

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 37700

Ref. Expediente N° NC2017/0010806

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 mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 24 de octubre de 2017, con el N° NC2017/0010806, por FUJIFILM CORPORATION, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “MÉTODO PARA MANUFACTURAR COMPUESTO NOVEDOSO QUE CONTIENE NITRÓGENO O SAL DEL MISMO E INTERMEDIARIO DE MANUFACTURACIÓN DEL COMPUESTO NOVEDOSO QUE CONTIENE NITRÓGENO O SAL DEL MISMO”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/JP2016/059729 del 25 de marzo de 2016.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 815 el 16 de enero de 2018, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 2101, notificado el 5 de abril de 2019, 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.

CUARTO: Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2017/0010806 el 5 de julio de 2019, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 29 que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se acepta este último capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: 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.”*



Resolución N° 37700

Ref. Expediente N° NC2017/0010806

SEXTO: Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 29 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0010806 del 5 de julio de 2019, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren derivados bifuncionales de compuestos de 5,6,7,8-tetrahidro-1,8-naftidirin-2-il y el método de síntesis, que difiere del estado de la técnica más cercano, WO1999031061, en que los compuestos de la invención 6,7,8-tetrahidro-1,8-naftidirin-2-il están unidos por medio de espaciadores tipo alquileo a compuestos quelantes que permiten formar compuestos de coordinación con elementos radioactivos con actividad citotóxica. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto de servir como marcadores radioactivos para la detección de tumores relacionados con integrinas. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 29 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.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con la modificación presentada por el solicitantes en el escrito radicado bajo el N° NC2017/0010806 del 11 de diciembre de 2018 y teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “DERIVADOS BIFUNCIONALES DE COMPUESTOS DE 5,6,7,8-TETRAHIDRO-1,8-NAFTIRIDIN-2-IL CON AFINIDAD A INTEGRINAS Y MÉTODO DE MANUFACTURACIÓN DE DICHOS COMPUESTOS”.

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:

“DERIVADOS BIFUNCIONALES DE COMPUESTOS DE 5,6,7,8-TETRAHIDRO-1,8-NAFTIRIDIN-2-IL CON AFINIDAD A INTEGRINAS Y MÉTODO DE MANUFACTURACIÓN DE DICHOS COMPUESTOS”

Clasificación IPC: C07D 471/04, A61K 31/395, A61K 31/555, A61K 51/00, A61P 35/00, A61P 43/00, C07B 59/00, C07D 255/02, C07D 257/02, C07F 1/08 y C07F 5/00.

Reivindicaciones: 1 a 29 incluidas en el radicado bajo el N° NC2017/0010806 del 5 de julio de 2019, de acuerdo al anexo 1.

Titular: FUJIFILM CORPORATION.

Domicilio: 26-30, NISHIAZABU 2-CHOME, MINATO-KU, TOKIO 106-8620 JAPON.

Resolución N° 37700

Ref. Expediente N° NC2017/0010806

Inventores: Hirofumi FUKUNAGA, Sachiko SHINJO, Daisuke NAKAGAWA, Shinichiro SEKINE y Takayuki YAMAKAWA.

Prioridad N° 25/03/2015, JP (JAPON), 2015-062306.

Solicitud internacional N°: PCT/JP2016/059729

Fecha: 25 de marzo de 2016.

Vigente desde: 25 de marzo de 2016

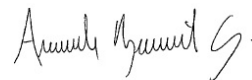
Hasta: 25 de marzo de 2036.

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 FUJIFILM CORPORATION, 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 20 de agosto de 2019



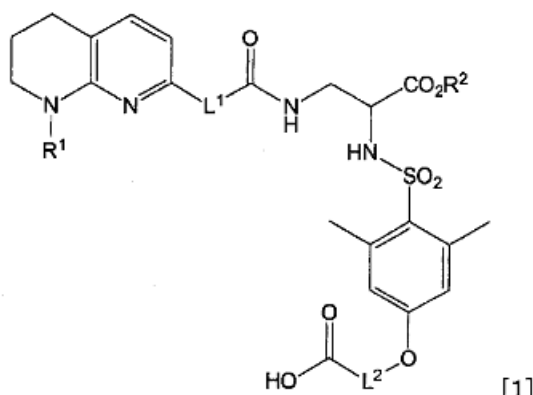
ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZÁLEZ
Fecha: 2019.08.20
17:01:15 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

