

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 15798

Ref. Expediente N° NC2020/0009625

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 3 de agosto de 2020 con el N° NC2020/0009625, por UNIVERSITÄT HEIDELBERG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “INHIBIDOR DE FAP”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2019/052952 del 6 de febrero de 2019.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 901 el 21 de agosto de 2020, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 15905 del 06 de septiembre de 2024, 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° NC2020/0009625 del 31 de diciembre de 2024, respondió oportunamente el requerimiento formulado y 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 respecto a las objeciones realizadas mediante el Oficio N° 15905 de 06 de septiembre de 2024, las reivindicaciones 1 a 16 incluidas en el radicado N° NC2020/0009625 el 31 de diciembre de 2024 superan las objeciones realizadas por Artículo 30 de la Decisión 486 en relación a la falta de concisión, porque el radical R⁸ se ha limitado a únicamente un agente quelante. Adicionalmente, se superan las objeciones por Artículo 28 de la Decisión 486, respecto a la falta de suficiencia, debido a que se retiraron las características que hacían referencia a los “hidratos” y “solvatos” de las reivindicaciones.

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 16 incluidas en el radicado bajo el N° NC2020/0009625 el 31 de diciembre de 2024, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a compuestos derivados de N-(2-(2-cianopirrolidin-1-il)-2-oxoetil)quinolin-4-carboxamida que se unen de manera covalente a un agente quelante y que están etiquetados a un radiofármaco, junto con composiciones farmacéuticas que los comprenden, que difieren del estado de la técnica más cercano,

Ref. Expediente N° NC2020/0009625

Dvorākova P. *et al.*, *J. Med. Chem*¹, en el residuo R⁸ que es un agente quelante etiquetado con un radiofármaco; en el enlazador específico de R⁸ que comprende un propileno-piperazina; y en que el enlazador se une a la posición 6-quinolilo de la molécula.

Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia que los compuestos de la presente invención permiten una mayor captación y, por tanto, un mayor tiempo de retención de la porción informadora R⁸ en la célula. Lo anterior se puede evidenciar en los nuevos datos de prueba suministrados por el solicitante en la respuesta al examen de fondo radicada bajo el N° NC2020/0009625 el 31 de diciembre de 2024; por ejemplo el compuesto FAPI-46 mostró proporciones sustancialmente mejores de captación tumoral respecto a la sanguínea, hepática, muscular e intestinal, con valores de AUC (Área Bajo la Curva) de 76.63 vs 27.22, 39.67, 17.82 y 15.80, respectivamente (Anexo I, Tabla 2). Estos datos de la laboratorio permiten concluir que dichos compuestos son efectivos para internalizarse rápidamente en tumores frente a otros tejidos, lo que permite una aplicación en el diagnóstico de pacientes con cáncer.

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 la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2020/0009625 el 31 de diciembre de 2024 y teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS DERIVADOS DE N-(2-(2-CIANOPIRROLIDIN-1-IL)-2-OXOETIL)QUINOLIN-4-CARBOXAMIDA QUE SE UNEN A LA PROTEÍNA ACTIVADORA DE FIBROBLASTOS (FAP), CON UTILIDAD EN EL DIAGNÓSTICO Y EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES NO MALIGNAS”.

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 N-(2-(2-CIANOPIRROLIDIN-1-IL)-2-OXOETIL)QUINOLIN-4-CARBOXAMIDA QUE SE UNEN A LA PROTEÍNA ACTIVADORA DE FIBROBLASTOS (FAP), CON UTILIDAD EN EL DIAGNÓSTICO Y EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES NO MALIGNAS”

Clasificación IPC: C07D 401/12, C07D 401/14, C07D 405/14, A61K 31/4709, A61P 35/00.

Reivindicaciones: 1 a 16 incluidas en el radicado bajo el N° NC2020/0009625 el 31 de diciembre de 2024, de acuerdo con el Anexo 1.

¹ Dvorākova P. *et al.* (27/09/2017). Inhibitor-Decorated Polymer Conjugates Targeting Fibroblast Activation Protein. *Journal of Medicinal Chemistry*. Volumen 60 (20). Páginas 8385-8393. DOI: <https://doi.org/10.1021/acs.jmedchem.7b00767>

Resolución N° 15798

Ref. Expediente N° NC2020/0009625

Titular: UNIVERSITÄT HEIDELBERG.

Dirección: GRABENGASSE 1, HEIDELBERG, 69117, ALEMANIA.

Inventores: Uwe HABERKORN, Thomas LINDNER, Walter MIER, Frederik GIESEL, Anastasia LOKTEV y Clemens KRATOCHWIL.

Prioridades N°: 06/02/2018, EP, 18155419.7.
06/02/2018, EP, 18155420.5.
10/10/2018, EP, 18199641.4.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2019/052952

Fecha: 6 de febrero de 2019.

Vigente desde: 6 de febrero de 2019

Hasta: 6 de febrero de 2039.

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 UNIVERSITÄT HEIDELBERG 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 27 de marzo de 2025

LA SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



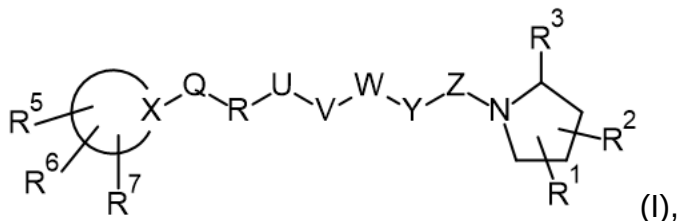
Firmado digitalmente
por: CIELO ELAINNE
RUSINQUE URREGO
Fecha: 2025.03.27
17:03:09 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

Ref. Expediente N° NC2020/0009625

ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un compuesto de fórmula (I)



En donde

Q, R, U están ausentes;

V es C=O;

W es NH;

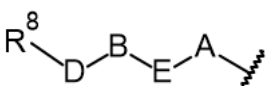
Y es CH₂;

Z es C=O;

R¹ y R² se seleccionan independientemente del grupo formado por -H y fluoro;

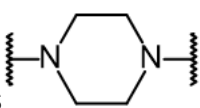
R³ es -CN;

R⁵ y R⁶ son H;

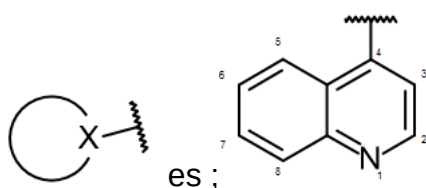
R⁷ es , en donde
D está ausente;

A es O o NCH₃;

E es propileno;

B es , y R⁷ está unido a la posición 6-quinolilo;

R⁸ es un agente quelante; y

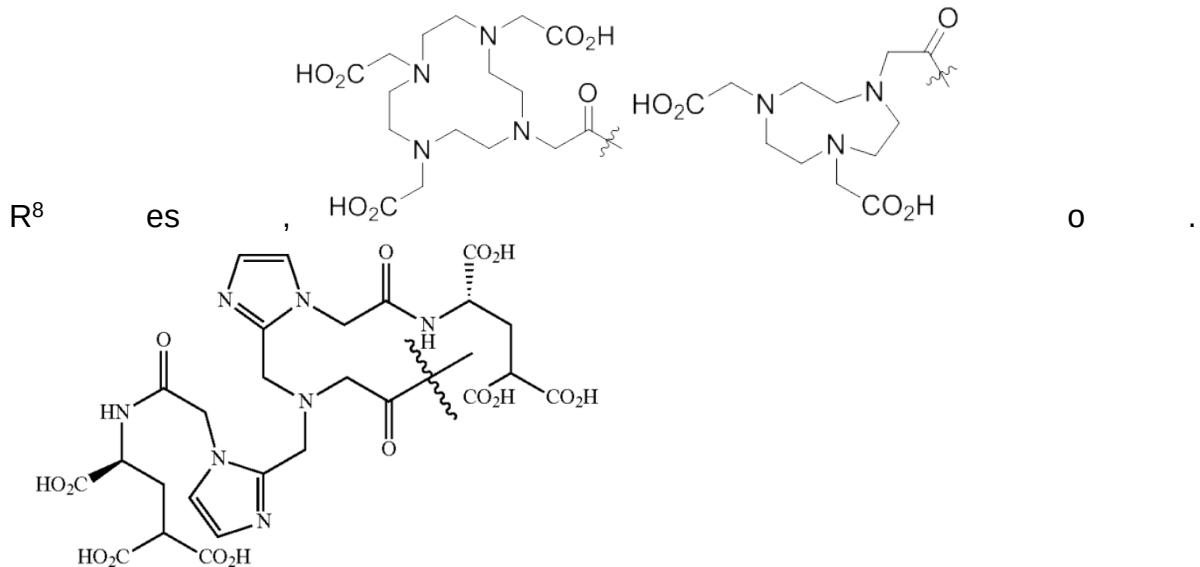


o un tautómero, racemato o sal del mismo farmacéuticamente aceptable.

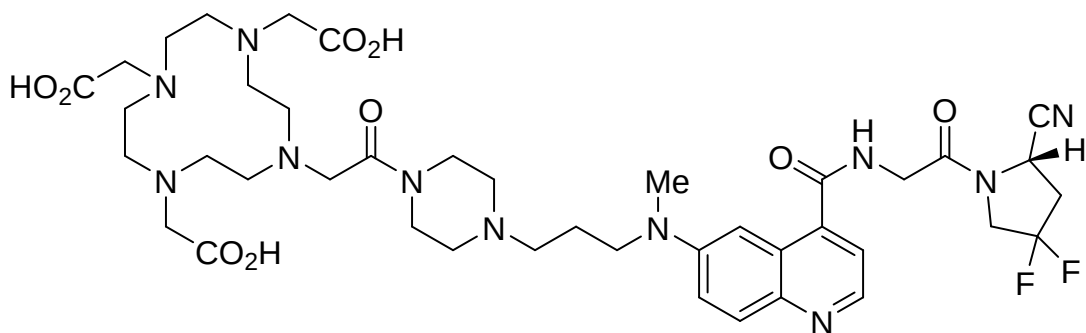
2. El compuesto de la reivindicación 1, en donde el R⁸ es un agente quelante seleccionado del grupo que consiste en ácido 1,4,7,10-tetraazaciclododecano-N,N',N,N'-tetraacético (DOTA), ácido etilendiaminotetraacético (EDTA), ácido 1,4,7-triazaciclononano-1,4,7-triacético (NOTA), trietilentetramina (TETA), ácido

Ref. Expediente N° NC2020/0009625

iminodiacético, ácido dietilentriamin-N,N,N',N',N''-pentaacético (DTPA), bis-(carboximetilimidazol)glicina y ácido 6-hidrazinopiridin-3-carboxílico (HYNIC), o



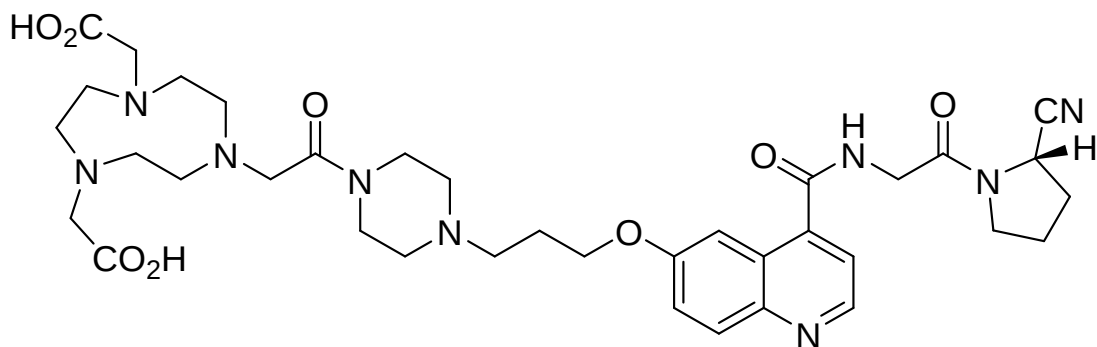
3. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la siguiente fórmula:



4. El compuesto de la reivindicación 3, que está etiquetado con ⁶⁸Ga o ⁹⁰Y.

5. El compuesto de la reivindicación 3, que está etiquetado con ⁶⁸Ga.

6. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la siguiente fórmula:

