugs.2.pdf
Página 1 de 11

Resolución N° 90180

Ref. Expediente N° NC2019/0011877

diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto como antihelmínticos con una actividad mejorada.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 6 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 de acuerdo con la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0011877 el 24 de noviembre de 2021 y teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “COMPOSICIONES, PROCEDIMIENTO DE PREPARACIÓN Y COMPUESTOS DERIVADOS DE PIRAZOLO[5,1-B]TIAZOL-2-CARBOXAMIDA CON ACTIVIDAD ANTIHELMÍNTICA”.

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:

“COMPOSICIONES, PROCEDIMIENTO DE PREPARACIÓN Y COMPUESTOS DERIVADOS DE PIRAZOLO[5,1-B]TIAZOL-2-CARBOXAMIDA CON ACTIVIDAD ANTIHELMÍNTICA”

Clasificación IPC: C07D 513/00, A61P 31/00, A61K 31/429.

Reivindicaciones: 1 a 6 incluidas en el radicado bajo el N° NC2022/0016534 del 16 de noviembre de 2022, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: BAYER ANIMAL HEALTH GMBH.

Domicilio: KAISER-WILHELM-ALLEE 10, 51373 LEVERKUSEN, ALEMANIA.

Inventores: Hans-Georg SCHWARZ, Ulrich GÖRGENS, Johannes KÖBBERLING, Nils GRIEBENOW, Adeline KÖHLER, Thomas ILG, Claudia WELZ, Daniel KULKE, Walter HÜBSCH y Wei ZHUANG.

Prioridad N°: 27/04/2017, EPO, 17168558.9.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2018/060313

Fecha: 23 de abril de 2018.

Vigente desde: 23 de abril de 2018

Hasta: 23 de abril 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.

Resolución N° **90180**

Ref. Expediente N° NC2019/0011877

ARTÍCULO 3: Notificar el contenido de la presente resolución a BAYER ANIMAL HEALTH GMBH, 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 21 de diciembre de 2022



Firmado digitalmente
por: JUAN CAMILO
DURAN TELLEZ
Fecha: 2022.12.21
12:03:25 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

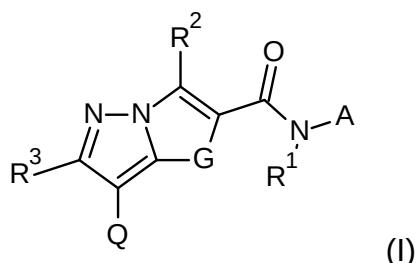
Resolución N° 90180

Ref. Expediente N° NC2019/0011877

ANEXO 1

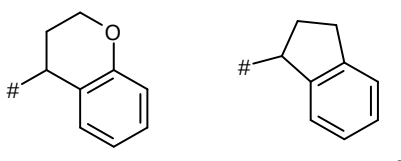
REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto de la Fórmula general (I),



caracterizado porque:

- A se selecciona del grupo que consiste en



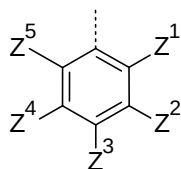
- G es S,

- R¹ es hidrógeno o metilo,

- R² se selecciona del grupo que consiste en
hidrógeno, cloro, flúor,
-NH₂, -NH(CH₃), -N(CH₃)₂,
metoxi, etoxi,
metilo, etilo, propilo, isopropilo, ciclopropilo,
trifluorometilo y trifluorometoxi,

- R³ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, cloro, flúor, metilo,
metoxi y trifluorometilo,

- Q es un anillo fenilo sustituido de la Fórmula (Q1)



(Q1)

en la cual:

- Z¹ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, cloro, metilo
y metoxi,

- Z² se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, cloro, -OH,
metilo, etilo, metoxi, etoxi, -NH(CH₃), -N(CH₃)₂, trifluorometilo, trifluorometoxi,

Resolución N° 90180

Ref. Expediente N° NC2019/0011877

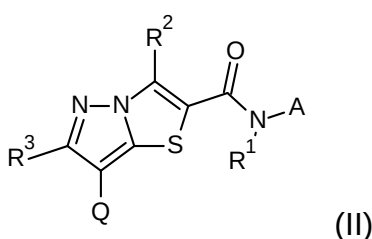
Z^3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, cloro, metilo, metoxi, $-NH(CH_3)$ y $-N(CH_3)_2$,

Z^4 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, cloro, metilo y metoxi,

Z^5 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, cloro, metilo y metoxi,

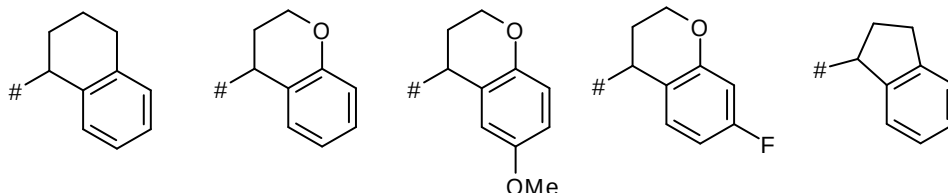
o un estereoisómero, un tautómero, un N-óxido, un hidrato, o una sal del mismo.

2. Un compuesto de la Fórmula general (II):



caracterizado porque:

A se selecciona del grupo que consiste en

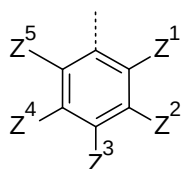


R^1 es hidrógeno o metilo,

R^2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, cloro, flúor, metoxi, metilo, etilo, propilo, isopropilo, trifluorometilo y trifluorometoxi,

R^3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, cloro, flúor, metilo, metoxi y trifluorometilo,

Q es un anillo fenilo sustituido de la Fórmula (Q1)



(Q1)

en la cual:

Z^1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y halógeno,

Resolución N° **90180**

Ref. Expediente N° NC2019/0011877

Z^2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, -N(alquilo- C_1-C_4)₂, - halógenoalquilo- C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y halógenoalcoxi- C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

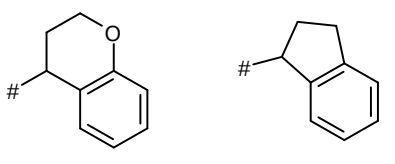
Z^3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y halógeno,

Z^4 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y halógeno,

Z^5 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y halógeno, o un estereoisómero, un tautómero, un N-óxido, un hidrato, o una sal del mismo.

3. El compuesto de acuerdo con la Reivindicación 2, caracterizado porque

A se selecciona del grupo que consiste en

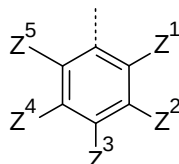


R^1 es hidrógeno,

R^2 es isopropilo,

R^3 es metilo,

Q es un anillo fenilo sustituido de la Fórmula (Q1)



(Q1)

en la cual:

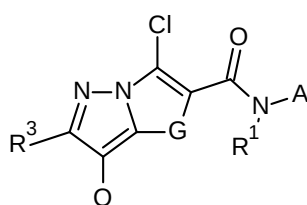
Z^1 , Z^3 , Z^4 y Z^5 se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, flúor y cloro, y

Z^2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, cloro, -N(CH₃)₂, trifluorometilo y trifluorometoxi, o un estereoisómero, un tautómero, un N-óxido, un hidrato, una sal del mismo.

4. Un procedimiento para preparar un compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, dicho procedimiento comprende la etapa de permitir un compuesto intermedio de la Fórmula general **1N**:

Resolución N° 90180

Ref. Expediente N° NC2019/0011877



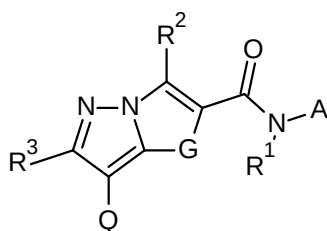
1N,

en la cual G, A, R¹, R³ y Q son como se definen para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, para reaccionar con un compuesto de la Fórmula general **1F**:

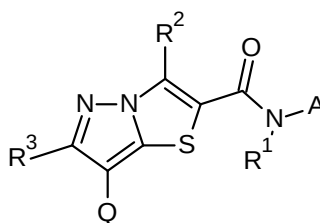


1F,

en la cual R² es como se define para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, proporcionando así un compuesto de la Fórmula general (I) o (II):



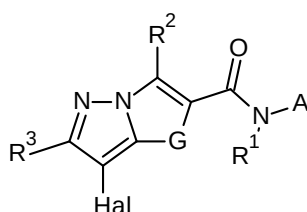
(I)



(II)

en la cual G, A, R¹, R², R³ y Q son como se definen para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3,

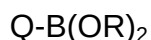
o la etapa de permitir un compuesto intermedio de la Fórmula general **1T**:



1T,

en la cual G, A, R¹, R² y R³ son como se definen para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3 y en donde Hal es halógeno, particularmente cloro, bromo o yodo,

para reaccionar con un compuesto de la Fórmula general **1H**:



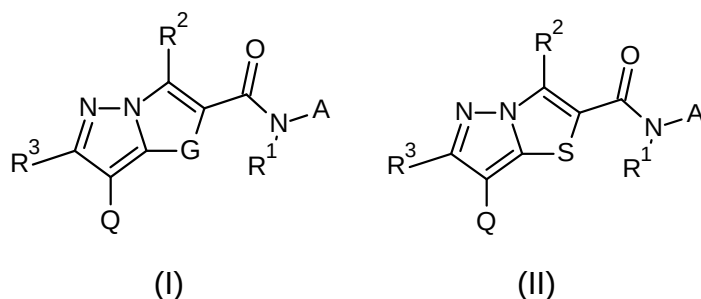
1H,

Resolución N° 90180

Ref. Expediente N° NC2019/0011877

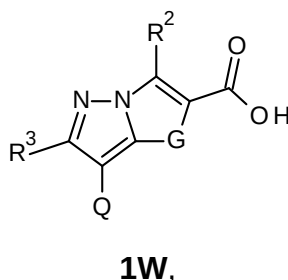
en la cual Q es como se define para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con la Reivindicación 1 y cada R está individualmente H o Me o ambos R son pinacolato,

proporcionando así un compuesto de la Fórmula general (I) o (II):



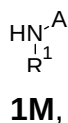
en la cual G, A, R¹, R², R³ y Q son como se definen para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3,

o la etapa de permitir un compuesto intermedio de la Fórmula general **1W**:



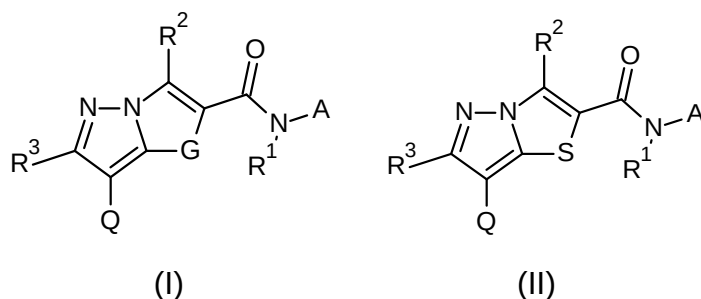
en la cual G, Q, R² y R³ son como se definen para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3,

para reaccionar con un compuesto de la Fórmula general **1M**:



en la cual R¹ y A son 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 (I) o (II):

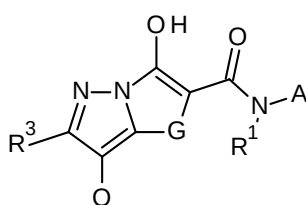


en la cual G, A, R¹, R², R³ y Q son como se definen para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3,

o la etapa de permitir un compuesto intermedio de la Fórmula general **1X**:

Resolución N° 90180

Ref. Expediente N° NC2019/0011877



1X,

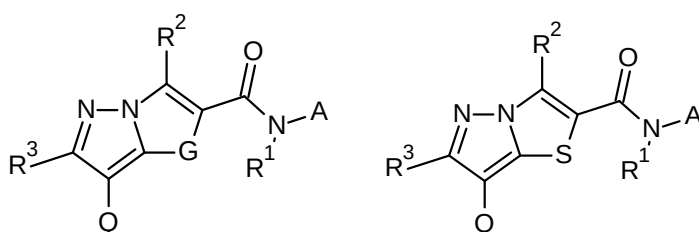
en la cual G, Q, A, R¹ y R³ son como se definen para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3,
para reaccionar con un compuesto de la Fórmula general **1Y**:



1Y,

en la cual R² es alcoxi-C₁-C₄ que está opcionalmente sustituido según se define para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3,

proporcionando así un compuesto de la Fórmula general (I) o (II):

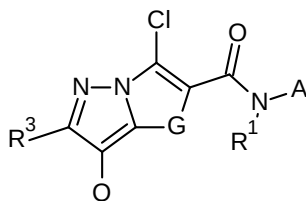


(I)

