

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 12475 de 5 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0004286

Señores
PFIZER INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “INHIBIDOR DE DIACILGLICEROL ACILTRANSFERASA 2”

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/IB2020/059145.

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 30 de septiembre de 2020.

PRIORIDAD: US, 62/911,094, 04 de octubre de 2019.

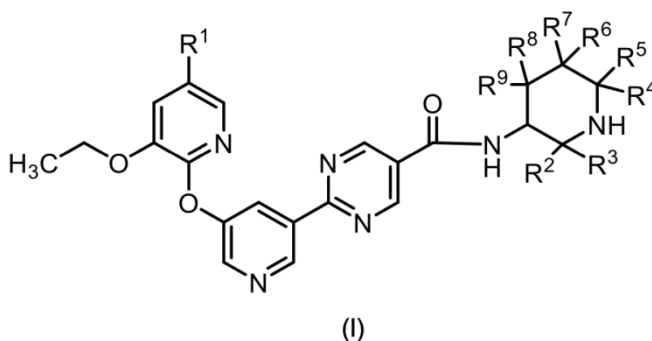
US, 63/074,123, 03 de septiembre de 2020.

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

1. Objeto de la invención

El problema planteado consiste en la necesidad de encontrar agentes farmacéuticos que presenten actividad inhibidora de la enzima diacilglicerol aciltransferasa tipo 2 (DGAT2), los cuales puedan ser útiles en el tratamiento, la prevención o la reducción de las manifestaciones clínicas de enfermedades metabólicas, hepáticas, cardiovasculares y relacionadas con alteraciones en la homeostasis lipídica y glucémica, tales como la esteatohepatitis no alcohólica (NASH), la resistencia a la insulina, la dislipidemia y diversas formas de diabetes mellitus. Además, se plantea la necesidad de que dichos inhibidores presenten propiedades farmacocinéticas mejoradas, incluyendo una mayor solubilidad, depuración y semivida.

Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio plantea una serie de compuestos de fórmula (I), así como composiciones farmacéuticas que los contienen, y su aplicación como inhibidores de DGAT2. Estos compuestos son estructuralmente caracterizados como derivados de piridinas sustituidas. Asimismo, la solicitud contempla formas farmacéuticas y combinaciones terapéuticas que permiten una formulación y administración adecuada de dichos compuestos en mamíferos, particularmente en humanos.



Oficio N° 12475 de 5 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0004286

2. Reivindicaciones estudiadas

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, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486.

Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 10 del radicado N° NC2022/0004286 del 04 de abril de 2022.

3. De la solicitud de patente

3.1. Reivindicaciones

Teniendo en cuenta lo establecido en el artículo 30 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina:

"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción. (...)"

Esta Oficina informa que, las reivindicaciones 8 a 10 no son concisas, porque se observa que dichas reivindicaciones son formalmente redactadas como independientes, sin embargo, su contenido técnico no difiere sustancialmente del de la reivindicación 1, y no introducen una categoría diferente de invención frente a la reivindicación principal. Por tanto, se considera que estas reivindicaciones deberían ser dependientes de la reivindicación 1, y presentadas de forma concisa. Se sugiere reorganizar las reivindicaciones 8 a 10 como reivindicaciones dependientes de la reivindicación 1 o, reclamar únicamente las características preferentes del grupo inventivo de la reivindicación 1, en reivindicaciones dependientes de esta.

En consecuencia, es necesario que allegue las aclaraciones o modificaciones correspondientes para dar cumplimiento a lo establecido en el citado artículo.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 04 de octubre de 2019, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO2018033832	"Diacylglycerol acyltransferase 2 inhibitors"	22 de febrero de 2018
D2	WO2015140658	"Diacylglycerol acyltransferase 2 inhibitors for use in the treatment of metabolic and related disorders"	24 de septiembre de 2015

D1¹ divulga compuestos de Fórmula (I) que inhiben la actividad de la diacilglicerol aciltransferasa 2 (DGAT2) y sus usos en el tratamiento de enfermedades ligadas a ella en animales (Resumen).

