

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 17969

Ref. Expediente N° NC2022/0007924

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 junio de 2022 con el N° NC2022/0007924, por EISAI R&D MANAGEMENT CO., LTD., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “CONJUGADOS DE ANTICUERPO Y FÁRMACO DE ERIBULINA ANTI-MESOTELINA Y MÉTODOS DE USO”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/IB2020/000917 del 6 de noviembre de 2020.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 966 el 30 de junio de 2022, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 11144 de 16 de julio de 2025, 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° NC2022/0007924 del 24 de noviembre de 2025, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 35 que reemplazan las originalmente presentadas. Posteriormente, mediante escrito radicado bajo el N° NC2025/0016244 el 25 de noviembre de 2025, el solicitante presentó las reivindicaciones 1 a 35 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 respecto a las objeciones realizadas mediante el Oficio N° 11144 de 16 de julio de 2025, las reivindicaciones 1 a 35 incluidas en el radicado N° NC2025/0016244 el 25 de noviembre de 2025 superan las objeciones por Artículo 30 de la Decisión 486 por falta de claridad y sustento porque, el anticuerpo de unión a mesotelina y el conjugado que lo comprende se definen mediante todas sus características técnicas esenciales estructurales (SEQ ID NO) específicas y, tal objeto, tiene sustento en la descripción.

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,*

Ref. Expediente N° NC2022/0007924

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 las reivindicaciones 1 a 35 incluidas en el radicado N° NC2025/0016244 el 25 de noviembre de 2025 cumplen los requisitos previstos anteriormente, toda vez que se refieren a un anticuerpo capaz de unirse a mesotelina y a un conjugado de anticuerpo fármaco que lo comprende, en donde el anticuerpo tiene tres regiones determinantes de complementariedad de cadena pesada SEQ ID NO: 1 (HCDR1), SEQ ID NO: 2 (HCDR2) y SEQ ID NO: 3 (HCDR3); y tres regiones determinantes de complementariedad de cadena ligera SEQ ID NO: 4 (LCDR1), SEQ ID NO: 5 (LCDR2) y SEQ ID NO: 6 (LCDR3), según lo definido por el sistema de numeración de Kabat; o tres regiones determinantes de complementariedad de cadena pesada SEQ ID NO: 7 (HCDR1), SEQ ID NO: 8 (HCDR2) y SEQ ID NO: 9 (HCDR3); y tres regiones determinantes de complementariedad de cadena ligera SEQ ID NO: 10 (LCDR1), SEQ ID NO: 11 (LCDR2) y SEQ ID NO: 12 (LCDR3), según lo definido por el sistema de numeración IMGT, que difiere de la información del estado de la técnica más cercano Zhao, X. Y., *et al.*, (2016)¹ en que el anticuerpo de la solicitud, comprende diferentes secuencias para sus seis regiones determinantes de complementariedad (CDR's).

Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia que el anticuerpo reclamado: (i) se une a la mesotelina humana con alta afinidad con valores para las constantes de afinidad (K_D) en el rango picomolar y con mayor especificidad que los anticuerpos conocidos en el estado de la técnica, incrementando la selectividad tumoral y reduciendo la unión a otras proteínas para generar menor toxicidad sistémica (Pág. 119, Tabla 15); (ii) permite una internalización eficiente tras la unión a la mesotelina y la liberación intracelular de la eribulina conjugada lo cual genera una acción citotóxica localizada, reduce la actividad fuera del tumor y aumenta la eficacia incluso en tumores con expresión moderada de mesotelina (MSLN) (Pág. 133, Tabla 17); (iii) permite la liberación controlada y eficiente del fármaco gracias a los enlazadores escindibles que son estables extracelularmente, escindidos específicamente en compartimientos lisosomales y no modifican el fármaco, lo cual minimiza la toxicidad sistémica, optimiza la entrega intracelular del fármaco y controla la citotoxicidad inespecífica (Págs. 137 a 151, Tabla 18); (iv) posee mayor estabilidad estructural en plasma y bajas tasas de agregación en su forma de conjugado de anticuerpo fármaco con perfiles fisicoquímicos superiores a los de otros conjugados alternativos conocidos en el estado de la técnica, lo que confiere mayor vida media, menor liberación prematura de eribulina y mejor manufacturabilidad y formulabilidad (Págs. 157 a 163, Tablas 22 y 23) y (v) posee mayor eficacia antitumoral con mejor toxicidad *in vivo* e *in vitro*, particularmente, una alta citotoxicidad en células MSLN+ y una actividad antitumoral robusta en múltiples modelos de xenoinjerto sin evidencia de una pérdida de peso significativa en los individuos evaluados con respecto a anticuerpos anti-mesotelina y conjugados alternativos conocidos en el estado de la técnica (Pág. 169 a 172, Párrs. [00290]- [00297]). Estas pruebas de laboratorio demuestran el potencial del anticuerpo y el conjugado para reconocer y atacar únicamente a las células tumorales, liberando el fármaco de forma controlada dentro de ellas; además, su diseño estable y preciso reduce efectos secundarios convirtiéndolo en una opción terapéutica más segura y eficaz para diversos tipos de cáncer.

¹ Zhao, X. Y., Subramanyam, B., Sarapa, N., Golfier, S., & Dinter, H. (2016). Novel Antibody Therapeutics Targeting Mesothelin in Solid Tumors. *Clinical cancer drugs*, 3(2), 76–86. Recuperado desde: <https://doi.org/10.2174/2212697X03666160218215744>

Ref. Expediente N° NC2022/0007924

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 35 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° NC2022/0007924 del 24 de noviembre de 2025 y teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “CONJUGADOS DE ANTICUERPO Y FÁRMACO DE ERIBULINA ANTI-MESOTELINA”.

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:

“CONJUGADOS DE ANTICUERPO Y FÁRMACO DE ERIBULINA ANTI-MESOTELINA”

Clasificación IPC: C07K 16/28, C07K 16/30, A61K 47/68, A61K 39/395, A61P 35/00.

Reivindicaciones: 1 a 35 incluidas en el radicado bajo el N° NC2025/0016244 el 25 de noviembre de 2025, de acuerdo con el Anexo N° 1.

Titular: EISAI R&D MANAGEMENT CO., LTD.

Dirección: 6-10, KOISHIKAWA 4-CHOME, BUNKYO-KU, TOKYO, 112-8088 JAPÓN.

Inventores: Earl ALBONE y Jared SPIDEL.

Prioridad N°: 07/11/2019, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/932,373.

Solicitud internacional N°: PCT/IB2020/000917 **Fecha:** 06 de noviembre de 2020.

Vigente desde: 6 de noviembre de 2020 **Hasta:** 06 de noviembre 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 cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

Ref. Expediente N° NC2022/0007924

ARTÍCULO 3: Notificar el contenido de la presente resolución a EISAI R&D MANAGEMENT CO., LTD. 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 12 de marzo de 2026

LA SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



Firmado digitalmente
por: CIELO ELAINNE
RUSINQUE URREGO
Fecha: 2026.03.12
23:02:13 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

Ref. Expediente N° NC2022/0007924

ANEXO N° 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un anticuerpo aislado o fragmento de unión a antígeno, en donde el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno es capaz de unirse a la mesotelina y comprende
 - a) tres regiones determinantes de complementariedad de cadena pesada que comprenden las secuencias de aminoácidos de la SEQ ID NO: 1 (HCDR1), SEQ ID NO: 2 (HCDR2) y SEQ ID NO: 3 (HCDR3); y tres regiones determinantes de complementariedad de cadena ligera que comprenden las secuencias de aminoácidos de la SEQ ID NO: 4 (LCDR1), SEQ ID NO: 5 (LCDR2) y SEQ ID NO: 6 (LCDR3), según lo definido por el sistema de numeración de Kabat; o tres regiones determinantes de complementariedad de cadena pesada que comprenden las secuencias de aminoácidos de la SEQ ID NO: 7 (HCDR1), SEQ ID NO: 8 (HCDR2) y SEQ ID NO: 9 (HCDR3); y tres regiones determinantes de complementariedad de cadena ligera que comprenden las secuencias de aminoácidos de la SEQ ID NO: 10 (LCDR1), SEQ ID NO: 11 (LCDR2) y SEQ ID NO: 12 (LCDR3), según lo definido por el sistema de numeración IMGT.
2. El anticuerpo o fragmento de unión a antígeno de la reivindicación 1, en donde el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno comprende una región variable de cadena pesada que comprende una secuencia de aminoácidos de la SEQ ID NO: 13, y una región variable de cadena ligera que comprende una secuencia de aminoácidos de la SEQ ID NO: 14.
3. El anticuerpo o fragmento de unión a antígeno de la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en donde el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno comprende una región constante de cadena pesada de IgG1 humana y una región constante de cadena ligera kappa de Ig humana.
4. El anticuerpo o fragmento de unión a antígeno de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno comprende una cadena pesada que comprende una secuencia de aminoácidos de la SEQ ID NO: 17, y una cadena ligera que comprende una secuencia de aminoácidos de la SEQ ID NO: 18.
5. El anticuerpo o fragmento de unión a antígeno de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno está conjugado con un agente terapéutico.

Resolución N° 17969

Ref. Expediente N° NC2022/0007924

6. El anticuerpo o fragmento de unión a antígeno de la reivindicación 5, en donde el agente terapéutico es la eribulina.

7. Un conjugado de anticuerpo y fármaco de Fórmula (I):

$Ab-(L-D)_p$ (I)

en donde

Ab es un anticuerpo o fragmento de unión a antígeno, en donde el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno es capaz de unirse a la mesotelina y comprende tres regiones determinantes de complementariedad de cadena pesada que comprenden las secuencias de aminoácidos de la SEQ ID NO: 1 (HCDR1), SEQ ID NO: 2 (HCDR2) y SEQ ID NO: 3 (HCDR3); y tres regiones determinantes de complementariedad de cadena ligera que comprenden las secuencias de aminoácidos de la SEQ ID NO: 4 (LCDR1), SEQ ID NO: 5 (LCDR2) y SEQ ID NO: 6 (LCDR3), según lo definido por el sistema de numeración de Kabat; o tres regiones determinantes de complementariedad de cadena pesada que comprenden las secuencias de aminoácidos de la SEQ ID NO: 7 (HCDR1), SEQ ID NO: 8 (HCDR2) y SEQ ID NO: 9 (HCDR3); y tres regiones determinantes de complementariedad de cadena ligera que comprenden las secuencias de aminoácidos de la SEQ ID NO: 10 (LCDR1), SEQ ID NO: 11 (LCDR2) y SEQ ID NO: 12 (LCDR3), según lo definido por el sistema de numeración IMGT;

D es un agente terapéutico;

L es un enlazador escindible que conecta covalentemente Ab a D, en donde el enlazador escindible comprende una fracción peptídica escindible; y

p es un número entero de 1 a 8.

8. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 7, en donde la fracción peptídica escindible es escindible mediante cathepsina.

9. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 7 o la reivindicación 8, en donde la fracción peptídica escindible comprende valina-citrulina (Val-Cit).

10. El conjugado de anticuerpo y fármaco de una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9, en donde el enlazador escindible comprende una unidad espaciadora.

11. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 10, en donde la unidad espaciadora comprende una fracción de polietilenglicol (PEG), en donde la fracción de PEG comprende $-(PEG)_m-$ y m es un número entero de 1 a 10.

