

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE

Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. – Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cablenet.co
mdeabogados@cablenet.co

Miembros ACPI – ASIPI – AIPPI

Bogotá D.C., 2 de Octubre de 2014

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-004197- -00010-0000

Fecha: 2014-10-03 16:09:39 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 449 RESPUESOPOSICI Folios: 20

Señores
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Ciudad

REFERENCIA: Expediente No. 12 – 004.197
TÍTULO: “ANÁLOGOS DE GLUCAGÓN ACILADOS”
SOLICITANTE: ZEALAND PHARMA A/S
TRÁMITE: Respuesta a Oposición Oficio No. 6.007 del 27 de mayo de 2014.

JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS, en mi condición de apoderado de la **ZEALAND PHARMA A/S**, dentro del término legal, presento respuesta a la Oposición notificada mediante Oficio No. 6.007 del 27 de mayo de 2014.

1. Reivindicaciones relativas a un uso(Art 14 D 486)

El Examinador Técnico manifiesta:

“El uso de las reivindicaciones 39-50 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

Aun cuando las reivindicaciones 39-50 se encabezan como compuesto se definen por referencia al uso”.

R/: Nuestro poderdante **DESISTE** de las Reivindicaciones 39 a 50 de acuerdo a lo expresado por el Examinador Técnico de Patentes y a las exigencias del Art 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE

Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690824
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIFI – AIPPI

2. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El Examinador Técnico de Patentes objeto el Capítulo Reivindicatorio porque:

"1- La reivindicación 1 no es concisa en cuanto a la definición del compuesto en la medida que incluye más de once variantes de uno de los componentes del mismo y utiliza las expresiones "se selecciona de (...)", "en la que al menos (...)" lo cual dificulta determinar la extensión del objeto que se busca proteger. "De otra parte, no existe sustento descriptivo que todas y cada una de las sustituciones a las que se hace referencia, compartan la actividad del compuesto reclamado..."

"2- Por otra parte, las reivindicaciones 1, 33, 35 y sus dependientes no son claras, debido a que no se puede definir por sus propiedades fisicoquímicas el enlazante conjugado al péptido en la Markush, específicamente cuando en la reivindicación 30 se hace referencia a un enlazante lipófilo..."

"3- Las reivindicaciones 3, 4, 11, 17, 18-25, 30-33, 35, de la misma manera que la reivindicación 1, no se encuentran claramente definidas. Se sugiere ser más específicos"

"4- Las reivindicaciones 18 a 23, 33 y 35 no son concisas, debido a que repiten el contenido de la reivindicación 1. Se sugiere eliminar dichas reivindicaciones"

"5- La reivindicación 10 no es clara debido a que menciona la posibilidad de puentes intramoleculares por formación de sales o enlaces amida para formar amidas cíclicas denominadas lactamas..."

"6- La composición de las reivindicaciones 37-38 debe ser definida a partir de todos los elementos que la conforman, incluyendo la estructura de los análogos de glucagón y las proporciones de los mismos"

"El capítulo reivindicatorio no define de manera clara y concisa el compuesto que se desea proteger. Las reivindicaciones que se desarrollaron definen cada una un compuesto diferente y no se hace referencia a las secuencias dadas en la descripción. Se sugiere definir el compuesto que se solicita de manera específica con el fin de permitir realizar una comparación con el estado de la técnica, adicionalmente que se resalten las características esenciales del mismo"

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE

Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIPI - AIPPI

“Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones necesarias”.

R/: Nuestro poderdante de acuerdo a las objeciones del Examinador Técnico de Patentes **modifico el capítulo reivindicatorio** teniendo en cuenta lo siguiente:

Las reivindicaciones se han modificado para requerir una sola substitución lipofilica en la posición 17, la cual tiene base en la reivindicación original 15. Ha sido especificado que el residuo modificado es lisina, que tiene base en la pág. 29, líneas 1-8.