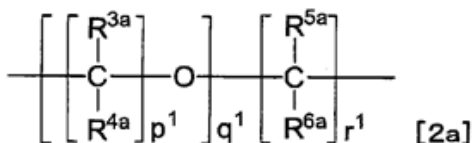
ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

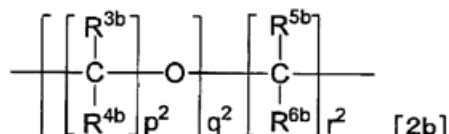
1. Un método para manufacturar un compuesto representado por la Fórmula [11] o una sal del mismo, caracterizado porque comprende:
 - (1) una etapa de hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula [1] o una sal del mismo



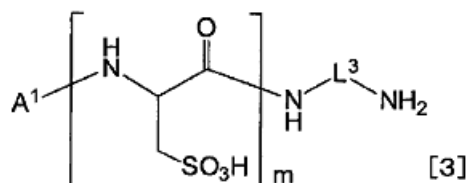
(en la fórmula, R¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo protector amino; R² representa un grupo protector carboxilo; L¹ representa un grupo representado por la Fórmula [2a])



(en la fórmula, R³ᵃ, R⁴ᵃ, R⁵ᵃ, y R⁶ᵃ son los mismos como o diferentes de entre sí y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-₆; p¹ representa un número entero de 1 hasta 3; q¹ representa un número entero de 0 hasta 3; y r¹ representa un número entero de 1 hasta 6); y L² representa un grupo representado por la Fórmula [2b])



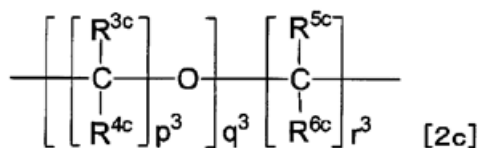
(en la fórmula, R³ᵇ, R⁴ᵇ, R⁵ᵇ, y R⁶ᵇ son los mismos como o diferentes de entre sí y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁-₆; p² representa un número entero de 1 hasta 3, q² representa un número entero de 0 hasta 3; y r² representa un número entero de 1 hasta 6)) con un compuesto representado por la Fórmula [3] o una sal del mismo



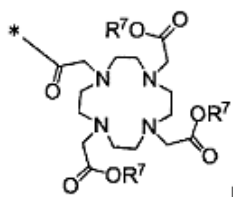
(en la fórmula, L³ representa un grupo representado por la Fórmula [2c])

Resolución N° 37700

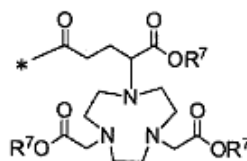
Ref. Expediente N° NC2017/0010806



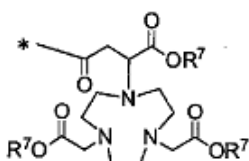
(en la fórmula, R^{3c} , R^{4c} , R^{5c} , y R^{6c} son los mismos como o diferentes de entre sí y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_{1-6} ; p^3 representa un número entero de 1 hasta 3; q^3 representa un número entero de 0 hasta 3; y r^3 representa un número entero de 1 hasta 6); A^1 representa cualquiera de los grupos representados por las Fórmulas [4] a [9]



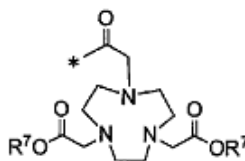
[4]



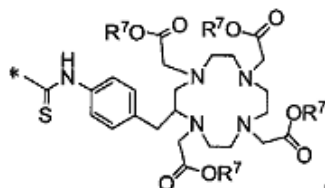
[5]



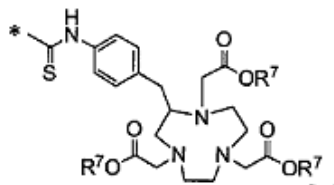
[6]



[7]

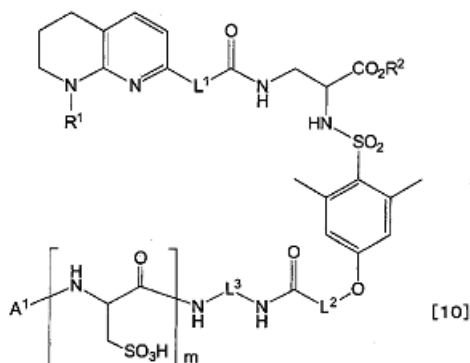


[8]



[9]