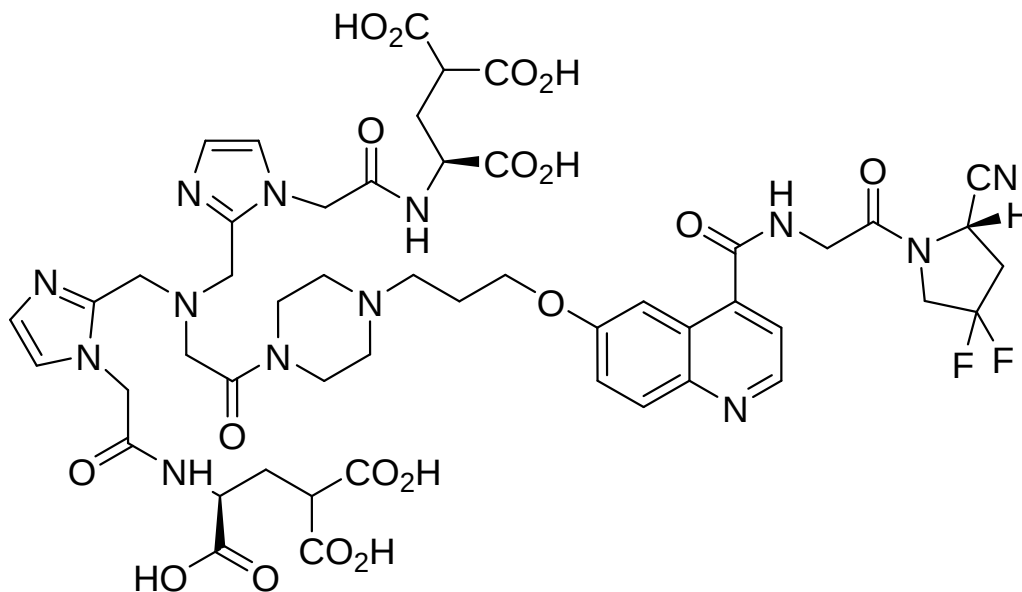


7. El compuesto de la reivindicación 6, que está etiquetado con ¹⁸F, ⁶⁴Cu, o ⁶⁸Ga.

8. El compuesto de la reivindicación 6, que está etiquetado con ¹⁸F.

Ref. Expediente N° NC2020/0009625

9. El compuesto de la reivindicación 1 que tiene la siguiente fórmula:



10. El compuesto de la reivindicación 9, que está etiquetado con ^{99m}Tc .

11. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R^8 comprende una porción radiactiva.

12. El compuesto de la reivindicación 11, en donde la molécula radiactiva se selecciona del grupo que consiste en ^{11}C , ^{18}F , Al^{18}F , ^{51}Cr , ^{67}Ga , ^{68}Ga , ^{111}In , ^{99m}Tc , ^{186}Re , ^{188}Re , ^{139}La , ^{140}La , ^{175}Yb , ^{153}Sm , ^{166}Ho , ^{88}Y , ^{90}Y , ^{149}Pm , ^{165}Dy , ^{169}Er , ^{177}Lu , ^{47}Sc , ^{142}Pr , ^{159}Gd , ^{212}Bi , ^{213}Bi , ^{72}As , ^{72}Se , ^{97}Ru , ^{109}Pd , ^{105}Rh , ^{101m}Rh , ^{119}Sb , ^{128}Ba , ^{123}I , ^{124}I , ^{131}I , ^{197}Hg , ^{211}At , ^{151}Eu , ^{153}Eu , ^{169}Eu , ^{201}Tl , ^{203}Pb , ^{212}Pb , ^{64}Cu , ^{67}Cu , ^{188}Re , ^{186}Re , ^{198}Au , ^{225}Ac , ^{227}Th y ^{199}Ag .

13. Una composición farmacéutica que comprende al menos un compuesto según la reivindicación 1; y un portador farmacéuticamente aceptable.

14. La composición farmacéutica según la reivindicación 13 que comprende al menos un compuesto según la reivindicación 3 o 5; y un portador farmacéuticamente aceptable.

15. La composición farmacéutica según la reivindicación 13 que comprende al menos un compuesto según la reivindicación 6 u 8; y un portador farmacéuticamente aceptable.

16. La composición farmacéutica según la reivindicación 13 que comprende al menos un compuesto según la reivindicación 9 o 10; y un portador farmacéuticamente aceptable.