¹ <https://patentimages.storage.googleapis.com/15/27/49/eec51319df9d09/WO2018033832A1.pdf>

Oficio N° 12475 de 5 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0004286

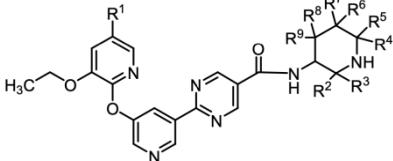
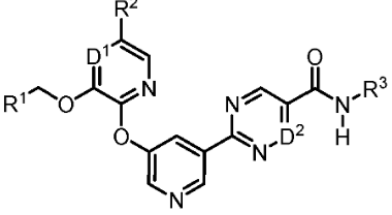
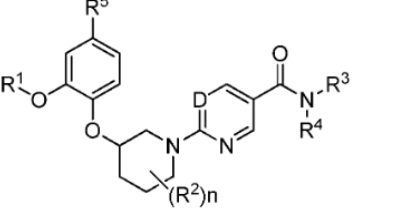
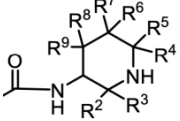
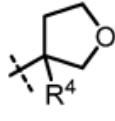
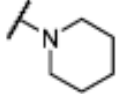
D2² divulga nuevos compuestos farmacéuticos, composiciones farmacéuticas que contienen estos compuestos y su uso para inhibir la actividad de la diacilglicerol aciltransferasa 2 (DGAT2) (Pág. 1, lín. 4-6).

5. Examen de Patentabilidad

De acuerdo con lo establecido en el artículo 14 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, en el cual se establecen los requisitos de patentabilidad objeto de la solicitud en estudio, esta Oficina presenta a continuación el análisis de los requisitos de patentabilidad.

5.1. Nivel Inventivo

Teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 18 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, la reivindicación independiente 1 (NC2022/0004286 del 04 de abril de 2022) refiere a: “Un compuesto de la Fórmula (I) (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1	D2
Un compuesto de la Fórmula (I) 	Un compuesto de la Fórmula (I)  D ¹ y D ² = CH (Reiv. 1)	Un compuesto de la Fórmula (I)  D = N y R ³ = H (Reiv. 1)
R ¹ = H o fluoro	R ² = H o fluoro (Reiv. 1)	R ² = H o fluoro (Reiv. 1)
	 R ³ = (Reiv. 1)	R ⁴ = -((C ₁ -C ₄)alquil) _p -(C ₁ -C ₃)heterociclil p = 0 (Reiv. 1)  (Pág. 89, Ejemplo 20.11)
R ²⁻⁵ = H y (C ₁ -C ₃)fluoroalquilo R ⁶⁻⁹ = H, fluoro y (C ₁ -C ₃)fluoroalquilo en donde 1 o 2 de R ²⁻⁹ son distintos de H	≈ H (Reiv. 1)	R ⁴ está opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados entre halo, (C ₁ -C ₄)fluoroalquilo (Reiv. 1)

D1 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, ya que divulga compuestos para inhibir la actividad de la enzima diacilglicerol aciltransferasa 2 (DGAT2), siendo útiles en el tratamiento de enfermedades metabólicas como la diabetes tipo 2, hígado graso y dislipidemias (Pág. 1-2).

² <https://patentimages.storage.googleapis.com/dc/bb/f6/72cd4ed77378f9/WO2015140658A1.pdf>

Oficio N° 12475 de 5 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0004286

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y los compuestos divulgados en D1 consiste en que el grupo terminal cíclico del compuesto de la solicitud está basado en un anillo de piperidina sustituido con al menos un grupo distinto de hidrógeno seleccionado de fluoro o (C₁-C₃)fluoroalquilo, mientras que el compuesto de D1 incluye un anillo tetrahidrofurano no sustituido.

No hay evidencia de que el incluir específicamente un anillo de piperidina sustituido proporcione un compuesto con un efecto técnico diferente o mejorado frente al objeto divulgado en D1, puesto que los compuestos de este documento ya exhiben potentes valores de IC₅₀ para la inhibición de DGAT2, alcanzando concentraciones tan bajas como 3,7 nM (Ejemplo 8) y 7,4 nM (Ejemplo 4) (Pág. 70, Tabla 4). Estos valores son similares o incluso mejores que los obtenidos para los compuestos divulgados en la solicitud, como el Ejemplo 11 (4,4 nM) o el Ejemplo 22 (21000 nM) (Pág. 127, Tabla 4), lo cual refuerza que la actividad biológica de los compuestos de D1 es igualmente satisfactoria y en algunos casos mejor. De modo que, la presencia del anillo de piperidina sustituido no se traduce en una mejora inesperada ni significativa frente al compuesto más cercano del estado de la técnica.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el compuesto conocido en D1 con el fin de proporcionar otro compuesto alternativo que inhiba DGAT2?

Sin embargo, el incluir un anillo de piperidina opcionalmente sustituido para variar la estructura terminal del compuesto y así obtener un inhibidor alternativo de DGAT2, ya está divulgado en D2, que se refiere a compuestos que comprenden un radical R⁴ definido como un grupo heterocíclico de 3 a 6 miembros, que abarca al anillo de piperidina, el cual puede estar sustituido con uno o más grupos seleccionados entre halógeno y (C₁-C₄)fluoroalquilo (Pág. 5, líneas 7–13; Reivindicación 1).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir un anillo de piperidina sustituido como el del D2 en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 7 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que carece de nivel inventivo.