Ref. Expediente N° NC2022/0007924

12. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 11, en donde m es 2.
13. El conjugado de anticuerpo y fármaco de una cualquiera de las reivindicaciones 10 a 12, en donde la unidad espaciadora se conecta al anticuerpo o al fragmento de unión a antígeno a través de una fracción de maleimida (Mal) ("unidad espaciadora Mal").
14. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 13, en donde la unidad espaciadora Mal se une al anticuerpo o fragmento de unión a antígeno a través de un resto de cisteína en el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno.
15. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 14, en donde el resto de cisteína es un resto de cisteína en la posición de aminoácido 80 de una región variable de cadena ligera en un anticuerpo o un fragmento de unión a antígeno de acuerdo con el sistema de numeración de Kabat ("LCcys80").
16. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 15, en donde p es 2, en donde cada fracción -L-D está conectada a una LCcys80 en el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno.
17. El conjugado de anticuerpo y fármaco de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 16, en donde el enlazador escindible comprende Mal-(PEG)₂-Val-Cit.
18. El conjugado de anticuerpo y fármaco de una cualquiera de las reivindicaciones 10 a 17, en donde una unidad espaciadora que conecta la fracción escindible en el enlazador a D es autoinmolable.
19. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 18, en donde la unidad espaciadora que conecta la fracción escindible en el enlazador a D comprende un p -aminobenciloxycarbonilo (pAB).
20. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 19, en donde el pAB conecta la fracción escindible en el enlazador a D.
21. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 19 o la reivindicación 20, en donde el enlazador escindible comprende Val-Cit-pAB.

Ref. Expediente N° NC2022/0007924

22. El conjugado de anticuerpo y fármaco de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 21, en donde D comprende un agente anti-tubulina.
23. El conjugado de anticuerpo y fármaco de cualquiera de las reivindicaciones 7 a 22, en donde D comprende eribulina.
24. El conjugado de anticuerpo y fármaco de la reivindicación 23, en donde el enlazador escindible comprende pAB, en donde el pAB se conecta covalentemente a eribulina a través de una amina C-35.
25. El conjugado de anticuerpo y fármaco de una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 24, en donde el enlazador escindible comprende Mal-(PEG)₂-Val-Cit-pAB.
26. El conjugado de anticuerpo y fármaco de una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 25, en donde el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno comprende una región variable de cadena pesada que comprende una secuencia de aminoácidos de la SEQ ID NO: 13, y una región variable de cadena ligera que comprende una secuencia de aminoácidos de la SEQ ID NO: 14.
27. El conjugado de anticuerpo y fármaco de una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 26, en donde el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno comprende una cadena pesada que comprende una secuencia de aminoácidos de la SEQ ID NO: 17, y una cadena ligera que comprende una secuencia de aminoácidos de la SEQ ID NO: 18.
28. El conjugado de anticuerpo y fármaco de una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 27, en donde p es 2 o 6.
29. Una composición farmacéutica que comprende el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, o el conjugado de anticuerpo y fármaco de una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 28, y un transportador farmacéuticamente aceptable.
30. La composición farmacéutica de la reivindicación 29, en donde la composición farmacéutica comprende más de una copia del conjugado de anticuerpo y fármaco, en donde el p promedio de los conjugados de anticuerpo y fármaco en la composición es de aproximadamente 1 a aproximadamente 6.

Ref. Expediente N° NC2022/0007924

31. La composición farmacéutica de la reivindicación 30, en donde el p promedio de los conjugados de anticuerpo y fármaco en la composición es de aproximadamente 1.9, aproximadamente 2.0, o aproximadamente 6.
32. Un ácido nucleico aislado que codifica el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4.
33. Un vector aislado que comprende el ácido nucleico de la reivindicación 32.
34. Una población celular que comprende el ácido nucleico de la reivindicación 32 o el vector de la reivindicación 33.
35. Un método de producción del anticuerpo o fragmento de unión a antígeno de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, que comprende cultivar la población celular de la reivindicación 34 en condiciones adecuadas para producir el anticuerpo o fragmento de unión a antígeno.