(en las fórmulas, * representa una posición de unión; y los R^7 son los mismos como o diferentes de entre sí y representan un grupo protector carboxilo); y m representa un número entero de 1 hasta 3)) para así obtener un compuesto representado por la Fórmula [10] o una sal del mismo;



[10]

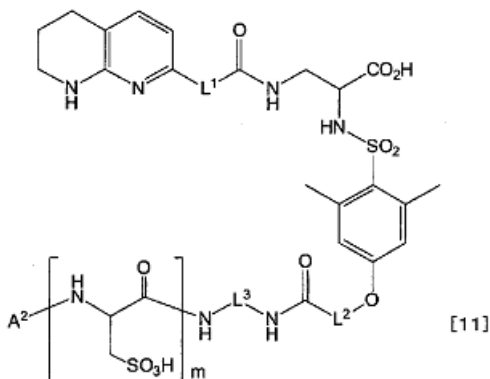
(en la fórmula, R^1 , R^2 , L^1 , L^2 , L^3 , A^1 , y m tienen la misma definición como R^1 , R^2 , L^1 , L^2 , L^3 , A^1 , y m descrito anteriormente);

en donde la reacción se lleva a cabo en presencia de un agente de condensación; y

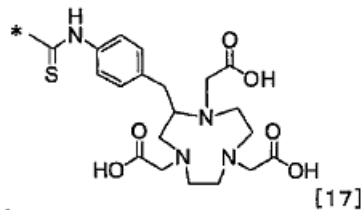
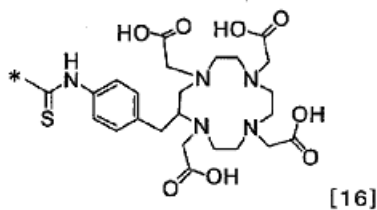
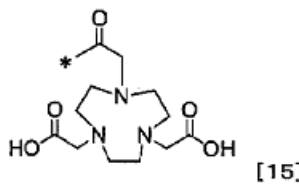
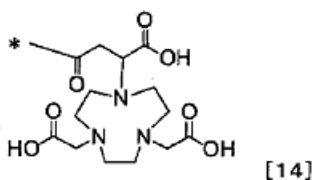
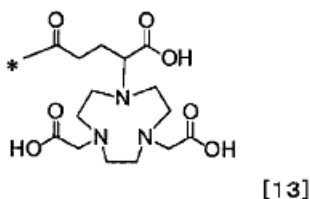
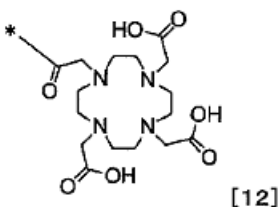
(2) una etapa de desprotección del compuesto representado por la Fórmula [10] o una sal del mismo,

Resolución N° 37700

Ref. Expediente N° NC2017/0010806

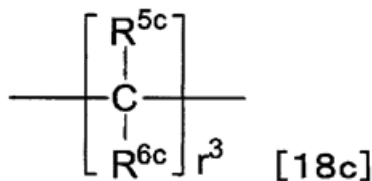


(en la fórmula, A² representa cualquiera de los grupos representados por las Fórmulas [12] a [17])



(en las fórmulas, * representa una posición de unión); y L¹, L², L³, y m tienen la misma definición como L¹, L², L³, y m descrito anteriormente).

2. El método de manufacturación de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque la temperatura de reacción de la etapa (1) es -30°C a 100°C, y el tiempo de reacción de la etapa (1) es 1 minuto a 72 horas.
3. El método de manufacturación de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R² es un grupo alquilo C₁₋₆ el cual puede ser sustituido o un grupo bencilo el cual puede ser sustituido.
4. El método de manufacturación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque L³ es un grupo representado por la Fórmula [18c]



(en la fórmula, R^{5c} y R^{6c} pueden ser el mismo o diferente de entre sí y

Resolución N° 37700

Ref. Expediente N° NC2017/0010806

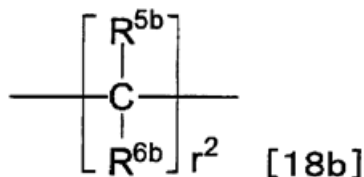
representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆; y r³ representa un número entero de 1 hasta 6).

5. El método de manufacturación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque L¹ es un grupo representado por la Fórmula [18a]



(en la fórmula, R^{5a} y R^{6a} son los mismos como o diferentes de entre sí y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆; y r¹ representa un número entero de 1 hasta 6).

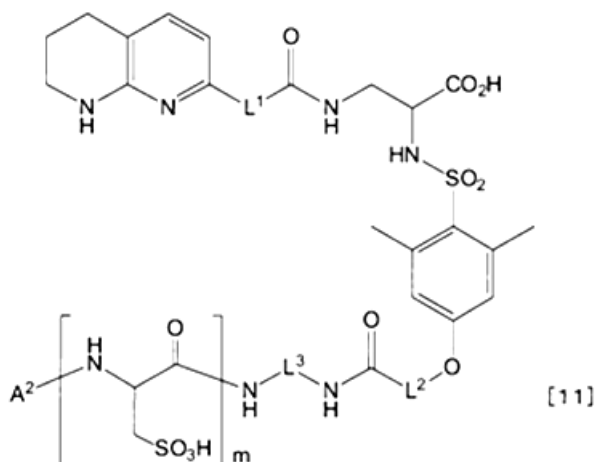
6. El método de manufacturación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque L² es un grupo representado por la Fórmula [18b]



(en la fórmula, R^{5b} y R^{6b} son los mismos como o diferentes de entre sí y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆; y r² representa un número entero de 1 hasta 6).

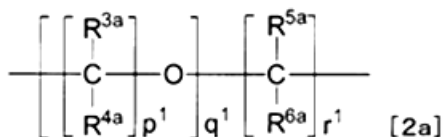
7. El método de manufacturación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque R¹ es un átomo de hidrógeno, un grupo alcóxicarbonilo C₁₋₆ el cual puede ser sustituido, un grupo arilsulfonilo el cual puede ser sustituido, o un grupo sulfonilo heterocíclico el cual puede ser sustituido.
8. El método de manufacturación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizado porque R⁷ es un grupo alquilo C₁₋₆ el cual puede ser sustituido o un grupo bencilo el cual puede ser sustituido.
9. El método de manufacturación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizado porque la etapa de desprotección es una etapa de desprotección usando un ácido.
10. Un método para manufacturar un complejo de metal, caracterizado porque comprende: una etapa de hacer reaccionar el compuesto representado por la Fórmula [11] o una sal del mismo obtenida por el método de manufacturación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 con un ion de metal.
11. El método de manufacturación de conformidad con la reivindicación 10, en caracterizado porque la reacción se lleva a cabo en presencia de una solución amortiguadora en 0°C a 150°C durante 5 a 60 minutos.
12. Un compuesto representado por la fórmula [11] o una sal del mismo

Ref. Expediente N° NC2017/0010806



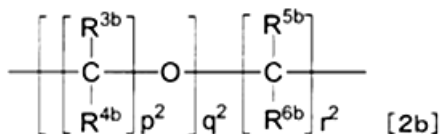
(en la fórmula,

L1 representa un grupo representado por la Fórmula [2a]



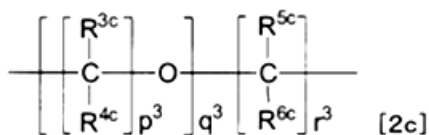
(en la fórmula, R^{3a}, R^{4a}, R^{5a}, y R^{6a} son los mismos que o diferentes uno del otro y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆; p¹ representa un número entero de 1 a 3; q¹ representa un número entero de 0 a 3; y r¹ representa un número entero de 1 a 6); y

L² representa un grupo representado por la Fórmula [2b]



(en la fórmula, R^{3b}, R^{4b}, R^{5b}, y R^{6b} son los mismos que o diferentes uno del otro y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆; p² representa un número entero de 1 a 3; q² representa un número entero de 0 a 3; y r² representa un número entero de 1 a 6); y

