

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 55381

Ref. Expediente N° NC2021/0010312

*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 04 de agosto de 2021 con el N° NC2021/0010312, por AstraZeneca AB, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "INHIBIDORES DE LA PCSK9 Y MÉTODOS DE USO DE LOS MISMOS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2020/013881 del 16 de enero de 2020.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 939 el 20 de septiembre de 2021, habiéndose presentado oposición por parte de LABORATORIOS LEGRAND S.A., la cual una vez fue estudiada por esta Oficina, se estableció que no desvirtúa la patentabilidad del objeto en estudio como se analizará más adelante.

**Análisis de la Oposición**

**Argumentaciones de LABORATORIOS LEGRAND S.A.**

*El opositor argumentó en primer lugar que, los compuestos de fórmula (I) "(...) mencionan una gran cantidad de grupos funcionales y no indican el número de átomos de carbono de los sustituyentes. De acuerdo a lo anterior, el alcance de la reivindicación principal tiene una amplitud que excede irracionalmente lo extrapolable a los compuestos evaluados e incluye un número indeterminado de posibles compuestos".*

*En segundo lugar el opositor mencionó que, "La citada solicitud de patente en la reivindicación 19 enseña aproximadamente 300 compuestos diferentes los cuales comprenden una amplitud que incluye un alto número de compuestos. Adicionalmente, la reivindicación 20 reclama una composición farmacéutica que comprende un compuesto de la gran cantidad de compuestos reclamados por las reivindicaciones 1 a 19 y asimismo uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables, dentro de los cuales se incluyen componentes conocidos como ATORVASTATINA, ERTAPENEM y ROSUVASTATINA, tal se menciona en la descripción de la solicitud". Además, agregó que, "Aunque la reivindicación 1 cobija un gran número de compuestos derivados de la fórmula Markush, no todos gozan de soporte en la descripción".*

## Resolución N° 55381

Ref. Expediente N° NC2021/0010312

En tercer lugar el opositor señaló que, *“Lo revelado por el documento WO2005123686 en adelante Sircar et al, (...), anticipaba la materia reivindicada en la presente solicitud”* y que este documento, *“(…) divulga los compuestos correspondientes a la formula estructural de los compuestos reivindicados por la solicitud, por lo tanto, no pueden ser considerados como base de una actividad inventiva”*.

### Respuesta del solicitante a argumentos de LABORATORIOS LEGRAND S.A.

El solicitante manifestó que, *“A este respecto se desea llamar señalar que la reivindicación 1 ha sido modificada de modo que ahora se centra en los compuestos ejemplificados en los cuales hay un anillo de 4 a 8 miembros creado por la unión de  $R^1$  y  $R^1$ ”* y que, *“Frente lo anterior es pertinente señalar que el alcance de la nueva reivindicación 15 (basada en la antigua reivindicación 19) ha sido drásticamente limitado, haciéndola dependiente de la reivindicación 1 y eliminando aquellos compuestos que no se encuentran amparados por la estructura Markush que allí se reclama”*. Concluye mencionando que, *“En este sentido, me permito resaltar que los compuestos conocidos señalados por la Opositora no se mencionan en la antigua reivindicación 20 (nueva reivindicación 19), la cual se refiere a una composición que se caracteriza por comprender los novedosos compuestos de acuerdo con la invención”*.

En segundo lugar el solicitante aclaró que, *“(…) tal como puede observarse en el capítulo reivindicatorio presentado junto a este memorial, las combinaciones a las que el opositor hace referencia no se mencionan en ninguna de las reivindicaciones actuales. Por lo tanto, esta objeción tampoco es aplicable al presente caso”*.

En tercer lugar el solicitante manifestó que, *“La reivindicación 1 modificada se refiere a compuestos de Fórmula (I) en los que  $R^1$  y  $R^1$ , junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo cicloalquilo monocíclico o bicíclico de 4 a 8 miembros. Por el contrario, el compuesto E6 del documento WO2005123686 -señalado por el examinador- no tiene una estructura de anillo entre el grupo funcional NH y el grupo X (...)”* y que, *“Por lo tanto, la reivindicación 1 y sus reivindicaciones dependientes son nuevas respecto al documento WO2005123686”*. Además añadió que, *“(…) WO2005123686 no se relaciona con inhibidores de PCSK9. De hecho, no hay ninguna referencia a la inhibición de PCSK9 en dicho documento, por lo tanto, no habría ninguna razón para que una persona normalmente versada en la materia recurra a esa solicitud para obtener inhibidores de PCSK9”*.

