

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690

Señores
AMGEN INC

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “COMPUESTOS HETEROCÍCLICOS COMO INHIBIDORES DE DELTA-5 DESATURASA Y MÉTODOS DE USO”
NUMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2020/062020
FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 24 de noviembre de 2020.
PRIORIDAD: 25/11/2019, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/939,821

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:

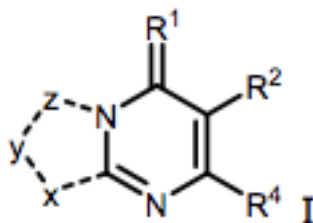
1. Modificaciones presentadas

Revisada la modificación a la solicitud objeto de estudio, la cual fue radicada el 27 de diciembre de 2022 bajo el número NC2022/0019060, y teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 34 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, esta oficina acepta las modificaciones presentadas por ajustarse a los requisitos legales.

2. Objeto de la invención

El problema planteado consiste en la necesidad de inhibidores de D5D, que pueden ser adecuados para su uso como agentes terapéuticos, en vista de la carga social continua significativa provocada por, por ejemplo, enfermedades metabólicas y cardiovasculares.

Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio plantea un compuesto de fórmula I



3. Reivindicaciones estudiadas

El presente estudio se basa en el capítulo reivindicatorio presentado 27 de diciembre de 2022 bajo el número NC2022/0019060.

4. De la solicitud de patente

4.1. Reivindicaciones

Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690

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. (...)"

a. Esta oficina informa que las reivindicaciones 1 a 49, 69 a 108 y 111 no son concisas porque las definiciones de los sustituyentes comprenden una cantidad de compuestos que supera la razonable generalización de lo que fue desarrollado en la presente solicitud, esto impide establecer el alcance de la protección. Adicionalmente, estas reivindicaciones no están debidamente soportadas en la descripción, porque la definición de los sustituyentes abarca compuestos para los que no existe evidencia de que conserven la misma actividad de los que fueron probados en la presente solicitud. Se requiere limitar la materia reivindicada teniendo en cuenta que exista una razonable generalización y que cada una de dichas alternativas tenga soporte en la descripción, por ejemplo, los compuestos de la actual reivindicación 50.

b. Las reivindicaciones 1, 2 y 76 no son concisas, porque usan disclaimers (exclusiones) para referirse a la materia reivindicada. Las definiciones de disclaimer en este caso no son aceptadas porque no son la mejor forma de limitar la materia a una razonable generalización de los compuestos desarrollados. Es necesario que los disclaimers sean eliminados de las reivindicaciones y que la materia reivindicada sea definida por sus características estructurales.

c. La reivindicación 51 no es concisa porque reivindica las mismas características técnicas que son reivindicadas en la reivindicación 50. Se requiere que se elimine la reivindicación 51.

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

4.2. Descripción

Revisado el capítulo descriptivo de la solicitud, este no divulga la invención de manera suficientemente clara y completa, para que una persona capacitada en la materia pueda ejecutarla, incumpliendo de esta forma lo establecido en el artículo 28 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

Particularmente, esta Oficina encuentra que, dado que los ejemplos sólo presentan las sustituciones de los compuestos de la reivindicación 50, las demás definiciones en el capítulo reivindicatorio no presentan una demostración de la mejor manera para ser ejecutadas. La presente solicitud no evidencia que variaciones pequeñas en la estructura de los compuestos conserven la actividad de los compuestos aquí desarrollados. Por el contrario, pequeñas variaciones de los compuestos obtenidos en la presente solicitud son encontradas en compuestos, como el presentado en el numeral 6.1 de este oficio, que no pertenecen al campo técnico de la presente solicitud, aunque tengan la misma estructura química de los compuestos reivindicados en la reivindicación 1 de la presente solicitud. Por lo tanto, se requiere que la presente solicitud se limite a los compuestos que fueron en esta obtenidos.

5. Determinación del Estado de la Técnica

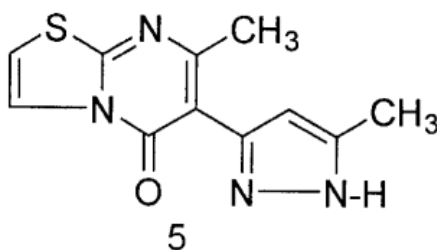
Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 25 de noviembre 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:

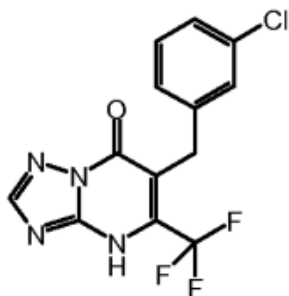
Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	Djerrari D. <i>et al.</i> Comptes Rendus. Chimie	“L'ACIDE DÉHYDRACÉTIQUE, PRÉCURSEUR DE NOUVELLES PYRIDOPYRIMIDINES, THIAZOLOPYRIMIDINES ET PYRIDONES”	01 de marzo de 2002
D2	WO2011114148	“4H- [1, 2, 4] TRIAZOLO [5, 1 -B] PYRIMIDIN-7 -ONE DERIVATIVES AS CCR2B RECEPTOR ANTAGONISTS”	22 de septiembre de 2011
D3	WO2005070431	“PYRAZOLO[1,5-A]PYRIMIDIN-7-YL-AMINE DERIVATIVES FOR USE IN THE TREATMENT OF PROTEIN KINASE DEPENDENT DISEASES”	08 de agosto de 2005



D1¹ divulga el compuesto

(Página 180, compuesto 5).

D2² divulga compuestos, como:



(Página 44, ejemplo 19 de D2). Los compuestos de D2 son usados en el tratamiento de diabetes (resumen de D2).

D3³ divulga compuestos que actúan en enfermedades donde persiste la angiénesis, como la diabetes (Página 4, párrafo 4). Los compuestos de D3 tienen una estructura química, como:

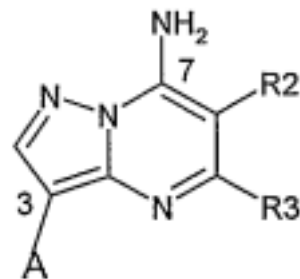
¹Djerrari D. *et al.* (2002). L'acide déhydracétique, précurseur de nouvelles pyridopyrimidines, thiazolopyrimidines et pyridones. *Comptes Rendus. Chimie*, Volume 5, no. 3, pp. 177-183

²<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/043943216/publication/WO2011114148A1?q=WO2011114148>

³ <https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/034807167/publication/WO2005070431A1?q=wo2005070431>

Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690



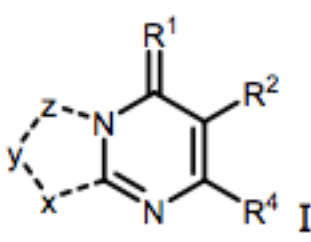
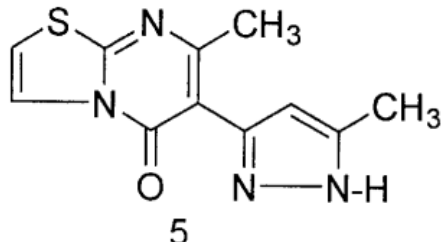
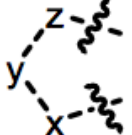
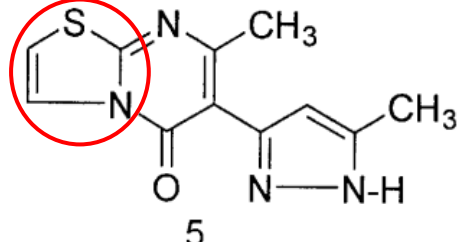
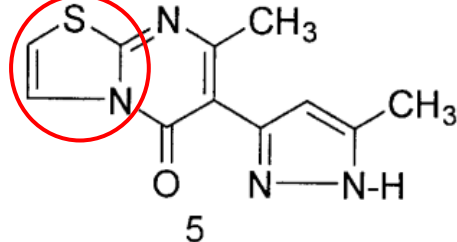
A es 4-(4-methyl-piperazin-1-il)fenilo; R2 es fenilo; R3 es metilo.
(Página 65, compuesto 8).

6. 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.