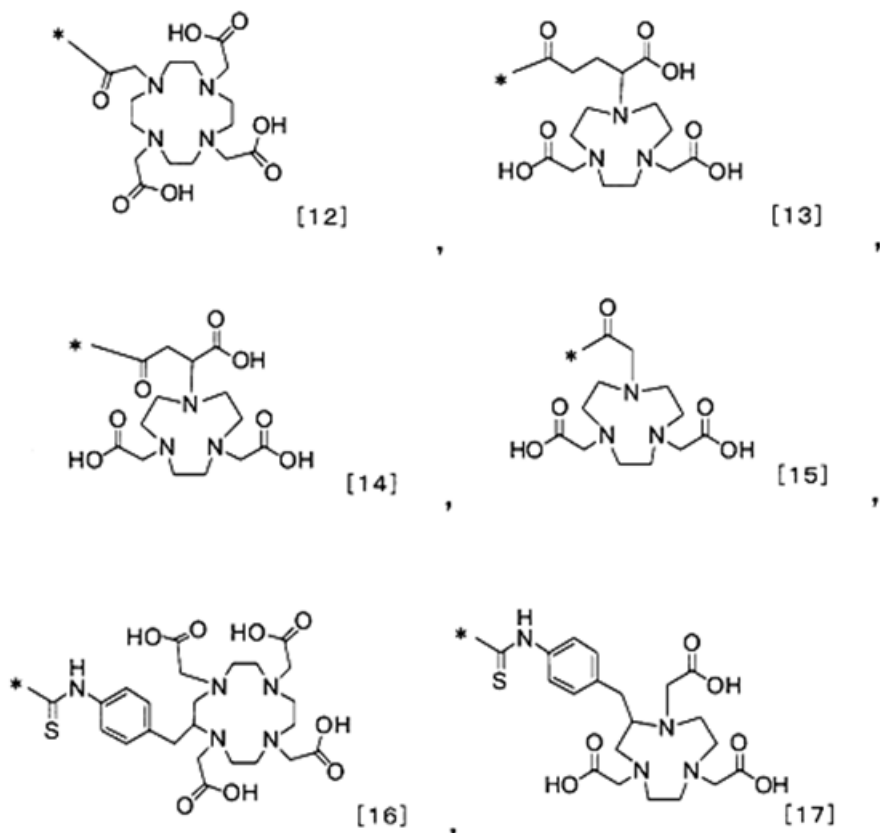
L³ representa un grupo representado por la Fórmula [2c]



(en la fórmula, R^{3c}, R^{4c}, R^{5c}, y R^{6c} son los mismos que o diferentes uno del otro y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆; p³ representa un número entero de 1 a 3; q³ representa un número entero de 0 a 3; y r³ representa un número entero de 1 a 6); y

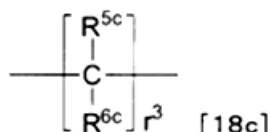
A² representa cualquiera de los grupos representados por la Fórmula [12] a [17]

Ref. Expediente N° NC2017/0010806



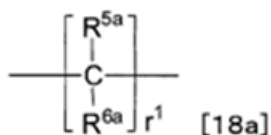
(en las fórmulas, * representa una posición de enlace);
m representa un número entero de 1 a 3)).

- 13.El compuesto de conformidad con la reivindicación 12 o una sal del mismo, caracterizado porque L³ es un grupo representado por la Fórmula [18c]



(en la fórmula, R^{5c} y R^{6c} pueden ser los mismos que o diferentes uno del otro y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆; y r³ representa un número entero de 1 a 6).

- 14.El compuesto de conformidad con la reivindicación 12 o 13, o una sal del mismo, caracterizado porque L¹ es un grupo representado por la Fórmula [18a]



(en la fórmula, R^{5a} y R^{6a} pueden ser los mismos que o diferentes uno del otro y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C₁₋₆; y r¹ representa un número entero de 1 a 6).

- 15.El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 12 a 14 o una sal del mismo, caracterizado porque L² representa un grupo representado por la Fórmula [18b].

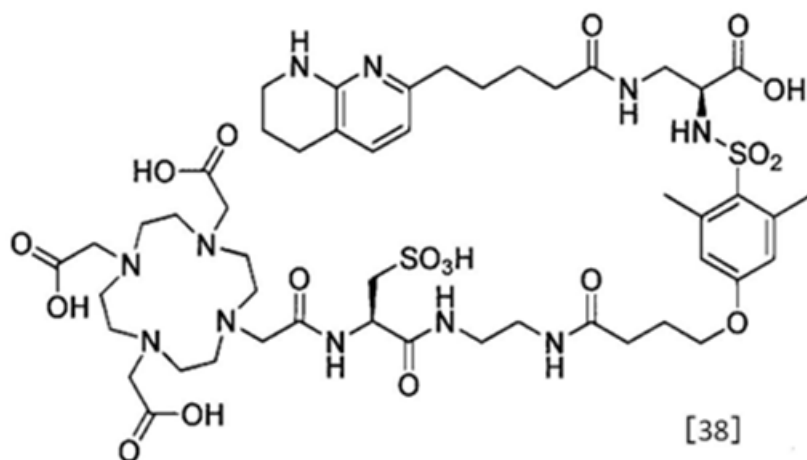
Resolución N° 37700

Ref. Expediente N° NC2017/0010806



(en la fórmula, R^{5b} y R^{6b} pueden ser los mismos que o diferentes uno del otro y representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C_{1-6} ; y r^2 representa un número entero de 1 a 6).

16. Un compuesto representado por la Fórmula [38] o una sal del mismo.



17. Un complejo del compuesto de conformidad con la reivindicación 12 a 16, o la sal con un metal.
18. El complejo de conformidad con la reivindicación 17, caracterizado porque el metal es un metal radioactivo citotóxico.
19. El complejo de conformidad con la reivindicación 18, caracterizado porque el metal radioactivo citotóxico es núclido que emite rayos α o núclido que emite rayos β .
20. El complejo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 18 o 19, caracterizado porque el metal radioactivo citotóxico es ^{90}Y , $^{114\text{m}}\text{In}$, $^{117\text{m}}\text{Sn}$, ^{186}Re , ^{188}Re , ^{64}Cu , ^{67}Cu , ^{59}Fe , ^{89}Sr , ^{198}Au , ^{203}Hg , ^{212}Pb , ^{165}Dy , ^{103}Ru , ^{149}Tb , ^{161}Tb , ^{212}Bi , ^{166}Ho , ^{165}Er , ^{153}Sm , ^{177}Lu , ^{213}Bi , ^{223}Ra , ^{225}Ac , o ^{227}Th .
21. El complejo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 18 a 20, caracterizado porque el metal radioactivo citotóxico es ^{64}Cu , ^{67}Cu , ^{90}Y , ^{153}Sm , ^{166}Ho , ^{177}Lu , o ^{225}Ac .
22. El complejo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 18 a 21, caracterizado porque el compuesto es ácido 2,2',2''-(10-(2-(((R)-1-((2-(4-(4-(N-((S)-1-carboxi-2-(5-(5,6,7,8-tetrahidro-1,8-naftiridin-2-il)pentanamida)etil)sulfamoi)-3,5-dimetilfenoxi)butanamida)etil)amino)-1-oxo-3-sulfopropan-2-il)amino)-2-oxoetil)-1,4,7,10-tetraazaciclododecan-1,4,7-triil)triacético, y el metal radioactivo citotóxico es ^{177}Lu .
23. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende el complejo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 18 a 22.
24. El complejo de conformidad con la reivindicación 17, caracterizado porque el metal es un metal radioactivo no citotóxico.
25. El complejo de conformidad con la reivindicación 24, caracterizado porque el metal radioactivo no citotóxico es un núclido que emite rayos gamma o un núclido que emite positrón.

Ref. Expediente N° NC2017/0010806

26. El complejo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 24 o 25, caracterizado porque el metal radioactivo no citotóxico es un complejo de aluminio ^{18}F , un complejo de galio ^{18}F , un complejo de indio ^{18}F , un complejo de lutito ^{18}F , complejo de talio ^{18}F , $^{99\text{m}}\text{Tc}$, ^{111}In , $^{113\text{m}}\text{In}$, $^{114\text{m}}\text{In}$, ^{67}Ga , ^{68}Ga , ^{82}Rb , ^{86}Y , ^{87}Y , ^{152}Tb , ^{155}Tb , ^{201}Tl , ^{51}Cr , ^{52}Fe , ^{57}Co , ^{58}Co , ^{60}Co , ^{82}Sr , ^{85}Sr , ^{197}Hg , ^{44}Sc , ^{62}Cu , ^{64}Cu , o ^{89}Zr .
27. El complejo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 24 a 26, caracterizado porque el metal radioactivo no citotóxico es un complejo de aluminio ^{18}F , ^{111}In , ^{67}Ga , ^{68}Ga , ^{64}Cu , o ^{89}Zr .
28. El complejo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 24 a 27, caracterizado porque el compuesto es ácido 2,2',2''-(10-(2-(((R)-1-((2-(4-(4-(N-((S)-1-carboxi-2-(5-(5,6,7,8-tetrahidro-1,8-naftiridin-2-il)pentanamida)etil)sulfamoil)-3,5-dimetilfenoxi)butanamida)etil)amino)-1-oxo-3-sulfopropan-2-il)amino)-2-oxoetil)-1,4,7,10-tetraazaciclododecan-1,4,7-triil)triacético, y el metal radioactivo no citotóxico es ^{68}Ga .
29. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende el complejo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 24 a 28.