### Respuesta de la Oficina

Esta Oficina aclara que, el solicitante realizó modificaciones al capítulo reivindicatorio luego del análisis de los argumentos del opositor, dichas modificaciones fueron estudiadas por esta Oficina bajo el radicado N° NC2021/0016687 del 02 de abril de 2022. Sin embargo, dichas modificaciones fueron insuficientes para otorgar claridad y concisión al capítulo reivindicatorio. Por lo tanto, se realizó el primer examen de patentabilidad bajo el Oficio N° 21440 de 29 de diciembre de 2023, en el que se requirió al solicitante para que realizará las modificaciones pertinentes al capítulo reivindicatorio de modo que sea claro y conciso, a la vez que se encuentre enteramente sustentado por la descripción.

## Resolución N° 55381

Ref. Expediente N° NC2021/0010312

En segundo lugar se aclara que, luego de revisar las modificaciones del capítulo reivindicatorio presentadas bajo el radicado N° NC2021/0010312 del 27 de mayo de 2024, se encontró que la materia que se reclama cumple con los criterios de novedad y nivel inventivo. Lo anterior debido a que, al revisar el estado de la técnica y particularmente el documento WO2005123686 se encontró que, los compuestos allí divulgados presentan diferencias significativas a nivel estructural; particularmente este documento no enseña el anillo ciclopentilo ubicado entre los grupos amino, tampoco enseña la combinación de anillos heteroarilo de piridina unida a una piridona, ni la sustitución del anillo de pirimidina. Dichas diferencias, no son sugeridas por el estado de la técnica. Sumado a que dicho documento no se relaciona con inhibidores de PCSK9. De hecho, no hay ninguna referencia a la inhibición de PCSK9 en dicho documento, por lo tanto, no habría ninguna razón para que una persona normalmente versada en la materia recurra a esa solicitud para obtener inhibidores de PCSK9.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 7356 el 17 de abril 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° NC2021/0013012 el 27 de mayo de 2024, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 4 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° 7356 el 17 de abril de 2024, las reivindicaciones 1 a 4 incluidas en el radicado N° NC2021/0013012 el 27 de mayo de 2024 superan la objeción por Artículo 30 de la Decisión 486 por falta de concisión, porque se ha restringido la materia reclamada caracterizando de manera adecuada un solo compuesto y su composición farmacéutica, los cuales tienen 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, 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 4 incluidas en el radicado bajo el N° NC2021/0013012 el 27 de mayo de 2024, cumplen los requisitos indicados anteriormente, toda vez que refieren al compuesto 6'-(((1S,3S)-3-((5-(difluorometoxi)pirimidin-2-il)amino)ciclopentil)amino)-2H-[1,3'-bipiridin]-2-ona o su sal farmacéuticamente aceptable y una composición farmacéutica que comprende dicho compuesto, que difieren del estado de la técnica más cercano, WO2013/177536, en el núcleo de pirimidina; el grupo amino contiguo a la pirimidina; el anillo de ciclopentilo; y el anillo de piridina unido a una piridona.

Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia su efecto como inhibidores de PCSK9 con valores

Resolución N° 55381

Ref. Expediente N° NC2021/0010312

de  $K_D$  menores a 200 nM (Descripción, pág. 227-233). Este tipo de resultados de laboratorio implican que, el compuesto reclamado, tiene alta afinidad para inhibir la proteína PCSK9, lo cual puede llevar a una significativa reducción del LDL-colesterol en la sangre, beneficiando así a pacientes con niveles altos de colesterol y reduciendo su riesgo cardiovascular.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 4 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 el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2021/0013012 el 27 de mayo de 2024, tituló la invención como: “COMPUESTOS DERIVADOS DE N-PIRIMIDIN-2-AMINA SUSTITUIDOS Y COMPOSICIONES QUE LOS COMPRENDEN COMO INHIBIDORES DE PCSK9”. Sin embargo, no se acepta porque no detalla de manera adecuada y concreta la materia que se desea proteger, y de acuerdo con el objeto concedido, el título de la invención quedará de la siguiente manera: “6'-(((1S,3S)-3-((5-(DIFLUOROMETOXI)PIRIMIDIN-2-IL)AMINO)CICLOPENTIL)AMINO)-2H-[1,3'-BIPIRIDIN]-2-ONA COMO INHIBIDOR DE PCSK9”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, la Superintendente de Industria y Comercio,

