

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 1216

Ref. Expediente N° NC2016/0005665

Por la cual se otorga una Patente de Invención

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 21 de diciembre de 2016, con el N° NC2016/0005665, por NOVARTIS AG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “ÁCIDOS GRASOS NOVEDOSOS Y SU USO EN LA CONJUGACIÓN CON BIOMOLÉCULAS”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2015/036328 del 18 de junio de 2015.

SEGUNDO: Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 786 el 10 de marzo de 2017, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 9165, notificado el 29 de agosto de 2019, se requirió al 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 el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2016/0005665 el 25 de noviembre de 2019, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 18 que reemplazan las originalmente presentadas. Posteriormente, mediante escrito radicado bajo el N° NC2019/0013479 el 28 de Noviembre de 2019, el solicitante presentó la reivindicaciones 1 a 18 para que sean tenidas en cuenta al momento de realizar el examen definitivo de la solicitud. Se acepta este último 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.”*

SEXTO: Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 18 incluidas en el radicado bajo el N° NC2019/0013479 el 28 de Noviembre de 2019, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a un conjugado que difiere del estado de la técnica más cercano, Hackett, *Journal of pharmaceutical sciences*¹, en que la biomolécula conjugada es un péptido o un polipéptido y el ácido graso es 2,2 dialquil malónico. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica

¹ Hackett, M. J., Joolakanti, S., Hartranft, M. E., Guley, P. C., & Cho, M. J. (2012). A dicarboxylic fatty acid derivative of paclitaxel for albumin-assisted drug delivery. *Journal of pharmaceutical sciences*, 101(9), 3292-3304.

Resolución N° 1216

Ref. Expediente N° NC2016/0005665

y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto de tener una mejor vida media. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 18 cumplen los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial establecidos en la normatividad citada en precedencia y este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2016/0005665 del 25 de noviembre de 2019, y teniendo en cuenta el objeto concedido, se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: “ÁCIDO 2,2-DIALQUIL MALÓNICO EN LA CONJUGACIÓN DE PEPTIDOS”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE

ARTÍCULO PRIMERO: Otorgar patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación titulada:

“ÁCIDO 2,2-DIALQUIL MALÓNICO EN LA CONJUGACIÓN DE PEPTIDOS”

Clasificación IPC: A61K 47/48, A61P 3/00, C07K 14/475

Reivindicaciones: 1 a 18 incluidas en el radicado bajo el N° NC2019/0013479 el 28 de Noviembre de 2019, de acuerdo con el anexo 1.

Titular: NOVARTIS AG

Domicilio: Lichtstrasse 35, CH-4056 Basel, BASEL BASEL, SUIZA.

Inventores: Aimee Richardson USERA, Changgang LOU, Louise Clare KIRMAN, Frederic ZECRI, Jun YUAN, Ken YAMADA, Alexandra Marshall BRUCE, Avirup BOSE, David Weninger BARNES, Aaron KANTER, Chikwendu IBEUNJO, Alokesh DUTTARROY

Prioridades N° 23/06/2014, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/015,862.
20/11/2014, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/082,327.
23/01/2015, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/107,016.

Solicitud internacional N°: PCT/US2015/036328

Fecha: 18 de junio de 2015.

Vigente desde: 18 de junio de 2015.

Hasta: 18 de junio de 2035.

ARTÍCULO SEGUNDO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y en las demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.



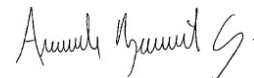
Resolución N° 1216

Ref. Expediente N° NC2016/0005665

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a NOVARTIS AG, advirtiéndole que contra ella 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 diez (10) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 23 de enero de 2020



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente
por: ANDRÉS
BERNARDO BARRETO
GONZÁLEZ
Fecha: 2020.01.23
17:00:48 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.

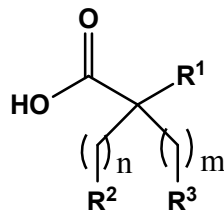
Resolución N° 1216

Ref. Expediente N° NC2016/0005665

ANEXO 1

REIVINDICACIONES CONCEDIDAS

1. Un conjugado, que comprende una biomolécula enlazada a un ácido graso por medio de un enlazador, en donde el ácido graso tiene la siguiente fórmula A1:



A1

R¹ es CO₂H;

R² y R³ son independientemente unos de otros, H, OH, CO₂H, -CH=CH₂ o -C≡CH;

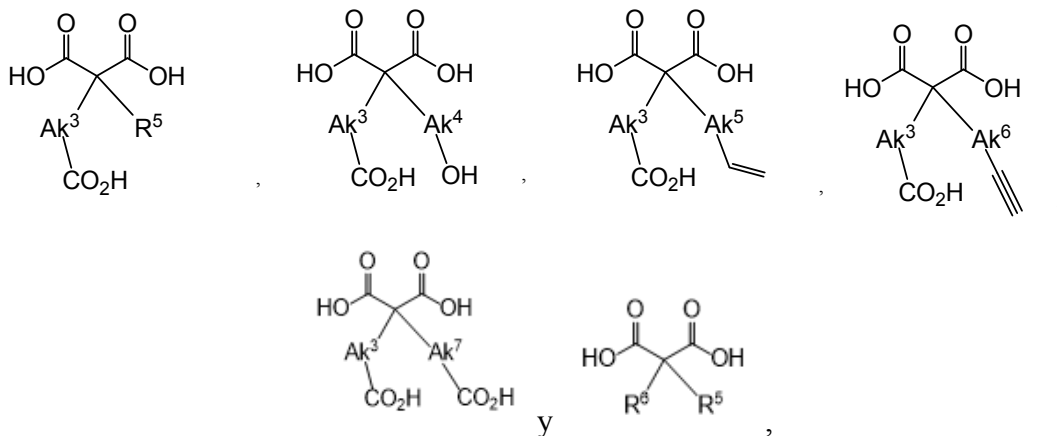
n y m son independientemente unos de otros, un entero de entre 6 y 30;

en donde la biomolécula es un péptido o un polipéptido; y

en donde el enlazador comprende alquilo, alqueniilo, cicloalquilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, polietilenglicol, uno o más aminoácidos naturales o no naturales, o combinación de los mismos, en donde cada uno de alquilo, alqueniilo, cicloalquilo, arilo, heteroarilo, heterociclilo, polietilenglicol o los aminoácidos naturales o no naturales opcionalmente se combinan y se enlazan entre sí, o se enlazan a la biomolécula o a la fracción de ácido graso por medio de un grupo químico seleccionado a partir de -C(O)O-, -OC(O)-, -NHC(O)-, -C(O)NH-, -O-, -NH-, -S-, -C(O)-, -OC(O)NH, -NHC(O)-O-, =NH-O-, =NH-NH- o =NH-N-(alquil)-;

o una amida, éster o sal farmacéuticamente aceptable de los mismos.

2. Un conjugado de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde el ácido graso se selecciona a partir de:



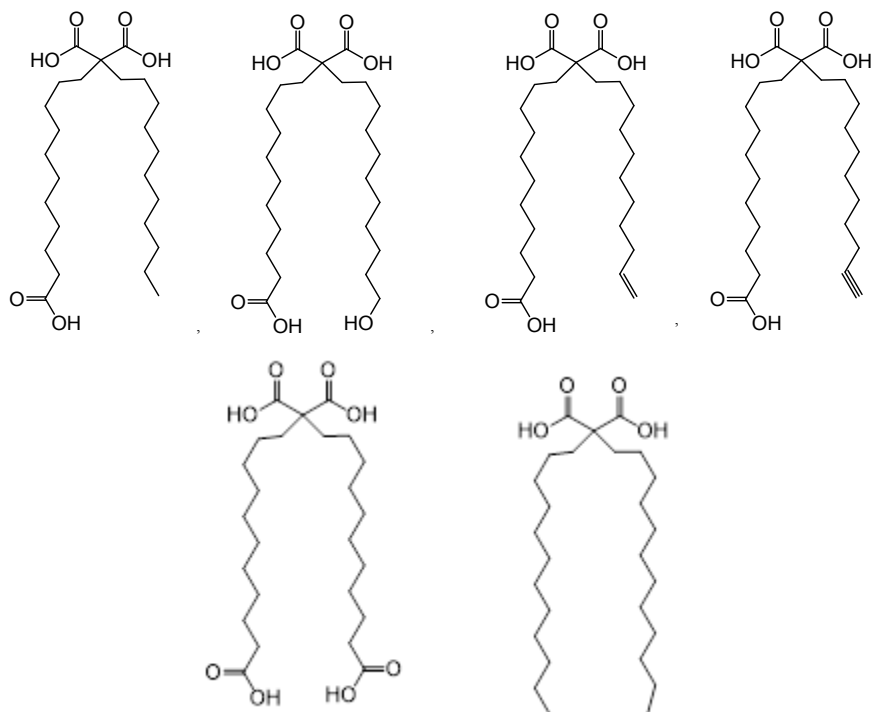
en donde Ak³, Ak⁴, Ak⁵, Ak⁶ y Ak⁷ son independientemente un alquilenos (C₈₋₂₀) lineal, R⁵ y R⁶ son independientemente alquilo (C₈₋₂₀) lineal, o una amida, un éster o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos.

3. Un conjugado de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde el ácido graso se selecciona a partir de:



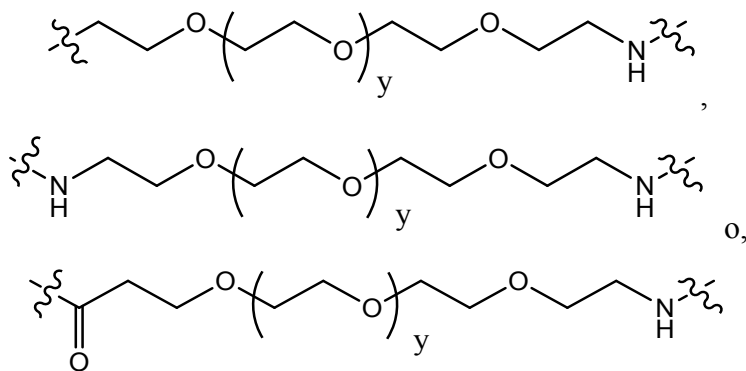
Resolución N° 1216

Ref. Expediente N° NC2016/0005665



y
o una amida, éster o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos.

4. Un conjugado de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, en donde el enlazador comprende una fracción de oligo-etilenglicol no ramificada de la fórmula:

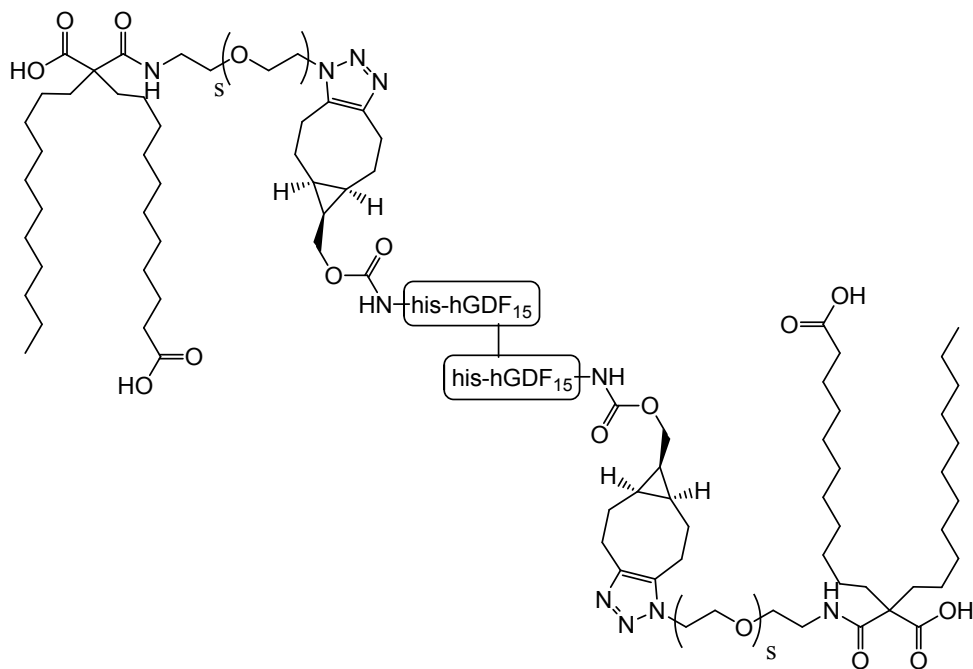


en donde y es de 0 a 34; o una amida, un éster o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

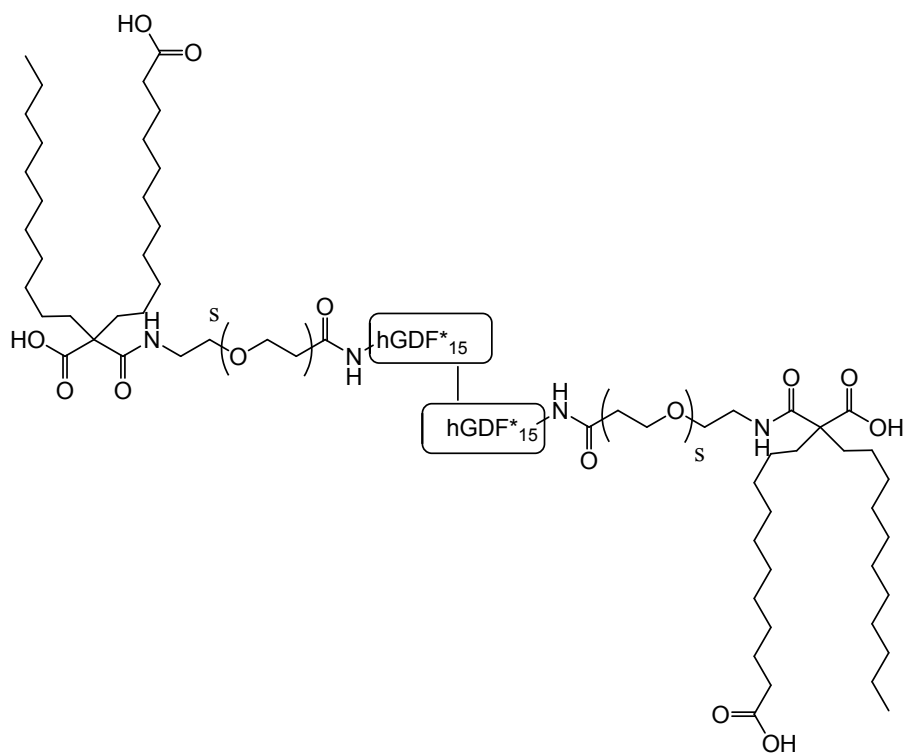
5. Un conjugado de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 4, en donde el enlazador comprende una fracción heterocíclica de la siguiente fórmula:

Resolución N° 1216

Ref. Expediente N° NC2016/0005665



FÓRMULA C;



FÓRMULA D;

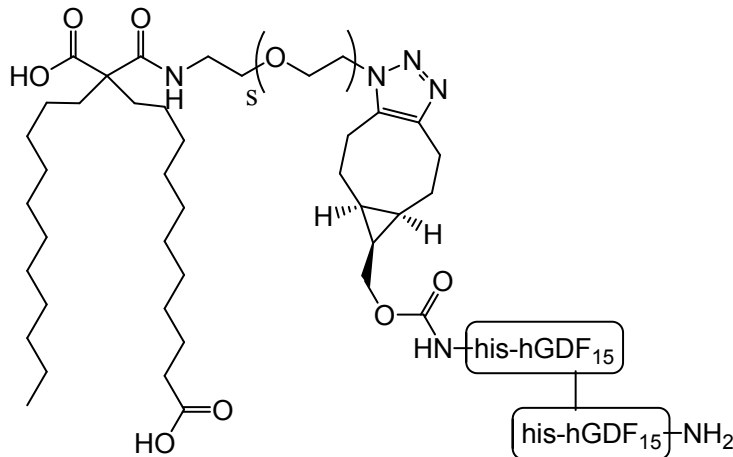
en donde, en las Fórmulas C y D, ambas unidades monoméricas de his-hGDF15 o de hGDF15* están enlazadas a la fracción de ácido graso por medio de un enlazador en el término-N;

o

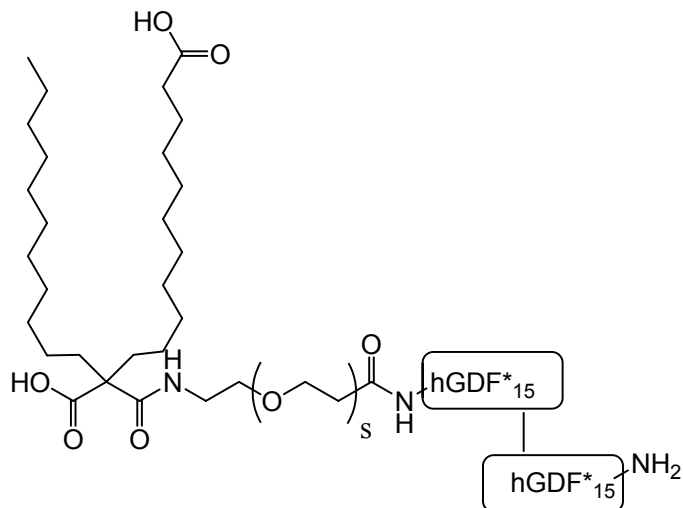


Resolución N° 1216

Ref. Expediente N° NC2016/0005665



FÓRMULA E;



FÓRMULA F;

en donde, en las Fórmulas E y F, solamente una de las unidades monoméricas de his-hGDF15 o de hGDF15* se enlaza a la fracción de ácido graso por medio de un enlazador en el extremo N-terminal; y

en donde hGDF15* es hGDF15, en donde los 2 o 3 aminoácidos en el extremo N-terminal han sido reemplazados con una secuencia de aminoácidos XH- o XHX'- respectivamente,

en donde H es histidina, y X y X' se seleccionan independientemente a partir de M y A; y

en donde his-hGDF15 es hGDF15, en donde se ha agregado una marca que comprende de 1 a 6 aminoácidos de histidina y opcionalmente 1 o 2 aminoácidos de metionina, en el extremo N-terminal de hGDF15; y s es un entero de entre 20 y 30; y

en donde la línea entre las 2 unidades monoméricas de his-hDGDF15 o las 2 unidades monoméricas de hGDF15* representa un enlace de disulfuro.

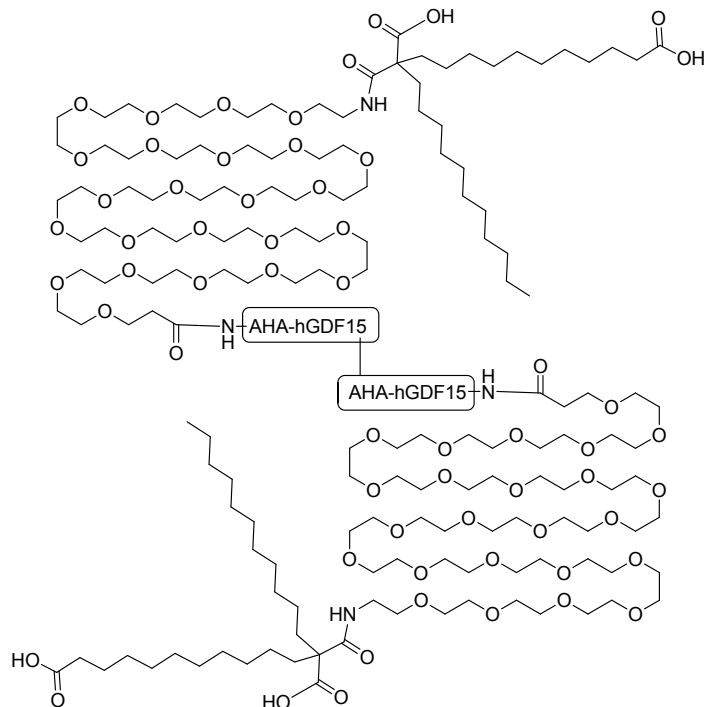
11. Un conjugado de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde la biomolécula es MH(199-308)hGDF15, MHA(200-308)hGDF15, AHA(200-308)hGDF15, AH(199-308)GDF15, MHHHHHHM-hGDF15 o MHHHHHHH-hGDF15; o un dímero del mismo.

12. Un conjugado de acuerdo con la Reivindicación 10 o 11, en donde la biomolécula enlazada

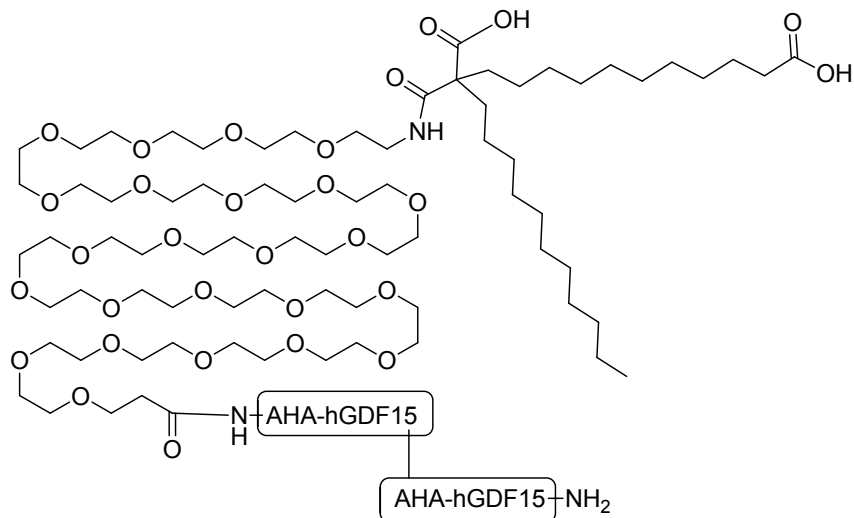
Resolución N° 1216

Ref. Expediente N° NC2016/0005665

a un ácido graso por medio de un enlazador es de la fórmula G o de la fórmula H:



FÓRMULA G;



FÓRMULA H;

en donde AHA-hGDF15 es la SEQ ID NO: 7, y el ácido graso se enlaza por medio de un enlazador en el extremo N-terminal de una o dos unidades monoméricas, y en donde la línea entre las dos unidades de AHA-hGDF15 representa un enlace de disulfuro.

13. Una mezcla que comprende el conjugado de acuerdo con la Reivindicación 12, en donde la mezcla es una proporción molar de 1:1 de un conjugado de Fórmula G y un conjugado de Fórmula H.
14. Un conjugado de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 12, en donde el



Resolución N° 1216

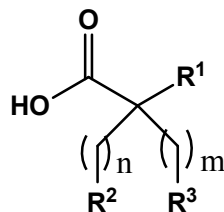
Ref. Expediente N° NC2016/0005665

conjugado tiene una estabilidad de vida media en plasma de más de 10 horas, de más de 20 horas, o de más de 30 horas.

15. Un conjugado de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 12, en donde la mejora en la estabilidad en plasma comparándose con la biomolécula no conjugada es de 2 veces, 5 veces, 10 veces, 20 veces, 30 veces, 40 veces, 50 veces o 75 veces.

16. Una composición farmacéutica, la cual comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un conjugado de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 12; o una mezcla de conjugados de acuerdo con la Reivindicación 13, o una amida, un éster o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y uno o más vehículos farmacéuticamente aceptables.

17. Un compuesto de la Fórmula:



A1

R¹ es CO₂H;

R² y R³ son independientemente uno del otro, H, OH, CO₂H, -CH=CH₂ o -C≡CH; con la condición de que R² y R³ no son idénticos;

n y m son independientemente uno del otro, un entero de entre 6 y 30;

o una amida, éster o sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

18. Un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 17, seleccionado a partir del grupo que consiste en:

