



Superintendencia de
Industria y Comercio



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 80929

Ref. Expediente N° NC2021/0016967

Por la cual se otorga una Patente de Invención

LA 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 14 de diciembre de 2021 con el N° NC2021/0016967, por F. HOFFMANN-LA ROCHE AG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “NUEVOS INHIBIDORES DE EGFR”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2020/067055 del 19 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° NC2022/0004905 el 19 de abril de 2022, presentó las reivindicaciones 1 a 3 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 3 presentes en el radicado N° NC2022/0004905 el 19 de abril de 2022, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que se refiere Compuestos derivados de 1-oxo isoindolin-2-il]-2-(6,7-dihidro-5H-pirrol[1,2-c]imidazol-1-il)-N-tiazol-2-il-acetamida como inhibidores de EGFR que contiene sustituyentes CHF_2/CF_3 sobre el anillo de benzoindolinona, útil en la inhibición alostérica selectiva de mutantes de EGFR, que difiere de la información del estado de la técnica más cercano WO2018220149 en que los compuestos de la solicitud comprenden un anillo de pirrol[1,2-c]imidazol, mientras que en el documento referido como estado de la técnica más cercano, en la misma posición hay un anillo de benceno.

Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia que los compuestos reclamados, muestran una actividad inhibitoria mejorada de EGFR (por ejemplo, IC_{50} = entre 1 y 20 nM, compuestos 2 a 11), frente a valores de actividad inhibitoria de EGFR (entre 10 y 70 nM, compuestos 1 a 31, Tabla 1, Pág. 22 a 26 divulgados en WO2018220149) así como formulaciones



Resolución N° 80929

Ref. Expediente N° NC2021/0016967

farmacéuticas para el tratamiento del cáncer y de enfermedades asociadas a la expresión del receptor EGFR (tabla 1, páginas 10 a 13).

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 3 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 1-OXO ISOINDOLIN-2-IL]-2-(6,7-DIHIDRO-5H-PIRROLO[1,2-C]IMIDAZOL-1-IL)-N-TIAZOL-2-IL-ACETAMIDA ÚTILES COMO INHIBIDORES DE EGFR”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, la 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 1-OXO ISOINDOLIN-2-IL]-2-(6,7-DIHIDRO-5H-PIRROLO[1,2-C]IMIDAZOL-1-IL)-N-TIAZOL-2-IL-ACETAMIDA ÚTILES COMO INHIBIDORES DE EGFR”.

Clasificación IPC: A61P 35/00, C07D 417/14, A61K 31/427.

Reivindicaciones: 1 a 3 incluidas en el radicado bajo el No NC2022/0004905 el 19 de abril de 2022 de acuerdo con el Anexo No. 1.

Titular: F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.

Dirección: GRENZACHERSTRASSE 124, 4070 BASEL, SUIZA.

Inventores: Christa Ulrike OBST SANDER, Antonio RICCI, Daniel RUEHER, Sandra STEINER, Cosimo DOLENTE, Annick GOERGLER, David Stephen HEWINGS, Georg JAESCHKE, Bernd KUHN, Yvonne Alice NAGEL y Roger David NORCROSS.

Prioridad N° 21/06/2019, EPO, 19181772.5.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2020/067055

Fecha: 19 de junio de 2020.

Vigente desde: 19 de junio de 2020

Hasta: 19 de junio de 2040.

Resolución N° 80929

Ref. Expediente N° NC2021/0016967

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 F. HOFFMANN-LA ROCHE AG advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante la 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 19 de diciembre de 2024

LA SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



Firmado digitalmente
por: CIELO ELAINNE
RUSINQUE URREGO
Fecha: 2024.12.19
17:03:18 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

Ref. Expediente N° NC2021/0016967

ANEXO No. 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto seleccionado de

2-(6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-c]imidazol-1-il)-2-[6-[4-(1-etil-4-piperidil)fenil]-1-oxo-4-(trifluorometil) isoindolin-2-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-(6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-c]imidazol-1-il)-2-[6-[2-[4-[[4-(hidroximetil)-1-piperidil]metil]fenil]etinil]-1-oxo-4-(trifluorometil)isoindolin-2-il]-N-tiazol-2-ilacetamida;

2-[4-(difluorometil)-6-[4-(1-etil-4-piperidil)fenil]-1-oxo-isoindolin-2-il]-2-(6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-c]imidazol-1-il)-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[4-(difluorometil)-6-[2-[4-[[4-(hidroximetil)-1-piperidil]metil]fenil]etinil]-1-oxoisoindolin-2-il]-2-(6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-c]imidazol-1-il)-N-tiazol-2-ilacetamida;

2-[6-[2-[4-[[4-(hidroximetil)-1-piperidil]metil]fenil]etinil]-1-oxo-4-(trifluorometil)isoindolin-2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[4-(difluorometil)-6-[4-(1-etil-4-piperidil)fenil]-1-oxo-isoindolin-2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[4-(difluorometil)-1-oxo-6-[4-[rac-(3R,4R)-1-etil-3-fluoro-4-piperidil]fenil]isoindolin-2-il]-2-(6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-c]imidazol-1-il)-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[6-[2-[4-[(6-hidroxi-2-azaspiro[3.3]heptan-2-il)metil]fenil]etinil]-1-oxo-4-(trifluorometil)isoindolin-2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[4-(difluorometil)-6-[2-[4-[[4-(hidroximetil)-1-piperidil]metil]fenil]etinil]-1-oxoisoindolin-2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[6-[2-[4-[(4-hidroxiazepan-1-il)metil]fenil]etinil]-1-oxo-4-(trifluorometil)isoindolin-2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolol[1,2-

Resolución N° 80929

Ref. Expediente N° NC2021/0016967

c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

O sales farmacéuticamente aceptables.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionado de

2-(6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il)-2-[6-[4-(1-etil-4-piperidil)fenil]-1-oxo-4-(trifluorometil) isoindolin-2-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-(6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il)-2-[6-[2-[4-[[4-(hidroximetil)-1-piperidil]metil]fenil]etinil]-1-oxo-4-(trifluorometil)isoindolin-2-il]-N-tiazol-2-ilacetamida;

2-[4-(difluorometil)-6-[4-(1-etil-4-piperidil)fenil]-1-oxo-isoindolin-2-il]-2-(6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il)-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[4-(difluorometil)-6-[2-[4-[[4-(hidroximetil)-1-piperidil]metil]fenil]etinil]-1-oxoisoindolin-

2-il]-2-(6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il)-N-tiazol-2-ilacetamida;

2-[6-[2-[4-[[4-(hidroximetil)-1-piperidil]metil]fenil]etinil]-1-oxo-4-(trifluorometil)isoindolin-2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[4-(difluorometil)-6-[4-(1-etil-4-piperidil)fenil]-1-oxo-isoindolin-2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[4-(difluorometil)-1-oxo-6-[4-[rac-(3R,4R)-1-etil-3-fluoro-4-piperidil]fenil]isoindolin-2-il]-2-(6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il)-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[6-[2-[4-[(6-hidroxi-2-azaspiro[3.3]heptan-2-il)metil]fenil]etinil]-1-oxo-4-(trifluorometil)isoindolin-2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[4-(difluorometil)-6-[2-[4-[[4-(hidroximetil)-1-piperidil]metil]fenil]etinil]-1-oxoisoindolin-

2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida;

2-[6-[2-[4-[(4-hidroxiazepan-1-il)metil]fenil]etinil]-1-oxo-4-(trifluorometil)isoindolin-2-il]-2-[rac-(6R)-6-fluoro-6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-1-il]-N-tiazol-2-il-acetamida.

Resolución N° 80929

Ref. Expediente N° NC2021/0016967

3. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2 y un vehículo terapéuticamente inerte.