6.1. Novedad

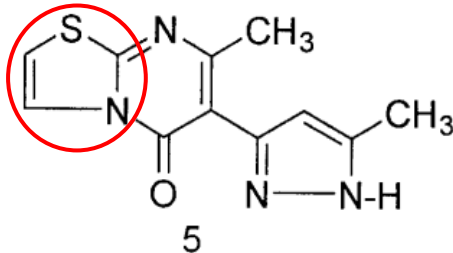
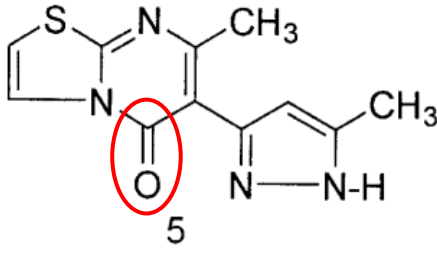
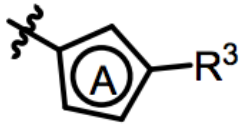
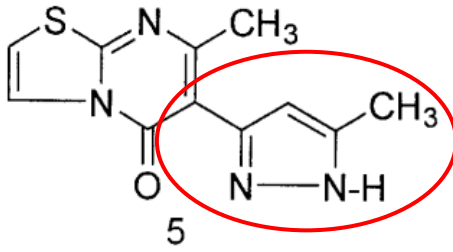
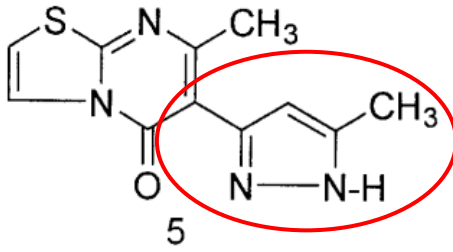
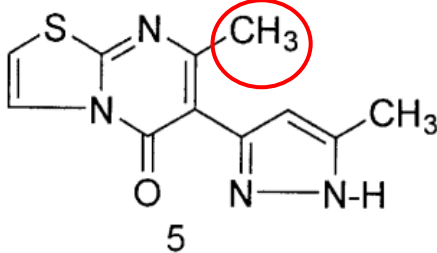
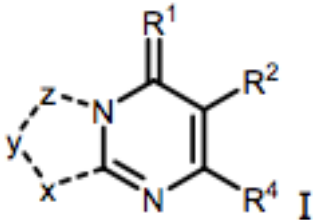
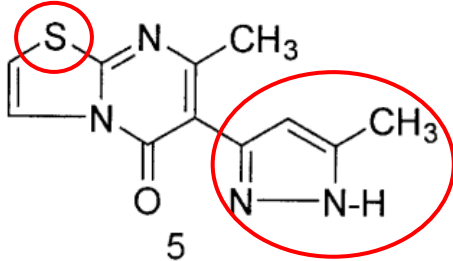
Teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 16 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, la reivindicación independiente 1 (NC2022/0019060 del 27 de diciembre de 2022) refiere a: “un compuesto de fórmula I (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1
Un compuesto de fórmula I  en el que	 (Página 180, compuesto 5)
 junto con el átomo de N y el átomo de C al que está unido forma un anillo de 5 miembros, en el que el anillo es parcialmente saturado	 (Página 180, compuesto 5)
x, y, y z se seleccionan independientemente de CR, S(O) _n ,	 (Página 180, compuesto 5)



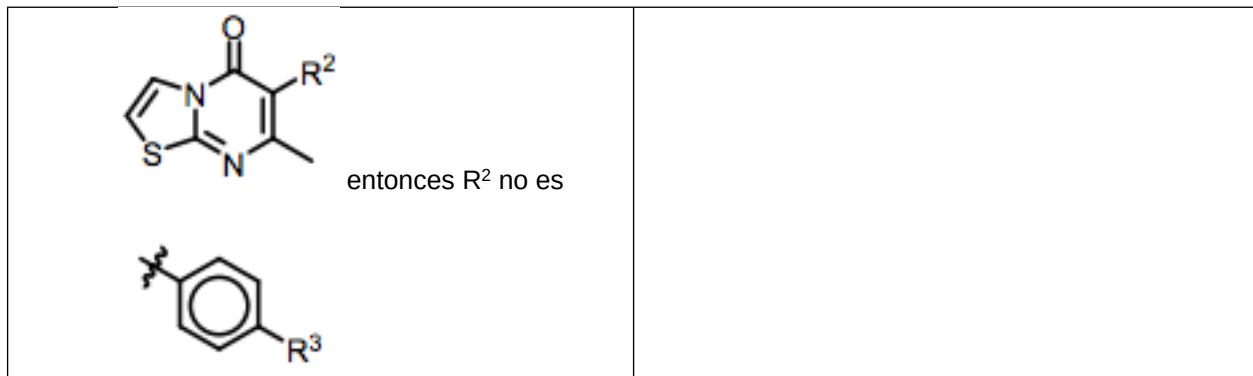
Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690

cada R y R' se selecciona independientemente de H,	 5 (Página 180, compuesto 5)
R¹ es O	 5 (Página 180, compuesto 5)
 R² es ' en el que el anillo A es un heteroarilo de 5 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado de N y opcionalmente un átomo de N adicional siendo los átomos de anillo restantes del heteroarilo de 5 miembros carbono, en el que iii) el anillo A está unido por medio de un átomo de C al núcleo bicíclico y R³ está unido por medio de un átomo de C; R³ es alquilo C₁₋₆ R⁴ es alquilo C₁₋₃ <td>  5 (Página 180, compuesto 5) </td>	 5 (Página 180, compuesto 5)
	 5 (Página 180, compuesto 5)
n es 0; siempre que  (1) si es	 5 (Página 180, compuesto 5)

Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

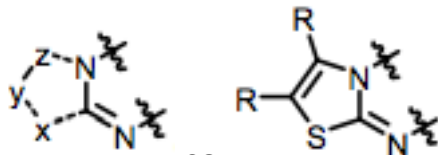
Ref. Expediente N° NC2022/0008690



De acuerdo con la comparación realizada anteriormente se concluye que la materia de la reivindicación 1 no es nueva.

Así mismo, D1 divulga las características de las reivindicaciones dependientes de la siguiente manera:

- Reivindicación 2: el compuesto no es 1,3,3-trimetil-6-[1-(2,2,3,3,3-pentafluoropropil)-1H-pirazol-4-il]-7-(trifluorometil)-1H,2H,3H,5H-imidazo[1,2-a]pirimidin-2,5-diona; 2-metil-6-[1-(2,2,3,3,3-pentafluoropropil)-1H-pirazol-4-il]-1-(pirimidin-5-il)-7-(trifluorometil)-1H,5H-imidazo[1,2-a]pirimidin-5-ona; o 2-[(metilamino)metil]-6-[1-(2,2,3,3,3-pentafluoropropil)-1H-pirazol-4-il]-7-(trifluorometil)-5H-[1,3,4]tiadiazolo[3,2-a]pirimidin-5-ona (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 4: x, y y z se seleccionan independientemente de CR, N y S (Página 180, compuesto 5).

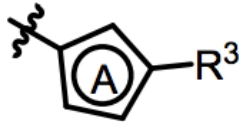


- Reivindicación 5: es (Página 180, compuesto 5).

- Reivindicación 8: cada R y R', si están presentes, se seleccionan independientemente de H (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 9: cada R y R', si están presentes, se seleccionan independientemente de H (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 10: cada R y R', si están presentes, se seleccionan independientemente de H (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 11: cada R y R', si están presentes, se seleccionan independientemente de H (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 12: cada R y R', si están presentes, se seleccionan independientemente de H (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 13: cada R y R', si están presentes, se seleccionan independientemente de H (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 21: R¹ es S (Página 180, compuesto 5).

Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690



- Reivindicación 24: R² es (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 28: A está unido por medio de un átomo de C al núcleo bicíclico y R³ está unido por medio de un átomo de C (Página 180, compuesto 5).



- Reivindicación 31: la porción de R² no está sustituida demás con un sustituyente R^{3'} (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 34: R³ es alquilo C₁₋₆ (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 35: R³ es alquilo C₁₋₆ (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 36: R³ es alquilo C₁₋₆ (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 41: R⁴ es alquilo C₁₋₃ (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 43: R⁴ es metilo (Página 180, compuesto 5).
- Reivindicación 45: n es 0 (Página 180, compuesto 5).

Así, las reivindicaciones dependientes 2, 4, 5, 8 a 13, 21, 24, 28, 31, 34 a 36, 41, 43 y 45 tampoco cumplen con el requisito de novedad.

6.2. Nivel Inventivo

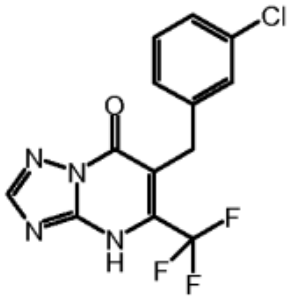
a. Teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 18 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, la reivindicación dependiente 3 (NC2022/0019060 del 27 de diciembre de 2022) se refiere a: “El compuesto según la reivindicación 1 o la reivindicación 2 (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D2	D3
El compuesto según la reivindicación 1 en el que x, y, y z se seleccionan independientemente de CR, N y NR”.	(Página 44, ejemplo 19)	A es 4-(4-methyl-piperazin-1-il)fenilo; R2 es fenilo; R3 es metilo (Página 65, compuesto 8)

Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690

D2 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 3, ya que divulga compuestos, como:



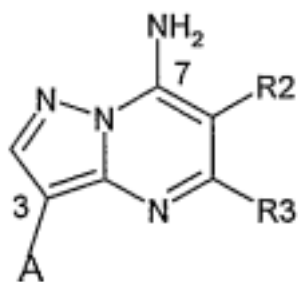
(Página 44, ejemplo 19 de D2). Los compuestos de D2 son usados en el tratamiento de diabetes (resumen de D2).

La diferencia entre la invención definida entre la reivindicación 3 y el compuesto divulgado en D2 consiste en que R² está directamente ligado al anillo de pirimidona, mientras que está ligado a través de un metileno en D2.

No hay evidencia de que el incluir R² directamente ligado al anillo de pirimidona proporcione un compuesto con algún efecto técnico diferente al que ya proporcionaba el objeto de D2, puesto que tener actividad en el trastorno metabólico, como lo es la diabetes, o cardiovascular ya había sido previsto en dicho documento (Página 1, línea 9 de D2).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el compuesto conocido en D2 con el fin de proporcionar otro compuesto alternativo?

Sin embargo, el incluir R² directamente ligado al anillo de pirimidona para tener actividad en el tratamiento de la diabetes ya está divulgado en D3 que se refiere a compuestos que actúan en enfermedades donde persiste la angiogénesis, como la diabetes (Página 4, párrafo 4). Los compuestos de D3 tienen una estructura química, como:



A es 4-(4-methyl-piperazin-1-il)fenilo; R2 es fenilo; R3 es metilo. (Página 65, compuesto 8).

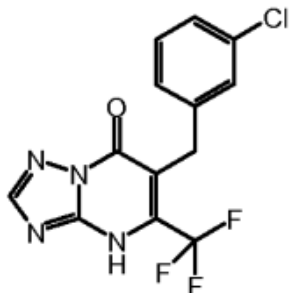
En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir R² directamente ligado al anillo de pirimidona del D3 en el compuesto de D2, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 6, 7, 14 a 20, 22, 23, 25 a 27, 29, 30, 32, 33, 37 a 40, 42, 44, 46 a 68 y 109 a 111 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al (“producto”, “proceso”) de la reivindicación Z, por lo cual se considera que carece de nivel inventivo.

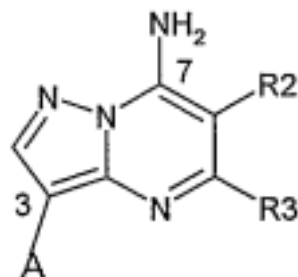
Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690

b. El examen de nivel inventivo de los párrafos anteriores aplica igualmente para las reivindicaciones independientes 69, 76, 89 y 90, así como sus dependientes 70 a 75, 77 a 88 y 91 a 108, debido a que los documentos D2 y D3 mencionan los compuestos:



(Página 44, ejemplo 19 de D2);



A es 4-(4-methyl-piperazin-1-il)fenilo; R2 es fenilo; R3 es metilo
(Página 65, compuesto 8).

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	Djerrari D. <i>et al.</i> Comptes Rendus. Chimie	1, 2, 4, 5, 8 a 13, 21, 24, 28, 31, 34 a 36, 41, 43 y 45	Novedad
D2	WO2011114148	3, 6, 7, 14 a 20, 22, 23, 25 a 27, 29, 30, 32, 33, 37 a 40, 42, 44, 46 a 68 a 111	Nivel inventivo
D3	WO2005070431	3, 6, 7, 14 a 20, 22, 23, 25 a 27, 29, 30, 32, 33, 37 a 40, 42, 44, 46 a 68 a 111	Nivel inventivo

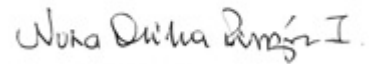
En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran 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 ibídem, 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.

Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690

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.



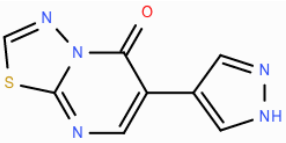
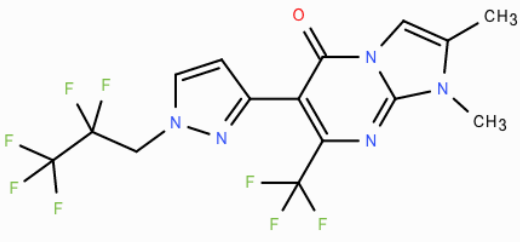
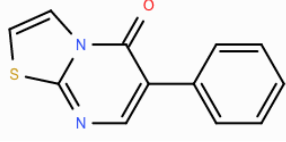
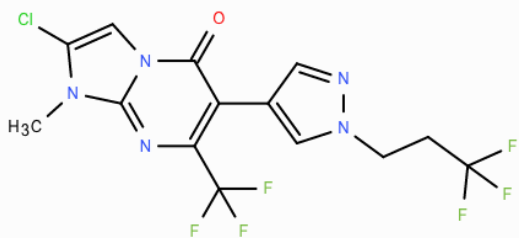
Nubia Milena Pinzon Ibañez
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES (E)

Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2022/0008690		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2020/062020		24/11/2020							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad			Presentación		
25/11/2019				X					
Solicitante									
AMGEN 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 111
Palabras clave utilizadas	Delta-5 Desaturase (“D5D”) inhib*. Pyrazol (L) pyrimidin. Pyrazol (L) triazolo. Metabolic. Cardiovascular. Polyunsaturated fatty acids (“PUFAs”) Por estructura:    
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: A61P 3/00, A61K 31/519, A61P 9/00, C07D 487/04, C07D 498/04, C07D 513/04

DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES
(Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)

Oficio N° 17818 de 14 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008690

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	12056222	20/09/2013	-	-	A
ISA	US2009253704	08/10/2009	-	-	A
	WO2011114148	22/09/2011	3, 6, 7, 14 a 20, 22, 23, 25 a 27, 29, 30, 32, 33, 37 a 40, 42, 44, 46 a 68 a 111	Página 44, ejemplo 19	Y
	Djerrari D. <i>et al.</i>	01/03/2002	1, 2, 4, 5, 8 a 13, 21, 24, 28, 31, 34 a 36, 41, 43 y 45	Página 180, compuesto 5	X
Patbase	WO2005070431	08/08/2005	3, 6, 7, 14 a 20, 22, 23, 25 a 27, 29, 30, 32, 33, 37 a 40, 42, 44, 46 a 68 a 111	Página 65, compuesto 8	Y
	WO15150995	08/01/2015	-	-	A
	WO17100201	15/06/2017	-	-	A
STN	US 20190070193	07/03/2019	-	-	A
(1) Cita completa literatura no patente (LNP) Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. <i>Nombre de la revista</i>. Volumen(Número), pp-pp. O Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx. Djerrari D. <i>et al.</i> (2002). L'acide déhydracétique, précurseur de nouvelles pyridopyrimidines, thiazolopyrimidines et pyridones. <i>Comptes Rendus. Chimie</i>, Volume 5. no. 3, pp. 177-183					
(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: (06/10/2025)					