

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 13-271927- -2	FECHA: 2014-10-17 17:29:08
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 6
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA

Asunto: Radicación: 13-271927- -2
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 13429
 Folios: 6

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2012/038520				
Fecha de Presentación Internacional	18/05/2012				

Como resultado del examen de fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado No 13-271927-00000-0000	19/Noviembre/2013
Reivindicaciones:	1 – 20 del radicado No. 13-271927-00000-0000	19/Noviembre/2013
Prioridad:	IN 145/DEL2011	20/Mayo/2011
	US 61/495049	09/Junio/2011

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

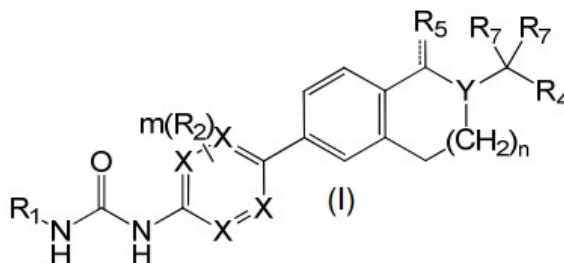
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

A pesar de que en la presente solicitud no se evidencia pago por reivindicación adicional a las 10 primeras, se procede a estudiar todo el capítulo reivindicatorio.

Título de la solicitud: "COMPUESTOS NOVEDOSOS COMO INHIBIDORES DE DIACILGLICEROL ACILTRANSFERASA".

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar compuestos novedosos que son inhibidores de acil coenzima A : diacilglicerol aciltransferasa 1 (DGAT-1), y por tanto adecuados contra enfermedades relacionadas con disfunción de DGAT-1, o en donde la modulación de la actividad de DGAT-1 puede tener un beneficio terapéutico, que incluyen, sin limitación, obesidad, trastornos relacionados con la obesidad, hipertrigliceridemia, hiperlipoproteinemia, quilomicronemia, dislipidemia, esteatohepatitis no alcohólica, diabetes, resistencia a la insulina, síndrome metabólico, infección por virus de hepatitis C y acné u otros trastornos de la piel.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I) y a composiciones farmacéuticas que los comprenden.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/17.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal (d))

El objeto de la reivindicación 18, que se refiere a un método de tratamiento, no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la solicitud de patente

Título

El título de la invención es muy genérico ya que se refiere al uso de los compuestos, pero lo adecuado es mencionar en el mismo, algunas de las particularidades de la estructura que los distinguen de lo que se encuentra en el arte previo. Se sugiere realizar las aclaraciones necesarias.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 carece de concisión, ya que se mencionan términos tales como:

- “Arilo”, “heteroarilo”, “alquilsulfonilo”, “alcoxi”, “alcoxycarbonilo”, con los cuales se pueden presentar múltiples opciones de posibles sustituyentes que dificultan entender el objeto de la invención, máxime cuando no se nombra la cantidad de átomos que los conforman o el tipo de heteroátomos que hacen parte del sustituyente.

Se sugiere a la solicitante restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados ó probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados en la descripción, en sus ejemplos.

Lo anterior aplica para las reivindicaciones dependientes a la reivindicación 1 que emplean tales términos.

La reivindicación 20 no es clara cuando reclama “el compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17” sin señalar a qué tipos de compuestos específicos se refiere y por eso se sugiere reivindicar los compuestos específicos bien sea adicionando su estructura o su nombre IUPAC.

6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, el 20 de mayo de 2011.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente (s) documento (s) que anticipa (n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de presentación
D1	WO2009126861	“Triazolopyridine compounds useful as DGAT1 inhibitors”	15/Octubre/2009

El documento D1 ¹ (resumen) divulga compuestos derivados de triazolopiridina de fórmula (I) que presentan actividad como inhibidores DGAT1 y por tanto adecuados contra patologías relacionadas con obesidad, dislipidemia, diabetes y aterosclerosis, entre otras.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

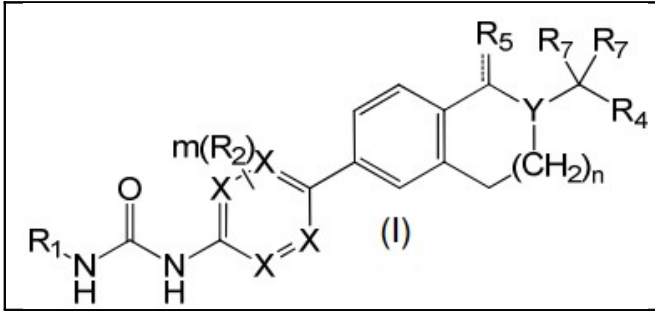
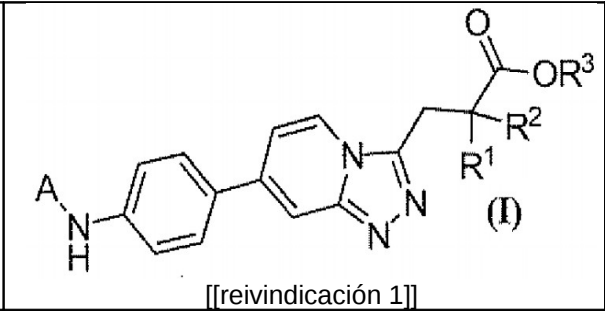
La reivindicación 1 consiste en “*un compuesto de fórmula (I)*” en donde los sustituyentes son como se encuentran allí definidos (ver pág. 289 del pliego reivindicatorio del radicado No. 13-271927-00000-0000).