(II)

en la cual G, A, R¹, R³ y Q son como se define para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3 y R² es alcoxi-C₁-C₄ que está opcionalmente sustituido según se define para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3,

o la etapa de permitir un compuesto intermedio de la Fórmula general **1N**:



1N,

en la cual G, Q, A, R¹ y R³ son como se definen para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3,
para reaccionar con un compuesto de la Fórmula general **2A**:



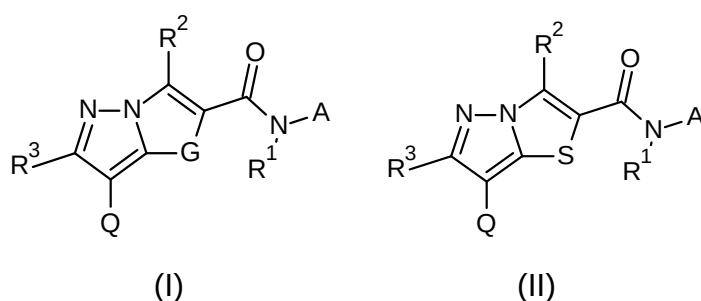
2A,

Resolución N° 90180

Ref. Expediente N° NC2019/0011877

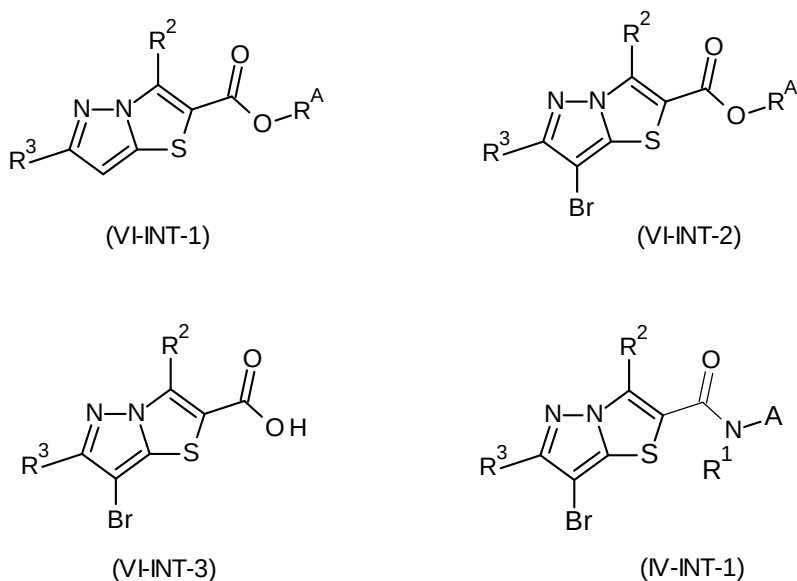
en la cual R^2 es alquilo- C_1-C_4 , cicloalquilo- C_3-C_6 , alqueno- C_2-C_4 , cicloalqueno- C_3-C_6 , alquino- C_2-C_4 o fenil-alquilo- C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido como se define para el compuesto de Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones de 1 a 3, Met es magnesio o zinc, y X es cloro, bromo o yodo,

proporcionando así un compuesto de la Fórmula general (I) o (II):



en la cual G, A, R^1 , R^3 y Q son como se define para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3 y R^2 es alquilo- C_1-C_4 , cicloalquilo- C_3-C_6 , alqueno- C_2-C_4 , cicloalqueno- C_3-C_6 , alquino- C_2-C_4 o fenil-alquilo- C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido según se define para el compuesto de la Fórmula general (I) o (II), de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3.

5. Un compuesto de la Fórmula general (VI-INT-1), (VI-INT-2), (VI-INT-3) o (IV-INT-1):



caracterizado porque

- R^A se selecciona del grupo que consiste en metilo, etilo y *t*-butilo;
- R^2 se selecciona del grupo que consiste en alquilo- C_1-C_6 y cicloalquilo- C_3-C_6 ,

Resolución N° 90180

Ref. Expediente N° NC2019/0011877

R^3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo- C_1-C_4 , y cicloalquilo- C_3-C_6 , y

A y R^1 son como se define en cualquiera de las reivindicaciones precedentes, con la condición de que en la fórmula (VI_INT-3) cuando R^2 es isopropilo R^3 no es metilo.

6. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende un compuesto de la Fórmula general (I) o (II) de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3 y uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables.