

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27440

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-079133

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 30 de junio de 2010, con el N° 10-079133-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "ANÁLOGOS DE INSULINA EN LOS CUALES EL EXTREMO DE LA CADENA B CONSISTE EN UN RESIDUO AMINOÁCIDO, EL RESIDUO AMINOÁCIDO N-TERMINAL DE LA CADENA A DE LA INSULINA ES UN RESIDUO LISINA O ARGININA, LA POSICIÓN A8 DEL AMINOÁCIDO ESTÁ OCUPADA POR UN RESIDUO HISTIDINA, LA POSICIÓN A21 DEL AMINOÁCIDO ESTÁ OCUPADA POR UN RESIDUO GLICINA, Y SE EFECTÚAN UNA O MÁS SUSTITUCIONES Y/O ADICIONES DE RESIDUOS AMINOÁCIDOS NEGATIVAMENTE CARGADOS EN LAS POSICIONES A5, A15, A18, B-1, B0, B1, B2, B3 Y B4", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2009/000017 del 6 de enero de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 631 del 22 de agosto de 2011, habiéndose presentado oposición por parte de la(s) sociedad(es) Procaps S.A. y Lafrancol S.A., la(s) cual(es) una vez fue(ron) estudiada(s) por el Despacho, no desvirtuó la patentabilidad del objeto en estudio como se analizará más adelante.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 23301, notificado por fijación en lista el 26 de diciembre de 2013, se requirió a la 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.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 10-079133-00010-0000 del 22 de marzo de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 36 que reemplaza(n) las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: 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.*"

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27440

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-079133

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 36, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Oposiciones presentadas.

La sociedad opositora Lafrancol S.A. afirma que esta solicitud carece de novedad y nivel inventivo, puesto que las composiciones farmacéuticas que comprenden análogos de insulina con perfil basal de tiempo/acción, y cadena A y B con enlaces, son conocidos en la industria farmacéutica y señala que la presente solicitud pretende acceder a un beneficio patentario sobre composiciones farmacéuticas que se encuentran cubiertas y plenamente identificadas en el sector químico-farmacéutico y que moléculas como la insulina se encuentran bajo el conocimiento público desde un tiempo considerable, de manera que no existe novedad ni nivel inventivo sobre tales agentes. Finalmente, dice la sociedad opositora que las insulinas disponibles en el mercado son prácticamente idénticas a la hormona natural, con la diferencia que se les realiza ligeras modificaciones en la molécula original que son las responsables de las diferencias cinéticas que caracterizan cada preparado.

Frente a tales argumentos, la solicitante afirma que los argumentos de la opositora no se refieren a las características esenciales que le confieren el carácter novedoso e inventivo a la presente invención. Sostiene la solicitante que el hecho de que los componentes de una formulación sean conocidos en el arte previo no le resta novedad a la misma, aún más en el presente caso en el que las composiciones comprenden un ingrediente activo que es nuevo.

Por su parte, la sociedad opositora Procaps S.A. afirma que la solicitud carece de altura inventiva en vista de lo divulgado por los documentos US6100376 y WO2007081824, los cuales enseñan derivados de insulina con un punto isoeléctrico entre 5 y 8.5 que comprende un radical R31 como el del análogo de la presente solicitud y análogos de insulina con perfil basal tiempo/acción que comprenden la adición y/o sustitución de residuos de aminoácidos cargados negativa y positivamente, y una ampliación del grupo carboxi C-terminal de la cadena B de histidina en la posición 8 de la cadena A de la insulina.

Frente a tales argumentos, la solicitante afirma que el documento US6100376 no divulga las modificaciones a las posiciones A0, A5, A8, A15, A18, B-1, B0, B1, B2, B3, B4 y B9 de la presente solicitud ni muestra un análogo de insulina con un Arg- C-terminal o una cadena-B Lis-amidada. Señala también la solicitante que el documento WO2007081824 no sugiere las modificaciones en las posiciones A0, A5, A15, A18, B-1, B0, B2, B3, B29, B30, B31 y B32, por lo que las modificaciones de la presente solicitud no constituyen una derivación obvia de las enseñanzas de estos documentos.

De acuerdo con lo expuesto, frente al nuevo capítulo reivindicatorio aportado, los argumentos presentados por las sociedades opositoras no prosperan como elementos que

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27440

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-079133

permitan desvirtuar la patentabilidad de la solicitud que aquí se analiza, porque los documentos US6100376 y WO2007081824 no divulgan las características esenciales del análogo de la presente solicitud.

6.2. Objeto de la invención

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar un análogo de insulina con un perfil farmacocinético mejorado. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un análogo de insulina de la fórmula I.

6.3. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 9 de enero de 2008, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad.

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 publicación
D1	US 5,008,241	"Novel insulin peptides"	16/Abril/1991
D3	Biochemistry, Vol. 32, Pág. 10773-8	"Engineering stability of the insulin monomer fold with application to structure-activity relationships"	12/Octubre/1993

El documento D1¹ divulga un análogo de insulina en el que A21 es Ala, Ser, Thr o Gly (Col. 3, líneas 15-19) y en el que el grupo C-terminal de la cadena B es bloqueada por un grupo amida (Col. 3, línea 4).

Por su parte el documento D3² enseña un análogo de insulina que comprende el residuo His en A8 (Resumen y Pág. 10776, Col. derecha, Párr. 2).

6.4. Nivel Inventivo.

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: *"Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica"*.

1 <http://www.google.com/patents/US5008241>

2 <http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/8399225>

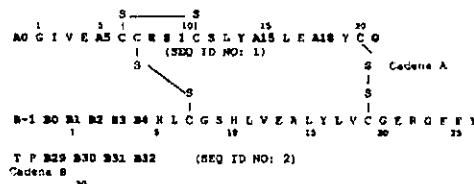
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27440

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-079133

En el presente caso, los análogos de insulina reclamados en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: "Un análogo de insulina de la fórmula I:



En que

A0 corresponde a Lys o Arg;

A5 corresponde a Asp, Gln o Glu;

A15 corresponde a Asp, Glu o Gln;

A18 corresponde a Asp, Glu o Asn;

B-1 corresponde a Asp, Glu o un grupo amino;

B0 corresponde a Asp, Glu o un enlace químico;

B1 corresponde a Asp, Glu o Phe;

B2 corresponde a Asp, Glu o Val;

B3 corresponde a Asp, Glu o Asn;

B4 corresponde a Asp, Glu o Gln;

B29 corresponde a Lys o un enlace químico;

B30 corresponde a Thr o un enlace químico;

B31 corresponde a Arg, Lys o un enlace químico;

B32 corresponde a Arg-amida o Lys-amida;

en que dos residuos aminoácidos del grupo que comprende A5, A15, A18, B-1, B0, B1, B2, B3 y B4 corresponden, simultánea e independientemente uno de otro, a Asp o Glu" (Ver página 9 del radicado N° 10-079133-00010-0000).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D3 que

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27440

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-079133

representa(n) el estado de la técnica:

Tabla 1

Características esenciales	D1	D3
Un análogo de insulina de la fórmula I, en que:	Un análogo de insulina en el que:	Un análogo de insulina en el que:
A0 corresponde a Lys o Arg;	No se menciona	No se menciona
A5 corresponde a Asp, Gln o Glu;	A5 es Glu	A5 es Glu
A8 es His	No se menciona	A8 es H (Resumen y Pág. 10776, Col. derecha, Párr. 2)
A15 corresponde a Asp, Glu o Gln;	A15 es Glu	A15 es Glu
A18 corresponde a Asp, Glu o Asn;	A18 es Asn	A18 es Asn
A21 corresponde a Ala, Ser, Thr o Gly;	A21 es Ala, Ser, Thr o Gly (Col. 3, líneas 15-19)	No se menciona
B-1 corresponde a Asp, Glu o un grupo amino;	B-1 es un grupo amino	B-1 es un grupo amino
B0 corresponde a Asp, Glu o un enlace químico;	B0 es un enlace químico	B0 es un enlace químico
B1 corresponde a Asp, Glu o Phe;	B1 es Phe	B1 es Phe
B2 corresponde a Asp, Glu o Val;	B2 es Val	B2 es Val
B3 corresponde a Asp, Glu o Asn;	B3 es Asn	B3 es Asn
B4 corresponde a Asp, Glu o Gln;	B4 es Glu	B4 es Glu
B29 corresponde a Lys o un enlace	B29 es Lys	B29 es Lys

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27440

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-079133

químico;		
B30 corresponde a Thr o un enlace químico;	B30 es Thr	B30 es Thr
B31 corresponde a Arg, Lys o un enlace químico;	B31 un aminoácido básico (Col. 5, líneas 14-17)	No se menciona
B32 corresponde a Arg-amida o Lys-amida; En que dos residuos aminoácidos del grupo que comprende A5, A15, A18, B-1, B0, B1, B2, B3 y B4 corresponde, simultánea e independientemente uno de otro, a Asp o Glu.	Un residuo amida en el extremo C-terminal de la cadena B (Col. 3, línea 4)	No se menciona

Como se dijo anteriormente, los documentos D1 y D3 son considerados el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque:

El documento D1 enseña un análogo de insulina en el que A21 es Ala, Ser, Thr o Gly (Col. 3, líneas 15-19) y en el que el grupo C-terminal de la cadena B está bloqueado por un grupo amida (Col. 3, línea 4) o en el que una carga positiva es introducida por la presencia de un residuo de aminoácido básico en B31 (Col. 5, líneas 10-17). El documento D1 también divulga que estos análogos tienen estabilidad mejorada y un mejorado perfil tiempo/acción (Col. 3, líneas 49-53) y que pueden estar disueltos en una preparación (Col. 4, líneas 26-53). El documento D1 igualmente enseña un ADN que codifica el precursor del análogo de insulina y un vector que comprende el ADN (Col. 15-17).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el análogo de insulina divulgado en el documento D1 consiste en que el análogo de la solicitud comprende un residuo His en A8 y un residuo Lys o Arg en A0.

El efecto que logra el incluir un residuo His en A8 y un residuo Lys o Arg en A0 es que permite obtener análogos de insulina con un perfil de tiempo/acción mejorado.

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar los análogos conocidos en el documento D1 para proporcionar análogos de insulina con un perfil de tiempo/acción mejorado.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27440

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-079133

Ahora bien, teniendo en cuenta que el documento D1 da a conocer un análogo de insulina en el que A21 es Ala, Ser, Thr o Gly (Col. 3, líneas 15-19) y en el que el grupo C-terminal de la cadena B está bloqueado por un grupo amida (Col. 3, línea 4), en el que una carga positiva es introducida por la presencia de un residuo de aminoácido básico en B31 (Col. 5, líneas 10-17) y que el documento D3 divulga un análogo de insulina que comprende el residuo His en A8, el cual tiene una estabilidad mejorada, asociada a una actividad biológica mejorada (Resumen y Pág. 10776, Col. derecha, Párr. 2), una persona normalmente versada en la materia, incluiría el residuo His en A8 en el análogo de insulina del documento D1, el cual también enseña que es una práctica común la modificación del punto isoeléctrico de la insulina, para disminuir la solubilidad de los análogos de insulina, mediante la adición de aminoácidos básicos como lisina o arginina, esperando con certeza, lograr análogos de insulina con un mejorado perfil de tiempo/acción.

De manera que la solución propuesta por esta solicitud en la reivindicación 1 y en las reivindicaciones 2 – 36 no tiene nivel inventivo.

En referencia al argumento de la solicitante, según el cual ninguno de los documentos citados enseña o sugiere una Arg amida o Lys amida en la posición B32 como en el caso de los análogos de la presente solicitud, los cuales de forma sorprendente presentan un perfil tiempo/acción mejorado, esta Superintendencia se permite aclarar que el documento D1 si enseña un análogo de insulina en el que el grupo C-terminal de la cadena B es bloqueada por un grupo amida (Col. 3, línea 4) o en el que una carga positiva es introducida por la presencia de un residuo de aminoácido básico en B31 (Col. 5, líneas 10-17). Por demás, el documento D1 divulga que es una práctica común la modificación del punto isoeléctrico de la insulina para disminuir la solubilidad de los análogos de insulina, mediante la adición de aminoácidos básicos como lisina o arginina en la cadena B o mediante el dipéptido básico Arg-Arg (Col. 2, líneas 9-19). De esta forma, teniendo en cuenta que el documento D1 ya enseñaba análogos de insulina con esta propiedad y que el documento D3 enseña que análogos que comprenden el residuo His en A8 tienen una estabilidad mejorada, asociada a una actividad biológica mejorada, la persona normalmente versada en la materia tendría una alta probabilidad de éxito en preparar análogos con un mejorado perfil tiempo/acción como los de la presente solicitud.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentadas, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Declarar infundadas las oposiciones presentadas por la(s) sociedad(es) Procaps S.A. y Lafrancol S.A., de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente Resolución.

ARTÍCULO SEGUNDO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "ANÁLOGOS DE INSULINA EN LOS CUALES EL EXTREMO DE LA CADENA B CONSISTE EN UN RESIDUO AMINOÁCIDO, EL RESIDUO AMINOÁCIDO N-TERMINAL DE LA CADENA A DE LA INSULINA ES UN RESIDUO LISINA O ARGININA, LA POSICIÓN A8 DEL AMINOÁCIDO ESTÁ OCUPADA POR UN RESIDUO HISTIDINA, LA POSICIÓN A21 DEL AMINOÁCIDO ESTÁ OCUPADA POR UN

Página 7 de 8

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1079370330

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27440

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-079133

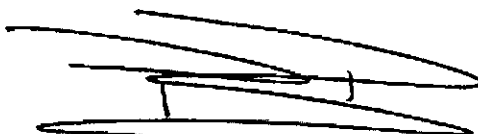
RESIDUO GLICINA, Y SE EFECTÚAN UNA O MÁS SUSTITUCIONES Y/O ADICIONES DE RESIDUOS AMINOÁCIDOS NEGATIVAMENTE CARGADOS EN LAS POSICIONES A5, A15, A18, B-1, B0, B1, B2, B3 Y B4".

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, y a la(s) sociedad(es) opositora(s) Procaps S.A., entregándoles copia de la misma y advirtiéndoles que contra ellas procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los cinco (5) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 10 May 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

info@castellanosyco.co

Doctor(a)

TITO NOÉ PARRA MURILLO

tparra@lafrancof.com

Elaboró: Moncaleano Prado Juan David ✓
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