Del mismo modo, aunque las reivindicaciones 8 a 10 han sido redactadas como independientes, su contenido técnico no introduce una categoría distinta de invención ni resuelve un problema técnico diferente al planteado en la reivindicación 1. Por el contrario, estas reivindicaciones se basan en la misma estructura de los compuestos reclamados en la reivindicación 1, y sus características técnicas que ya fueron objeto de análisis frente a los documentos D1 y D2. En tal sentido, el análisis de nivel inventivo aplicable a la reivindicación 1 también resulta válido para las reivindicaciones 8 a 10, motivo por el cual estas también se consideran carentes de nivel inventivo.

6. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2018033832	1 a 10	Nivel inventivo



Oficio N° 12475 de 5 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0004286

D2	WO2015140658	1 a 10	Nivel inventivo
----	--------------	--------	-----------------

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir 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.

Si como respuesta a este requerimiento, el solicitante modifica el capítulo reivindicatorio, deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única de esta Superintendencia. De igual forma, deberá tener presente que de conformidad con el literal a) del numeral 1.2.2.5.1. de la norma ibidem, será necesario acreditar el pago de la tasa por concepto de modificación a solicitudes en trámites, de conformidad con el valor establecido en la resolución de tasas vigentes.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede recurso alguno en actuación administrativa.

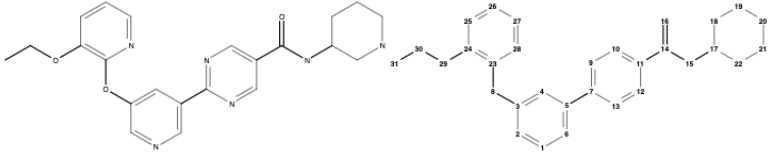


Sandra Isabel Calderon Rodriguez
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

Oficio N° 12475 de 5 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0004286

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2022/0004286		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/IB2020/059145		30/09/2020							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad			Presentación		
04/10/2019				X					
Solicitante									
PFIZER INC.									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	
CRITERIOS DE BÚSQUEDA									
Reivindicaciones objeto de búsqueda		1 a 10							
Palabras clave utilizadas		 S DGAT2 AND INHIBITOR? S L5 AND PD<20191004 S L6 AND (PYRIDINE OR PYRIDYL OR IMIDAZOPYRIMIDINE OR IMIDAZOPYRAZINE) AND PYRIDYL S L6 AND PYRIDINE AND PYRIDYL AND IMIDAZOPYRAZINE AND PIPERIDINE AND METABOLIC AND DIABETES AND CARDIOVASCULAR AND PIPERIDINE AND DIACYLGLYCEROL AND TRANSFERASE							
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda		CIP: C07D 401/14, A61P 3/00, A61K 31/506							
DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)									
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica			Categoría del documento citado ⁽²⁾		
SIPI ISA STNext Orbit Patbase	WO2013150416	10/10/2013	-	-			A		
	WO2018033832	22/02/2018	1 a 10	Reivindicación 1; Pág. 70, Tabla 4			Y		
SIPI JPO Orbit	WO2015140658	24/09/2015	1 a 10	Reivindicación 1; Pág. 89, Ejemplo 20.11			Y		
Patbase	WO2010007046	21/01/2010	-	-			A		
JPO	WO2010121963	28/10/2010	-	-			A		
USPTO	WO2013137628	19/09/2013	-	-			A		
	WO2015077299	28/05/2015	-	-			A		
	WO2016036633	10/03/2016	-	-			A		
	WO2016036636	10/03/2016	-	-			A		
	WO2016036638	10/03/2016	-	-			A		
STNext	WO2017172505	05/10/2017	-	-			A		



Oficio N° 12475 de 5 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0004286

Google Académico	(¹) Choi, C. S., et al.	27/05/2007	-	-	A
(¹) Cita completa literatura no patente (LNP) Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp. O Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx.		(¹) Choi, C. S., Savage, D. B., Kulkarni, A., Bhanot, S., Monia, B. P., & Shulman, G. I. (2007). Suppression of Diacylglycerol Acyltransferase-2 (DGAT2), but Not <i>DGAT1</i>, with Antisense Oligonucleotides Reverses Diet-induced Hepatic Steatosis and Insulin Resistance. <i>Journal of Biological Chemistry</i>. Recuperado de https://www.jbc.org/article/S0021-9258(20)56610-6/fulltext			
(²) Categorías de documentos citados					
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante. “E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. “L” Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan. “O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O,X, O,Y o bien O,A. “P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada. “T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.					
Fecha del reporte de búsqueda: 30/07/2025					