Las opciones para la modificación en otras posiciones previamente permitidas para un residuo "X" (posiciones 16, 20, 24, 27 y 28) han sido limitadas para ser consistente con este y por consistencia con los compuestos ejemplificados. Más base para los residuos enunciados se encuentra en la página 5, líneas 18-23. Las únicas diferencias con los residuos preferidos recitados en la pág. 5, líneas 18-23 son las siguientes:

El residuo en la posición 12 ha sido especificado como Lys (otras opciones se han eliminado). En la posición X20, la opción para la Cys ha sido omitida. Glu ha sido incluida con soporte en la reivindicación 1 original, página 7, línea 4 y mediante el ejemplificado compuesto 42. Glu ha sido incluido en la posición X28, que es soportado por la reivindicación original 1, página 9, línea 6, y por los compuestos ejemplificados 43.

Además se incluyó una reivindicación nueva para un compuesto específico. Se ha dispuesto tras la reivindicación 32. Este corresponde al compuesto 7 de los ejemplos.

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE



Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIPI - AIPPI

El Examinador ha desarrollado varias objeciones al ámbito de las reivindicaciones y ha sugerido que los compuestos sean definidos específicamente para el propósito de permitir que la comparación sea hecha con el estado de la técnica, además de reseñar las características esenciales de la misma. Por ello las reivindicaciones se han modificado.

Se ha reducido mucho el ámbito de protección de la reivindicación 1 para que refleje los residuos que están contenidos en los compuestos ejemplificados. Es más ahora las reivindicaciones requieren que la posición 17 sea una Lys y que la molécula tenga un único sustituyente lipofílico el cual esté conjugado al residuo de Lys en la posición 17.

Ahora las reivindicaciones específica que solo hay un sustituyente lipofílico y que está conjugado a la posición 17 de Lys. El término "sustituyente lipofílico" por sí mismo puede ser perfectamente entendido por un técnico medio en la materia y es suficientemente claro para poderlo comparar con el estado de la técnica.

Se ha eliminado la reivindicación 3. Se han eliminado opciones de la reivindicación 4 y de la reivindicación 11. La reivindicación 17 se elimina. Las reivindicaciones 18-25 se han modificado de acuerdo con la reivindicación 1. Las opciones se han eliminado de las reivindicaciones 31 y 32, Las reivindicaciones 33 y 35 se han eliminados. Con estos cambios las reivindicaciones son mucho más específicas.

Nuestro poderdante desea recalcar que las reivindicaciones 18 a 23 no son una repetición de la reivindicación 1. Definen un grupo de compuestos más específicos. Por ejemplo, si la comparamos con la reivindicación 1, la reivindicación 18 especifica el residuo en la posición 2 y da menos número de opciones en ciertas posiciones.

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE



Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. – Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIPI – AIPPI

La reivindicación 10 se ha incorporado a la reivindicación 11.

En cuanto a las **reivindicaciones de composiciones**, el solicitante manifiesta que con respecto a la especificación de la cantidad de los compuestos que comprenden las mismas, desea indicar que no existe base explícita en la memoria a partir de la cual se puedan especificar unas cantidades dadas. Sin embargo, respetuosamente discrepa de la necesidad de dicha limitación ya que consideramos que especificar dichas cantidades no es una característica técnica esencial para definir la invención ya que pueden ser fácilmente determinadas por un experto en la materia en cada caso concreto. Considera que dicha limitación haría la reivindicación muy vulnerable de cara a su posible infracción por terceros que no tendrían más que modificar las cantidades de uno de los componentes para no infringir la reivindicación. Por eso no se debería impedir que el solicitante obtenga una mayor protección sobre su invención ya que lo contrario iría contra el sentido mismo de la ley de patentes ya que la protección conferida al solicitante resultaría muy mermada a cambio de que éste divulgue su invención.

Del mismo modo en relación con las reivindicaciones de composición el término “vehículo” es un término perfectamente conocido para un técnico medio en la materia, y el término “vehículo farmacéuticamente aceptable” además queda definido en la memoria de la patente y perfectamente ejemplificado en la página 53, líneas 5-17.

Por lo anterior, el solicitante pone a consideración del Examinador Técnico de Patentes, un **NUEVO CAPITULO REIVINDICATORIO** el cual consta de **veinticuatro (24) Nuevas Reivindicaciones** en nueve folios.

3. Unidad de invención (Art 25 D 486)

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE



Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIPI – AIPPI

El Examinador Técnico de Patentes objeto la Unidad de Invención porque:

“La solicitud que define una estructura en términos de las variantes: R1-X-Z-R2 no tiene unidad de invención a posteriori con base en el documento D2 y el documento nacional C011-74017. El documento C011-74017 afecta la novedad a la parte fija de la estructura que es la SEQ del péptido que corresponde al radical Z, en el documento D1 se divulgan las diferentes posiciones en las que es posible modificar la estructura de glucagón. Por lo anterior, este Despacho encuentra que existen once grupos inventivos con base en la variabilidad de X dentro de la fórmula R1-Z-R2, a saber:....”

R/: Nuestro poderdante de acuerdo a lo expresado por el Examinador Técnico de Patentes manifiesta que la restricción a un único sustituyente lipofílico en la **Lysina 17** mencionada anteriormente, le proporciona un **único concepto inventivo** a la invención. Además como se va a demostrar más adelante, las reivindicaciones modificadas son nuevas e inventivas respecto al estado de la técnica.

1.

D

EL ANÁLISIS DE PATENTABILIDAD.

Novedad (art.16 D 486)

El Examinador objeta el **Novedad de la invención** para las reivindicaciones 1-6, 12-25, 33-38 con el documento **D1 (C011-74017)** porque:

“(...)”

“Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, el cual da a conocer un compuesto de fórmula R1-X-Z-R2 conjugado con un sustituyente lipófilo eficaz para promover la pérdida de peso o prevenir el aumento de peso y en el tratamiento de diabetes, síndrome metabólico y trastornos asociados”.

“En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva o carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1. Lo mismo para las reivindicaciones 33, 35”.

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE

Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIPi – AIPPI

“Las reivindicaciones dependientes 2-6, 12-25, 34, 36-38 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas”.

R/: Con relación a las objeciones del Examinador de Patentes con respecto a la falta de **Novedad** de la invención en estudio, el solicitante desea resaltar que hay diferencias sustanciales respecto al documento **D1** mencionado en lo siguiente:

El documento **D1** describe un substituyente lipofílico presente en cualquier lugar del péptido X. Esto **no da ninguna descripción general en relación con la posición del substituyente**. En particular, **no da ninguna enseñanza en relación al substituyente lipofílico en la Lisina 17**.

El compuesto específico HSQGTFTSDYSKYLDS-K(Hexadecanoil-□-
Glu)_AAHDFVEWLLRA mencionado en el documento **D1** es un **"Disclaimers"** en la presente invención, queremos decir que expresamente **este compuesto no ha sido incluido en la presente invención**.

Por lo tanto, el **alcance de la presente invención** tal como se encuentra en el **nuevo capítulo reivindicatorio adjunto**, **no se encuentra descrito ni definido** en el documento **D1** del arte previo mencionado por el Examinador de Patentes, por lo cual la patente de invención es **NOVEDOSA**.

Nivel Inventivo (art. 18 D 486).

El Examinador objeta el **nivel inventivo** para las reivindicaciones 1 - 38 con los documentos **D2 (WO2008101017)** y **D3 (WO9808871)**, porque:

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE

■ ■ ■ ■ ■
Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIPi – AIPPI

“(...)”

“La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D2 consiste en la sustitución con residuos lipófilos”.

“En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría sustituciones de tipo lipofílico para el aumento de la vida media de los compuestos del documento D3 en los compuestos divulgados en el documento D2 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia”.

“Por otro lado, es preciso aclarar que la reivindicación 1 comprende sustituciones que no encuentran soporte descriptivo como se especifica en el análisis de las reivindicaciones del presente Oficio y que no se encuentran resultados que muestren que la estabilidad o el aumento de la vida media de los compuestos sea mayor comparado con los análogos de glucagón que tienen sustituciones hidrofílicas”.

“Las reivindicaciones dependientes 2-38 no mencionan características adicionales que hagan inventivo al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se consideran obvias”.

R/: Con relación a las objeciones del Examinador de Patentes respecto a la falta de **Nivel Inventivo** de la invención en estudio, en vista de la combinación de los documentos **D2 y D3**, el solicitante no está de acuerdo por los siguientes motivos:

Nuestro poderdante indica que los compuestos descritos en el documento **D2 no son los mismos compuestos que los de la presente reivindicaciones**. En particular el documento **D2 no describe ninguna secuencia con Ala en la posición 29, como sí es requerido en la presente reivindicación 1**. Tampoco da ninguna motivación para modificar la posición 29 a Ala.

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE



Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdejaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIPI – AIPPI

Lo que sugiere el documento **D2** es modular la posición 29 para dar una cadena lateral adecuada para entrecruzamientos con moléculas hidrofóbicas tal como PEG (página 8, líneas 9-27) -Ala pero la alanina no es adecuado para esto. También se sugiere que la modificación en la posición 29 a glicina para aumentar la potencia, muy específicamente en situaciones donde el péptido tienen un extensión C-terminal especificada (página 8, líneas 10-26, página 22, líneas 27-30, página 26, línea 28- página 27, línea 23). **Esto tiene muy poca relevancia para las reivindicaciones presentes, las cuales no se refieren a péptidos con la extensión C-terminal especificada y no cubren la glicina en la posición 29.** Finalmente, se sugiere introducir un residuo cargado en la posición 28 ó 29 para mejorar la solubilidad (pág. 29, líneas 27-32)- la alanina no es un residuo cargado. Por lo tanto el documento **D2** **no da ninguna motivación para substituir la posición 29 con alanina.**

Con relación al **substituyente lipofilico**, el solicitante quiere recalcar que el documento **D3** está relacionado con GLP-1, **el cual es estructuralmente distinto a los análogos de glucagón, de las presentes reivindicaciones.**

Es más, la **presente solicitud de patente de invención de nuestro poderdante**, dice en la página 30, líneas 12-22:

“Generalmente se cree que la presencia de aminoácidos básicos en las posiciones 17 y 18 es necesaria para la activación completa de receptores de glucagón (Unson y col. J. Biol. Chem. 1998, 273, 10308-10312). Los presentes inventores han encontrado que, cuando la posición 18 es alanina, la sustitución con un aminoácido hidrófobo en la posición 17 todavía puede dar un compuesto altamente potente. Incluso los compuestos en los que el aminoácido en la posición 17 está derivatizado con un substituyente lipófilo retienen casi la potencia

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE



Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIPI – AIPPI

completa en tanto los receptores de glucagón como de GLP-1, además de mostrar un perfil farmacocinético significativamente prolongado. Esto es incluso cuando se derivatiza una lisina en la posición 17, convirtiendo la cadena lateral de amina básica en un grupo amida neutro".

Por lo tanto, la **derivatización de la lisina con un sustituyente lipofílico en la posición 17 convierte un residuo fuertemente básico a neutro**, mientras sigue resultando en un compuesto de muy alta potencia tanto para el glucagón y los receptores de GLP-1. La **capacidad de este sustituyente particular no puede derivarse** del documento **D2** o del documento **D3** solos o combinados.

En conclusión, los documentos **D1, D2 y D3** del estado de la técnica **NO enseñan, NI sugieren los compuestos descritos en las reivindicaciones 1- 24 de la presente solicitud de patente de nuestro poderdante**, por lo cual la invención cumple con los requisitos de **NOVEDAD y NIVEL INVENTIVO**.

Finalmente, el solicitante pone a consideración del Examinador Técnico de Patentes: Un **NUEVO CAPÍTULO REIVINDICATORIO** el cual incluye **veinticuatro (24) Nuevas Reivindicaciones** en nueve folios; el cual cumple con los requisitos de **NOVEDAD, NIVEL INVENTIVO Y APLICACIÓN INDUSTRIAL** exigidos por la Decisión 486 del Acuerdo de la Comisión de la Comunidad Andina; además, estamos dando respuesta al Concepto Técnico notificado mediante Oficio No. 6.007 del 27 de mayo de 2014.

Por lo expresado anteriormente, solicito respetuosamente se proceda a **CONCEDER** la Patente de Invención titulada: **"ANÁLOGOS DE GLUCAGÓN ACILADOS"** a nombre de la sociedad **ZEALAND PHARMA A/S.**, para las nuevas Reivindicaciones 1 a 24 inclusive.

Atentamente,

Marcas – Patentes
Modelos – Diseños
Nombres Comerciales – Enseñas
Propiedad Intelectual
Registros en el Exterior
Registros Sanitarios INVIMA – ICA
Acciones Judiciales – Administrativas
Derecho Comercial – Industrial
Asesoría – Contratos – Otros
Corresponsalia a Nivel Mundial

MDE



Mario Delgado Echeverry e Hijos SAS.

Abogados Consultores – Marcas y Patentes

Bogotá D.C. - Colombia
Avda. Kra. 24 Park Way No. 37 – 31 Of.
202
Tels. (571) 2444096 – 3690624
Fax (571) 2442496 A.A. No. 6207
E-mail: mde@mdelaw.com
mdelawof@cable.net.co
mdeabogados@cable.net.co

Miembros ACPI – ASIPi – AIPPI



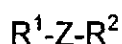
JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS
C.C. No. 19.270.955 Bogotá
T.P. No. 43.308 C.S.J.

Anexos:

Nuevas Reivindicaciones (24) en nueve folios.

NUEVAS REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que tiene la fórmula:



en la que

R^1 es H, alquilo C_{1-4} , acetilo, formilo, benzoilo o trifluoroacetilo;

R^2 es OH o NH_2 ;

y Z es un péptido que tiene la fórmula I

His-X2-Gln-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Tyr-Ser-Lys-Tyr-Leu-Asp-X16-Lys-Ala-Ala-X20-X21-Phe-Val-X24-Trp-Leu-X27-X28-Ala; (I)

en la que

X2 se selecciona de Aib y Ser;

X16 se selecciona de Glu, Lys y Ser;

X20 se selecciona de Arg, His, Glu y Lys;

X21 se selecciona de Asp y Glu;

X24 se selecciona de Ala, Glu y Lys;

X27 se selecciona de Leu y Lys;

X28 se selecciona de Arg, Glu, Lys y Ser;

en la que la cadena lateral de Lys en la posición 17 está conjugada con un sustituyente lipófilo que tiene la fórmula:

(i) Z^1 en la que Z^1 es un resto lipófilo conjugado directamente con la cadena lateral de Lys en la posición 17; o

(ii) Z^1Z^2 en la que Z^1 es un resto lipófilo, Z^2 es un espaciador y Z^1 está conjugado con la cadena lateral de Lys en la posición 17 mediante Z^2 ;

con la condición de que Z no sea HSQGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLRA.

2. Un compuesto según una cualquiera de las Reivindicación 1, en el que el péptido de fórmula I incluye una o más de las siguientes combinaciones de residuos:

X2 es Aib y X17 es Lys;

X2 es Aib y X28 es Lys;

X12 es Lys y X20 es Lys;

X16 es Lys y X17 es Lys;

X16 es Ser y X17 es Lys;

X17 es Lys y X20 es Lys;

X17 es Lys y X21 es Asp;
 X17 es Lys y X24 es Glu;
 X17 es Lys y X27 es Leu;
 X17 es Lys y X27 es Lys;
 X17 es Lys y X28 es Ser;
 X17 es Lys y X28 es Arg;
 X20 es Lys y X27 es Leu;
 X21 es Asp y X27 es Leu;
 X2 es Aib, X12 es Lys y X16 es Ser;
 X12 es Lys, X17 es Lys y X16 es Ser;
 X16 es Glu, X17 es Lys y X20 es Lys;
 X16 es Ser, X21 es Asp y X24 es Glu;
 X17 es Lys, X24 es Glu y X28 es Arg;
 X17 es Lys, X24 es Glu y X28 es Lys;
 X17 es Lys, X27 es Leu y X28 es Ser;
 X17 es Lys, X27 es Leu y X28 es Arg;
 X20 es Lys, X24 es Glu y X27 es Leu;
 X20 es Lys, X27 es Leu y X28 es Ser;
 X20 es Lys, X27 es Leu y X28 es Arg.
 X16 es Ser, X20 es His, X24 es Glu y X27 es Leu;
 X17 es Lys, X20 es His, X24 es Glu y X28 es Ser; o
 X17 es Lys, X20 es Lys, X24 es Glu y X27 es Leu.

3. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes en el que la secuencia de péptidos de fórmula I comprende uno o más puentes intramoleculares.
4. Un compuesto según la reivindicación 3 en el que dicho puente intramolecular está formado entre las cadenas laterales de dos residuos de aminoácidos que están separados por tres aminoácidos en la secuencia lineal de aminoácidos de fórmula I.
5. Un compuesto según la reivindicación 4 en el que el puente intramolecular está formado entre las cadenas laterales de los pares de residuos 16 y 20, 17 y 21 20 y 24 ó 24 y 28.

6. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 3 a 5 en el que el puente intramolecular es un puente salino o un anillo de lactama el cual conlleva un par de residuos donde:

X16 es Glu y X20 es Lys;

X16 es Glu y X20 es Arg;

X16 es Lys y X20 es Glu;

X20 es Glu y X24 es Lys;

X20 es Lys y X24 es Glu; o

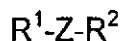
X20 es Arg y X24 es Glu;

X24 es Glu y X28 es Lys;

X24 es Glu y X28 es Arg; o

X24 es Lys y X28 es Glu.

7. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:



en la que

R^1 es H, alquilo C_{1-4} , acetilo, formilo, benzilo o trifluoroacetilo;

R^2 es OH o NH_2 ;

y Z es un péptido que tiene la fórmula IIa

His-Aib-Gln-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Tyr-Ser-Lys-Tyr-Leu-Asp-X16-Lys-Ala-Ala-X20-X21-Phe-Val-X24-Trp-Leu-Leu-X28-Ala; (IIa)

en la que

X16 se selecciona de Ser, Glu y Lys;

X20 se selecciona de His, Glu y Lys;

X21 se selecciona de Asp y Glu;

X24 se selecciona de Ala y Glu; y

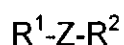
X28 se selecciona de Ser, Lys y Arg;

en la que la cadena lateral de Lys en la posición 17 está conjugada con un sustituyente lipófilo que tiene la fórmula:

(i) Z^1 en la que Z^1 es un resto lipófilo conjugado directamente con la cadena lateral de X; o

(ii) Z^1Z^2 en la que Z^1 es un resto lipófilo, Z^2 es un espaciador y Z^1 está conjugado con la cadena lateral de X mediante Z^2 .

8. Un compuesto según la reivindicación 1 que tiene la fórmula:



en la que

R^1 es H, alquilo C_{1-4} , acetilo, formilo, benzoílo o trifluoroacetilo;

R^2 es OH o NH_2 ;

y Z es un péptido que tiene la fórmula IIb

His-Ser-Gln-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Tyr-Ser-Lys-Tyr-Leu-Asp-X16-Lys-Ala-Ala-X20-X21-Phe-Val-X24-Trp-Leu-Leu-X28-Ala; (IIb)

en la que

X16 se selecciona de Ser, Glu y Lys;

X20 se selecciona de His, Glu y Lys;

X21 se selecciona de Asp y Glu;

X24 se selecciona de Ala y Glu; y

X28 se selecciona de Ser, Lys y Arg;

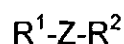
en la que la cadena lateral de Lys en la posición 17 está conjugada con un sustituyente lipófilo que tiene la fórmula:

(i) Z^1 en la que Z^1 es un resto lipófilo conjugado directamente con la cadena lateral de X; o

(ii) Z^1Z^2 en la que Z^1 es un resto lipófilo, Z^2 es un espaciador y Z^1 está conjugado con la cadena lateral de X mediante Z^2 ;

con la condición de que Z no sea HSQGTFTSDYSKYLDK(hexadecanoil- γ -Glu))-AAHDFVEWLLRA.

9. Un compuesto según la reivindicación 7 que tiene la fórmula:



en la que

R^1 es H, alquilo C_{1-4} , acetilo, formilo, benzoílo o trifluoroacetilo;

R^2 es OH o NH_2 ;

y Z es un péptido que tiene la fórmula IIIa

His-Aib-Gln-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Tyr-Ser-Lys-Tyr-Leu-Asp-Ser-Lys-Ala-Ala-X20-X21-Phe-Val-X24-Trp-Leu-Leu-X28-Ala; (IIIa)

en la que

X20 se selecciona de His, Glu y Lys;

X21 se selecciona de Asp y Glu;

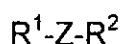
X24 se selecciona de Ala y Glu;

X28 se selecciona de Ser, Lys y Arg;

en la que la cadena lateral de Lys en la posición 17 está conjugada con un sustituyente lipófilo que tiene la fórmula:

- (i) Z^1 en la que Z^1 es un resto lipófilo conjugado directamente con la cadena lateral de X; o
- (ii) Z^1Z^2 en la que Z^1 es un resto lipófilo, Z^2 es un espaciador y Z^1 está conjugado con la cadena lateral de X mediante Z^2 .

10. Un compuesto según la reivindicación 8 que tiene la fórmula:



en la que

R^1 es H, alquilo C_{1-4} , acetilo, formilo, benzoilo o trifluoroacetilo;

R^2 es OH o NH_2 ;

y Z es un péptido que tiene la fórmula IIIb

His-Ser-Gln-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Tyr-Ser-Lys-Tyr-Leu-Asp-Ser-Lys-Ala-Ala-X20-X21-Phe-Val-X24-Trp-Leu-Leu-X28-Ala; (IIIb)

en la que

X20 se selecciona de His, Glu y Lys;

X21 se selecciona de Asp y Glu;

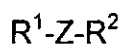
X24 se selecciona de Ala y Glu;

X28 se selecciona de Ser, Lys y Arg;

en la que la cadena lateral de Lys en la posición 17 está conjugada con un sustituyente lipófilo que tiene la fórmula:

- (i) Z^1 en la que Z^1 es un resto lipófilo conjugado directamente con la cadena lateral de X; o
 - (ii) Z^1Z^2 en la que Z^1 es un resto lipófilo, Z^2 es un espaciador y Z^1 está conjugado con la cadena lateral de X mediante Z^2 ;
- con la condición de que Z no sea HSQGTFTSDYSKYLDK(hexadecanoil- γ -Glu))-AAHDFVEWLLRA.

11. Un compuesto según la reivindicación 9 que tiene la fórmula:



en la que

R^1 es H, alquilo C_{1-4} , acetilo, formilo, benzoílo o trifluoroacetilo;

R^2 es OH o NH_2 ;

y Z es un péptido que tiene la fórmula IVa

His-Aib-Gln-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Tyr-Ser-Lys-Tyr-Leu-Asp-Ser-Lys-Ala-Ala-His-X21-Phe-Val-X24-Trp-Leu-Leu-X28-Ala; (IVa)

en la que

X21 se selecciona de Asp y Glu;

X24 se selecciona de Ala y Glu;

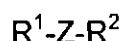
X28 se selecciona de Ser, Lys y Arg;

y en la que la cadena lateral de Lys en la posición 17 está conjugada con un sustituyente lipófilo que tiene la fórmula:

(i) Z^1 en la que Z^1 es un resto lipófilo conjugado directamente con la cadena lateral de X; o

(ii) Z^1Z^2 en la que Z^1 es un resto lipófilo, Z^2 es un espaciador y Z^1 está conjugado con la cadena lateral de X mediante Z^2 .

12. Un compuesto según la reivindicación 10 que tiene la fórmula:



en la que

R^1 es H, alquilo C_{1-4} , acetilo, formilo, benzoílo o trifluoroacetilo;

R^2 es OH o NH_2 ;

y Z es un péptido que tiene la fórmula IVb

His-Ser-Gln-Gly-Thr-Phe-Thr-Ser-Asp-Tyr-Ser-Lys-Tyr-Leu-Asp-Ser-Lys-Ala-Ala-His-X21-Phe-Val-X24-Trp-Leu-Leu-X28-Ala; (IVb)

en la que

X21 se selecciona de Asp y Glu;

X24 se selecciona de Ala y Glu

X28 se selecciona de Ser, Lys y Arg;

y en la que la cadena lateral de Lys en la posición 17 está conjugada con un sustituyente lipófilo que tiene la fórmula:

(i) Z^1 en la que Z^1 es un resto lipófilo conjugado directamente con la cadena lateral de X; o

(ii) Z^1Z^2 en la que Z^1 es un resto lipófilo, Z^2 es un espaciador y Z^1 está conjugado con la cadena lateral de X mediante Z^2 ;

con la condición de que Z no sea HSQGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-γ-Glu))-AAHDFVEWLLRA.

13. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes en la que el péptido de fórmula I tiene la secuencia:

HSQGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVEWLLRA;
 HSQGTFTSDYSKYLDKKAHDFVEWLLRA;
 HSQGTFTSDYSKYLDSKAAKDFVEWLLRA;
 HSQGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVEWLKRA;
 HSQGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVEWLLKA;
 HSQGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVEWLKSA;
 HSQGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVKWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVEWLLSA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAARDFVAWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAAKDFVAWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVEWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVEWLLKA
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAAKDFVAWLLSA
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVAWLLKA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDKKAHDFVAWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSRYLDSKAAHDFVEWLLSA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVKWLLSA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDK()KAAE()DFVEWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAAHDFVE()WLLK()A o
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSKAAK()DFVE()WLLRA;

Donde los residuos marcados con "(" participan en un enlace intramolecular.

14. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes que comprende un péptido de fórmula I que tiene la secuencia:

HSQGTFTSDYSKYLDS-K*-AAHDFVEWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K*-AAHDFVEWLLSA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K*-AARDFVAWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K*-AAHDFVEWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K*-AAHDFVEWLLKA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDK()K*AAE()DFVEWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSK*AAHDFVE()WLLK()A

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDSK*AAK()DFVE()WLLRA;

en la que los residuos marcados con "()" participan en un enlace intramolecular y "*" indica la posición de un sustituyente lipófilo.

15. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes en el que Z^1 comprende una cadena de hidrocarburo que tiene 10 a 24 átomos de C, 10 a 22 átomos de C o 10 a 20 átomos de C.
16. Un compuesto según la reivindicación 15 en el que Z^1 es un resto dodecanoilo, 2-butiloctanoilo, tetradecanoilo, hexadecanoilo, heptadecanoilo, octadecanoilo o eicosanoilo.
17. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes en el que Z^2 es o comprende uno o más residuos de aminoácidos.
18. Un compuesto según la reivindicación 17 en el que Z^2 es un residuo γ -Glu, Glu, β -Ala o ϵ -Lys, o un resto 3-aminopropanoilo, 4-aminobutanoilo, 8-aminooctanoilo u 8-amino-3,6-dioxaoctanoilo.
19. Un compuesto según la reivindicación 18 en el que el sustituyente lipófilo se selecciona del grupo que consiste en dodecanoil- γ -Glu, hexadecanoil- γ -Glu, hexadecanoil-Glu, hexadecanoil-[3-aminopropanoilo], hexadecanoil-[8-aminooctanoilo], hexadecanoil- ϵ -Lys, 2-butiloctanoil- γ -Glu, octadecanoil- γ -Glu y hexadecanoil-[4-aminobutanoilo].
20. Un compuesto según la reivindicación 19 en el que Z tiene la fórmula:
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil- γ -Glu)-AARDFVAWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLSA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLKA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVE()WLLK()A;
 HSQGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLRA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(dodecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLSA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-[3-aminopropanoilo])-AAHDFVEWLLSA;
 H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-[8-aminooctanoilo])-

AAHDFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil- ϵ -Lys)-AAHDFVEWLLSA;

HSQGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil)-AAHDFVEWLLSA;

HSQGTFTSDYSKYLDS-K(octadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLSA;

HSQGTFTSDYSKYLDS-K([2-butiloctanoil]- γ -Glu)-AAHDFVEWLLSA;

HSQGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-[4-aminobutanoil])-AAHDFVEWLLSA;

HSQGTFTSDYSKYLDS-K(octadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLSA;

HSQGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-E)-AAHDFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil)-AAHDFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(octadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K([2-butiloctanoil]- γ -Glu)-AAHDFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-[4-aminobutanoil])-

AAHDFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(octadecanoil- γ -Glu)-AAHDFVEWLLSA; o

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-E)-AAHDFVEWLLSA;

en la que los residuos marcados con "(" participan en un enlace intramolecular.

21. Un compuesto según la reivindicación 19 en el que Z tiene la fórmula:

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-isoLys)-AARDFVAWLLRA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-isoGlu)-AAKDFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDE-K(hexadecanoil-isoGlu)-AAHDFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-isoGlu)-AAHEFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-isoGlu)-AAEDFVEWLLSA;

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(hexadecanoil-isoGlu)-AAHDFVEWLLEA.

22. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde Z tienen la fórmula:

H-Aib-QGTFTSDYSKYLDS-K(Hexadecanoil- $\square$ -Glu)-AAHDFVEWLLSA.

23. Una composición que comprende un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 22, o una sal o derivado del mismo, en mezcla con un vehículo.

24. Una composición según la reivindicación 23 en la que la composición es una composición farmacéuticamente aceptable, y el vehículo es un vehículo farmacéuticamente aceptable.