**RESUELVE**

**ARTÍCULO 1:** Declarar infundada la oposición presentada por LABORATORIOS LEGRAND S.A de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente Resolución.

**ARTÍCULO 2:** 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:

**“6'-(((1S,3S)-3-((5-(DIFLUOROMETOXI)PIRIMIDIN-2-IL)AMINO)CICLOPENTIL)AMINO)-2H-[1,3'-BIPIRIDIN]-2-ONA COMO INHIBIDOR DE PCSK9”**

**Clasificación IPC:** C07D 417/12, C07D 417/14, C07D 403/14, C07D 491/107, C07D 487/10, C07D 471/04, C07D 498/04, C07D 495/04, A61K 31/506, A61P 3/06, A61P 9/00.

**Reivindicaciones:** 1 a 4 incluidas en el radicado bajo el N° NC2021/0010312 el 27 de mayo de 2024, de acuerdo con el Anexo 1.

**Titular:** AstraZeneca AB.

**Dirección:** SE-151 85, SÖDERTÄLJE, SUECIA.

Resolución N° 55381

Ref. Expediente N° NC2021/0010312

**Inventores:** Karamjit Singh JANDU, Mark CHAMBERS, Michael H. SERRANO-WU, Jason TIERNEY, David CLARK, Paul HINCHLIFFE y Erica Lee GOLDSMITH.

**Prioridad N°:** 18/01/2019, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/794,234.

**Solicitud internacional N°:** PCT/US2020/013881

**Fecha:** 16 de enero de 2020.

**Vigente desde:** 16 de enero de 2020

**Hasta:** 16 de enero de 2040.

**ARTÍCULO 3:** 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 4:** Notificar el contenido de la presente resolución a AstraZeneca AB, y en calidad de Opositor a LABORATORIOS LEGRAND S.A., 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 23 de septiembre de 2024

**LA SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,**



Firmado digitalmente  
por: CIELO ELAINNE  
RUSINQUE URREGO  
Fecha: 2024.09.23  
17:02:25 COT  
Razón: Validez jurídica.  
Ubicación: Bogotá,  
Colombia.

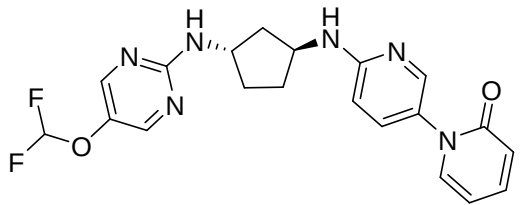
Resolución N° 55381

Ref. Expediente N° NC2021/0010312

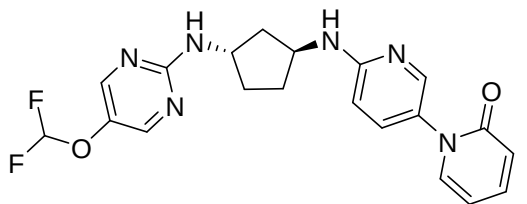
**ANEXO 1**

**REIVINDICACIONES CONCEDIDAS**

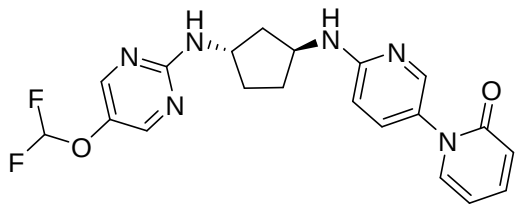
1. Un compuesto, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, el cual es:



2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, el cual es:



3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, el cual es una sal farmacéuticamente aceptable de:



4. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-3, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables.