

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Resolución N° 876

Ref. Expediente N° NC2022/0000187

*Por la cual se otorga una Patente de Invención*

**EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E)**

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 13 de enero de 2022 con el N° NC2022/0000187, por AMTIXBIO CO., LTD., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "UN NUEVO DERIVADO DEL ÁCIDO AMINOALCANOICO QUE CONTIENE UN GRUPO BIFENILO Y UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA ANTIFÚNGICA QUE LO COMPRENDE", que corresponde a la solicitud internacional PCT/KR2020/008306 del 25 de junio de 2020.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 950 el 17 de enero de 2022, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2022/0000187 del 03 de mayo de 2022, solicitó el reconocimiento de los resultados del examen de patentabilidad efectuado por la Oficina Coreana de Propiedad Intelectual (KIPO), allegando la documentación correspondiente y dando cumplimiento a los requisitos señalados en el numeral 1.2.2.5.2.1 del título X de la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio No. 12457 de 9 de agosto 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 presentó junto a la respuesta radicada el 20 de diciembre de 2022 nuevas reivindicaciones 1 a 15 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 15 incluidas en el radicado bajo el No NC2022/0000187 el 20 de diciembre de 2022, cumplen los requisitos previstos anteriormente, toda vez que se refiere a un derivado de ácido aminoalcanoico que contiene un grupo bifenilo que difiere de la información del estado de la técnica más cercano WO2012125832 en la porción  $(CH_2)_n-NHCO-CH(CH_2R_3)-NR_1R_2$  que sustituye el grupo bifenilo.

**Resolución N° 876**

Ref. Expediente N° NC2022/0000187

Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia que los compuestos presentan un efecto antifúngico para inhibir el crecimiento de los hongos patógenos *Cryptococcus neoformans*, *Candida albicans*, *Candida glabrata* y *Aspergillus fumigatis*, presentando valores de concentración mínima inhibitoria entre 0,5 y 32 µg/mL, para inhibir el crecimiento de *Bacillus cereus*, *Bacillus subtilis* y *Bacillus coagulans* entre menos de 4 y hasta 64 µg/mL, para inhibir *E. coli* y *S. entérica* entre menos de 0,125 y hasta 64 µg/mL, para inhibir *L. monocytogenes*, *M. luteus* y *P. acnes* entre menos de 0,125 y hasta 64 µg/mL y para inhibir *S. epidermidis* y *S. aureus* entre menos de 4 y hasta 32 µg/mL.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 15 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.

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

**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:

**“UN NUEVO DERIVADO DEL ÁCIDO AMINOALCANOICO QUE CONTIENE UN GRUPO BIFENILO Y UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA ANTIFÚNGICA QUE LO COMPRENDE”**

**Clasificación IPC:** C07C 237/20, A61K 31/165, A61P 31/10.

**Reivindicaciones:** 1 a 15 incluidas en el radicado bajo el No NC2022/0000187 el 20 de diciembre de 2022, de acuerdo con el Anexo No. 1.

**Titular:** AMTIXBIO CO., LTD.

**Dirección:** A-513, 11, BEOBWON-RO 11-GIL, 05836, SONGPA-GU SEOUL, REPÚBLICA DE COREA.

**Inventores:** Ki Duk PARK, Jong Hyun PARK, Hyeon Ji KIM, Ye Rim LEE, Siwon KIM, Ji Won CHOI, Seul Ki YEON, Jong-Seung LEE, Yong-Sun BAHN, Eunji CHEONG, Kyung-Tae LEE y Joohyeon HONG.

**Prioridad N°** 25/06/2019, KR (REPÚBLICA DE COREA), 10-2019-0075893.

**Solicitud internacional N°:** PCT/KR2020/008306 **Fecha:** 25 de junio de 2020.

**Vigente desde:** 25 de junio de 2020

**Hasta:** 25 de junio de 2040.

**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

Resolución N° 876

Ref. Expediente N° NC2022/0000187

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 AMTIXBIO CO., LTD. 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 enero de 2023

**EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E),**



Firmado digitalmente  
por: JUAN CAMILO  
DURAN TELLEZ  
Fecha: 2023.01.23  
09:07:03 COT  
Razón: Validez jurídica.  
Ubicación: Bogotá,  
Colombia.

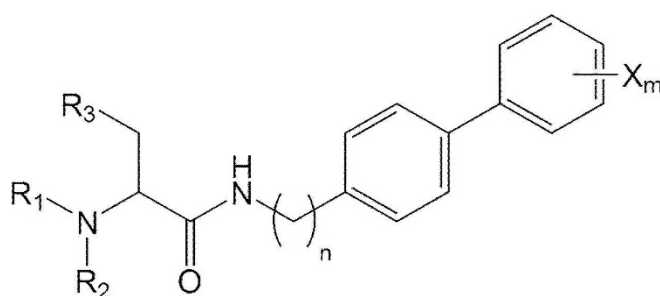
## Resolución N° 876

Ref. Expediente N° NC2022/0000187

**ANEXO No. 1****REIVINDICACIONES CONCEDIDAS**

1. Un compuesto representado por la siguiente Fórmula 1, un estereoisómero del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:

[Fórmula 1]



en la Fórmula 1,

n es 0, 1, 2, 3, 4 o 5,

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, y R<sub>3</sub> son cada uno independientemente iguales o diferentes entre sí, y cada uno se selecciona independientemente entre hidrógeno, un alquilo C<sub>1-7</sub>, un cicloalquilo C<sub>3-6</sub>, hidroxilo, un halógeno, un alquilo C<sub>1-7</sub> halogenado, un alquilo C<sub>1-7</sub> y un alquilo C<sub>1-7</sub> halogenado, y

X es m sustituyentes (m es un número entero de 1 a 5) que son iguales o diferentes entre sí, seleccionados del grupo que consiste en un grupo halógeno, un grupo alquilo C<sub>1-7</sub> halogenado y un grupo alcoxi C<sub>1-7</sub> halogenado.

2. El compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de la reivindicación 1,

donde R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> son cada uno independientemente H o metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, ciclobutilo, n-pentilo, ciclopentilo, n-hexilo o ciclohexilo, y

R<sub>3</sub> es metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo o terc-butilo.

3. El compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de la reivindicación 1, en el que X es uno o dos sustituyentes idénticos o

## Resolución N° 876

Ref. Expediente N° NC2022/0000187

diferentes seleccionados del grupo que consiste en flúor, cloro, trifluorometilo y trifluorometoxi.

4. El compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de la reivindicación 3, en el que X es p-fluoro, m-fluoro, p,m-difluoro, p-cloro, m-cloro, p,m-dicloro, p- trifluorometilo o p-trifluorometoxi.

5. El compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de la reivindicación 1, en el que el compuesto es

- 1) 2-amino-N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)butanamida;
- 2) 2-amino-N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)pentanamida;
- 3) 2-amino-N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)hexanamida;
- 4) 2-amino-N-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)pentanamida;
- 5) N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)-2-(metilamino)butanamida;
- 6) N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)-2-(metilamino)pentanamida;
- 7) N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)-2-(metilamino)hexanamida;
- 8) N-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)-2-(dimetilamino)pentanamida;
- 9) 2-amino-N-((3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)pentanamida;
- 10) 2-amino-N-((3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)hexanamida;
- 11) 2-amino-N-((4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)pentanamida;
- 12) 2-amino-N-((4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)hexanamida;
- 13) 2-amino-N-((4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)pentanamida;
- 14) 2-amino-N-((4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)hexanamida;
- 15) N-((3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)-2-(metilamino)pentanamida;
- 16) 2-(metilamino)-N-((4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)pentanamida;
- 17) N-((3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)metil)-2-(dimetilamino)pentanamida;
- 18) 2-amino-N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 19) 2-amino-N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 20) 2-amino-N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida;

## Resolución N° 876

Ref. Expediente N° NC2022/0000187

- 21) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 22) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 23) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida;
- 24) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 25) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 26) 2-amino-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida;
- 27) 2-amino-N-(2-(3',4'-difluoro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 28) N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(metilamino)butanamida;
- 29) N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(metilamino)pentanamida;
- 30) N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(metilamino)hexanamida;
- 31) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 32) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 33) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometil)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida;
- 34) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)butanamida;
- 35) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)pentanamida;
- 36) 2-(metilamino)-N-(2-(4'-(trifluorometoxi)-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)hexanamida; o
- 37) N-(2-(3',4'-dicloro-[1,1'-bifenil]-4-il)etil)-2-(dimetilamino)pentanamida.

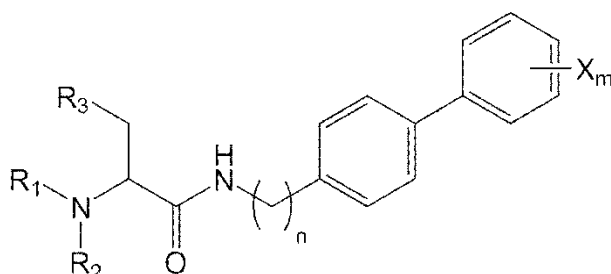
6. Un método para preparar el compuesto, el estereoisómero del mismo, o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, el método comprendiendo un primer paso para formar un enlace peptídico haciendo reaccionar un compuesto derivado del ácido aminoalcanoico protegido por un grupo protector butoxicarbonilo (Boc), que está representado por la siguiente Fórmula 2, con un compuesto derivado de bifenilo que contiene un grupo amina primaria, que está representado por la siguiente Fórmula 3; y

un segundo paso para eliminar el grupo protector Boc haciendo reaccionar el compuesto obtenido en el primer paso con un ácido:

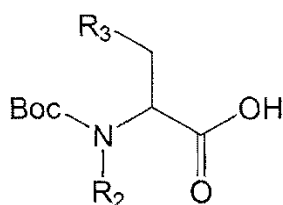
[Fórmula 1]

Resolución N° 876

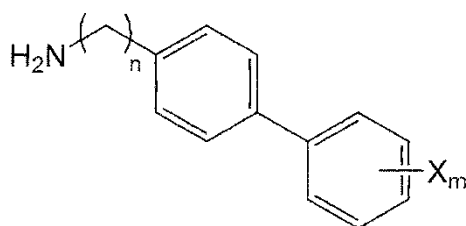
Ref. Expediente N° NC2022/0000187



[Fórmula 2]



[Fórmula 3]



en las fórmulas,

n es 0, 1, 2, 3, 4 o 5,

$R_1$ ,  $R_2$  y  $R_3$  son cada uno independientemente iguales o diferentes entre sí, y cada uno se selecciona independientemente entre hidrógeno, un alquilo  $C_{1-7}$ , un cicloalquilo  $C_{3-6}$ , hidroxilo, un halógeno, un alquilo  $C_{1-7}$  halogenado, un alquilo  $C_{1-7}$  halogenado, un alquilo  $C_{1-7}$  halogenado, y

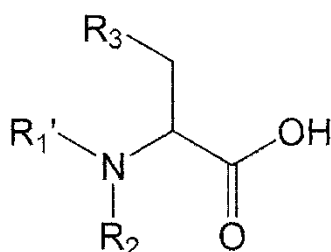
X es m sustituyentes (m es un número entero de 1 a 5) que son iguales o diferentes entre sí, seleccionados del grupo que consiste en un grupo halógeno, un grupo alquilo  $C_{1-7}$  halogenado y un grupo alcoxilo  $C_{1-7}$  halogenado.

7. El método de la reivindicación 6, en el que el compuesto derivado del ácido aminoalcanoico protegido por el grupo protector Boc, que está representado por la Fórmula 2, se prepara haciendo reaccionar un derivado de aminoácido representado por la siguiente Fórmula 4 con dicarbonato de di-terc-butilo (anhídrido Boc):

[Fórmula 4]

Resolución N° 876

Ref. Expediente N° NC2022/0000187



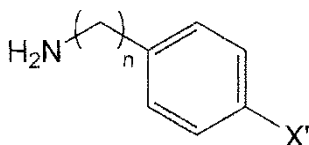
en la fórmula,

$R_1'$ ,  $R_2$  y  $R_3$  son cada uno independientemente iguales o diferentes entre sí, y cada uno se selecciona independientemente entre hidrógeno, un alquilo  $C_{1-7}$ , un cicloalquilo  $C_{3-6}$ , hidroxilo, un halógeno, un alquilo  $C_{1-7}$  halogenado, un alquilo  $C_{1-7}$  y un alquilo  $C_{1-7}$  halogenado.

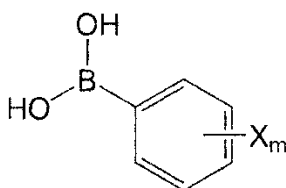
8. El método de la reivindicación 7, en el que cuando  $R_2$  del compuesto finalmente preparado es un alquilo, se realiza adicionalmente una etapa de alquilación del compuesto haciendo reaccionar el compuesto con un haloalcano en presencia de una base después de la reacción anterior.

9. El método de la reivindicación 6, en el que un compuesto derivado de bifenilo que comprende un grupo amina primaria, que está representado por la Fórmula 3, se prepara haciendo reaccionar un derivado de alquilamina  $C_{0-2}$  en el que un grupo halofenilo en un extremo está sustituido, el cual está representado por la siguiente Fórmula 5, con dicarbonato de di-terc-butilo para introducir un grupo protector Boc en un grupo amina, luego haciendo reaccionar el derivado de alquilamina resultante con un derivado de ácido fenilborónico representado por la siguiente Fórmula 6, y luego haciendo reaccionar los reactivos con un ácido para eliminar el Grupo protector Boc:

[Fórmula 5]



[Fórmula 6]



en las fórmulas,

## Resolución N° 876

Ref. Expediente N° NC2022/0000187

X' es un halógeno, y

X es m sustituyentes (m es un número entero de 1 a 5) que son iguales o diferentes entre sí, seleccionados del grupo que consiste en un grupo halógeno, un grupo alquilo C<sub>1-7</sub> halogenado, y un grupo alcoxi C<sub>1-7</sub> halogenado.

10. El método de la reivindicación 9, en el que la reacción con el derivado del ácido fenilborónico se logra mediante una reacción de acoplamiento cruzado usando un catalizador metálico en presencia de una base.

11. El método de la reivindicación 6, en el que el primer paso se logra mediante una reacción de acoplamiento de anhídrido realizada en un disolvente orgánico en presencia de N-metilmorfolina (NMM) y cloroformiato de isobutilo (IBCF)

12. El método de la reivindicación 6, que comprende además un tercer paso de formar una amina secundaria alquilando la amina después del segundo paso cuando tanto R<sub>1</sub> como R<sub>2</sub> del compuesto finalmente preparado son un alquilo.

13. Una composición antifúngica que comprende, como ingrediente activo, el compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.

14. Una composición farmacéutica que comprende, como ingrediente activo, el compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, y un vehículo, diluyente, o excipiente farmacéuticamente aceptable.

15. Una composición antibacteriana que comprende, como ingrediente activo, el compuesto, el estereoisómero del mismo o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.