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1
----------------------------	----

¹URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20091015&CC=WO&NR=2009126861A2&KC=A2)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20091015&CC=WO&NR=2009126861A2&KC=A2

	
R^1 es alquilo, cicloalquilo, arilo	A es $-C(O)NR^4R^5$, donde R^4 es alquilo, cicloalquilo, arilo y R^5 es H
X es C	C
m y n son 0	0
R^5 es H	No aplica
Y es N	N
R^7 es H	H
R^4 es $-CH_2COOH$	R^1, R^2 y R^3 son H
Anillo No forma una [1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina	El anillo es una [1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina

El documento D1 es considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, ya que divulga derivados de triazolopiridina de fórmula (I) que presentan actividad como inhibidores DGAT1 y por tanto adecuados contra patologías relacionadas con obesidad, dislipidemia, diabetes y aterosclerosis, entre otras.

La diferencia entre los compuestos de la invención y los revelados en D1 consiste en el anillo de [1,2,4]triazolo[4,3-a]piridina que se presenta en el documento D1, mientras que en la presente invención dicho anillo no se formaría porque máximo tendría un solo heteroátomo de Nitrógeno.

Sin embargo, esta diferencia no concede un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos de la presente invención, ya que cuando se realiza una detallada revisión de la actividad demostrada de los compuestos del documento D1 (D1: tabla 1), puede notarse que la actividad de los compuestos allí revelados, en el ensayo sobre enzima DGAT1, determinada como IC_{50} (μM) oscila entre 0,01 μM hasta 50 μM (incluyendo compuestos intermediarios), es decir entre 10 nM hasta 50000 nM y en la presente invención (Capítulo descriptivo, pág. 288) los compuestos mostraron actividad de entre 0,3 nM y 5955.0 nM. Lo anterior evidencia que las diferencias estructurales no reportan datos sorprendentes cuando se comparan los compuestos de la presente invención con los ya conocidos en el documento D1 sino que se encuentran en un orden estadístico similar y por tanto no existe sustento suficiente a favor del nivel inventivo de la presente invención.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo proporcionar compuestos novedosos que son inhibidores de DGAT-1 y por tanto adecuados contra enfermedades relacionadas con disfunción de DGAT-1, que incluyen, sin limitación, obesidad, trastornos relacionados con la obesidad, hipertrigliceridemia, hiperlipoproteinemia, quilomicronemia, dislipidemia, esteatohepatitis no alcohólica, diabetes, resistencia a la insulina, síndrome metabólico, infección por virus de hepatitis C y acné u otros trastornos de la piel, alternativos a los ya revelados en el arte previo?

El documento D1 ya realizaba una clara sugerencia de compuestos que presentan actividad como inhibidores DGAT1 y por tanto adecuados contra patologías relacionadas con obesidad, dislipidemia, diabetes y aterosclerosis, entre otras. Señala compuestos con

actividad demostrada, como se señaló anteriormente, en donde las modificaciones propuestas en la presente invención a partir de los compuestos del documento D1 resultan obvias o evidentes puesto que son consideradas de rutina al pretender buscar compuestos alternativos a los ya conocidos.

En este punto vale la pena anotar, que las modificaciones en anillos farmacofóricos o en los sustituyentes de tales anillos son posibilidades plenamente conocidas para la persona del oficio normalmente versada en la materia, quien con sus conocimientos en química orgánica heterocíclica y a partir de la bibliografía básica puede realizar cambios en cualquiera de sus sustituyentes como ocurre con los isómeros clásicos en donde los grupos y átomos univalentes pueden ser reemplazados como una opción alternativa de modificación de sustituyentes funcionales ², es decir, que se sabe que con algunas modificaciones en los sustituyentes se pueden lograr cambios en las propiedades del compuesto íntimamente relacionadas con su actividad o con el efecto técnico a esperar como es, por ejemplo, incrementar la potencia o el índice (relación) terapéutica como el LD₅₀, ED₅₀ o el EC₉₀ a partir de algunas modificaciones en las sustituciones del anillo principal o en la variación de alguno de sus sustituyentes. Lo anterior es importante, porque en la presente invención se propone una modificación estructural que simplemente consiste en variar un anillo de compuestos ya conocidos en el arte previo, pero que, como se mencionó anteriormente, con dicha modificación no puede observarse un efecto técnico inesperado o una ventaja técnica sorprendente demostrada y por tanto se consideran variaciones estructurales de rutina.

En consecuencia, cualquier persona normalmente versada en la materia al observar los compuestos de la anterioridad D1, y con sus conocimientos básicos y simples en química heterocíclica, habría podido “modificar” las sustituciones en los heteroátomos de anillos de compuestos conocidos en el documento D1, como una alternativa para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 17 y 19 – 20 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

8. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2009126861	1 – 17 y 19 – 20	Nivel Inventivo

² **Silverman, R. B.**, “The organic Chemistry of Drugs Design and Drug Action”. Elsevier. Northwestern University. Second Edition. Evanston Illinois. 2004. pág. 29, table 2.2.

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir del día siguiente de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2014-10-21

Elaboró: Nelson Ricardo Velasco Gonzalez
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza