




Patentabilidad de los extractos vegetales



José Pardo Zapata
Los Lunes del Centro de Patentes
Mayo de 2002



¿Qué es un extracto?

- Mezcla compleja, con multitud de compuestos químicos, obtenible por procesos físicos, químicos y/o microbiológicos a partir de una fuente natural y utilizable en cualquier campo de la tecnología.

Importancia de los extractos vegetales

- Según la OMS el 25% de los fármacos comercializados actualmente son de origen vegetal y un 25% contiene principios vegetales modificados químicamente.

Importancia de los extractos vegetales

- El número de sustancias químicas sintetizadas en el laboratorio que se pueden utilizar por su toxicidad o efectos secundarios aumenta constantemente, por lo tanto en la naturaleza se pueden obtener nuevas estructuras, con actividad terapéutica.

Fuentes y usos de los extractos

- Mineral
 - Energético: petróleo, uranio..
 - Construcción: mármoles, asfaltos
 - Siderurgia: acero

Fuentes y usos de los extractos

- Animal
 - Alimentario
 - Farmacéutico
 - Ganadero
 - Fertilizantes

-
-
-

Fuentes y usos de los extractos

- Microbiológico
- Farmacéutico
- Alimentario

Fuentes y usos de los extractos

- Vegetal
 - Energético
 - Alimentario
 - Farmacéutico
 - Cosmético

Procesos de obtención

- Extracción y purificación:
- Extracción , percolación, filtración, diálisis, precipitación, cromatografía, destilación, secado, molienta.....

Extractos vegetales con uso farmacéutico

- El tema de estudio se puede aplicar a todos los campos tecnológicos.
- En este caso particular nos referimos a extractos obtenibles a partir a una planta con actividad farmacológica.

Extracto vs Síntesis

Extracto

Se le supone actividad

Fácil de extraer

Difícil de identificar

Menor protección

Síntesis

No se asegura la actividad

Difícil sintetizar

Fácil de identificar

Mayor protección

D

DEFINICIÓN DE EXTRACTO

- Mezcla de compleja de compuestos con actividad farmacológica, compuesta por un principio activo (con la supuesta actividad) dentro de una matriz, en principio, sin actividad terapéutica.

Problemas del extracto

- Los principios activos pueden ser diferentes compuestos, con estructuras químicas casi idénticas.
- El extracto puede tener una actividad mayor que el principio activo aislado y purificado.
- La matriz del extracto puede tener efectos técnicos inesperados: mayor estabilidad, mayor actividad, mayor tolerancia.

Problemas del extracto

- El principio extracto es difícil de identificar, aislar, cuantificar.
- El principio activo es un componente de la planta ó se ha formado un artefacto durante el proceso de extracción purificación.

• • • Cómo se caracterizan los extractos

- Situación óptima:
- Enumerar de una forma clara e inequívoca de todos los componentes del extracto e indicando si su presencia es indispensable para la realización del fin con el que se desarrollado el producto.
- Pero para analizar algo y que saber de que se trata ese algo.

• • • Cómo se caracterizan los extractos

- Ante las autoridades sanitarias para la comercialización del extracto es necesario que sea:
 - Eficacia estando la actividad en el extracto
 - Seguro, sin efectos secundarios
 - Calidad:
 - Identificación: Huella cromatográfica
 - Cuantificación en un marcador
 - Estabilidad

Cómo reivindicar los extractos

- Si se reivindica la huella cromatográfica (reivindicación paramétrica) y esta huella no corresponde al principio activo, la fabricación de un extracto sin la huella cromatográfica queda fuera del alcance de la invención.

• • • Cómo reivindicar los extractos

- Si el principio activo no está descrito en el CA, no proteger el extracto, proteger el compuesto explícitamente

Cómo reivindicar los extractos

- Principio activo: conocido y actividad
- Si se reivindica la presencia del principio activo = falta actividad inventiva
- Si el extracto posee mayor actividad, cómo hay que proteger o se puede proteger el extracto, si no se conocen todos los componentes.

Cómo reivindicar los extractos

- Producto obtenible por un proceso
- Equivalentes (cambio de disolvente: alcohol/Acetonitrilo; procesos alternativos: filtración/centrifugación; evaporación/liofilización..)

Cómo reivindicar los extractos

- WO/99/64027
- Proceso para la preparación de extractos de *Hypericum perforatum* que comprende:
 - a) extracción con alcohol o acetona
 - b) filtración y concentración
 - c) dilución del concentrado b) con agua o mezclas de alcohol/agua
 - d) extracción de la mezcla acuosa c) con ésteres alifáticos
 - e) filtración y evaporación a sequedad de los extractos de éster.
 - F) solubilización en una solución de un ácido orgánico en etanol acuoso y evaporación del disolvente a menos de 40°C.

Cómo reivindicar los extractos

- WO/99/64027 imaginaria
- Proceso para la preparación de extractos de *Hypericum perforatum* que comprende:
 - a) extracción con acetonitrilo
 - b) centrifugación
 - c) dilución del concentrado b) con agua o mezclas de alcohol/agua, en medio ácido
 - d) extracción de la mezcla acuosa c) con cloroformo
 - e) precipitación
 - F) solubilización en una solución de una sal del ácido orgánico en metanol acuoso y liofilización del disolvente a menos de 40°C.

Cómo reivindicar los extractos

- La reivindicación imaginaria anterior posiblemente tendrá la misma actividad farmacológica, ¿pero se infringe la reivindicación? ¡Equivalentes de nuevo!
- En caso de duda, es posible introducir un paso adicional con una ventaja adicional:
- Secado; mayor rendimiento

Cómo reivindicar los extractos

- Estaría permitido utilizar “medios para” o generalizar las reivindicaciones.
- Reivindicación quedaría:
 - a) extracción con disolvente adecuado (constante dieléctrica entre X e Y
 - b) separación
 - c) dilución con disolvente con una dieléctrica entre X e Y
 - d) extracción con un disolvente inmiscible en agua

Cómo reivindicar los extractos

- ES 2118686 T1 (oposición)
- Extracto estable de *Hypericum perforatum* con un contenido en Hyperforina al menos del 2%, caracterizado porque la Hyperforina es estable contra la descomposición o se estabiliza con un estabilizador
- Reivindicaciones dependientes describen los estabilizadores.

Cómo reivindicar los extractos

- ¿Protege la reivindicación los extractos de Hypericum que contienen hypercinas, que también poseen actividad farmacológica y también son inestables?

Alcance de las reivindicaciones

- G 1/92 Headnote:
- La composición química de un producto forma parte del estado de técnica tal cual es accesible al público y puede ser analizado y reproducido por un experto, sea cual sea la razón para analizarlo.

Alcance de las reivindicaciones

- T 301/94 Green glass/AVIR
- El experto podía haber analizado con los métodos disponibles en la fecha de prioridad el contenido de las botellas en sulfuros sin duda alguna, incluso si no hubiera sido conocido que el vidrio con alta absorción de UV contiene sulfuros.

Alcance de las reivindicaciones

- Según G1/92 confirmada con T 301/94, un extracto puede proteger los componentes activos que se descubran posteriormente y de los que no se conocía su actividad farmacológica en la fecha de prioridad. Siempre y cuando este principio activo esté descrito en el estado de la técnica.

Estado de la técnica

- Los extractos no están indexados en CA
- Composición difícil de elucidar
- Búsqueda por nombre de la planta
- Búsqueda en libros de medicina tradicional

Medicina popular

- Ger Offen 2406452 Appl P2406456.6 11
Feb 1974
- Un ungüento preparado por extracción de de 5 gramos de hojas frescas de *Hypericum* con 100 g de aceite de oliva durante 10 días a 20°C, 25 g de cera de abeja y 45 g de sebo de carnero, cocción y filtración. Su uso como cicatrizante y en las quemaduras.....

Medicina popular

- Discórides:
- Preparafe con las flores del legitimo Hyperico vn azeite admirable para foldar las heridas frefcas y rectificar aquellas de la cabeza y guardarlas de corrupcion. Demas defto, tiene gran facultad de confrontar los nervios debilitados y fanar las quemaduras de fuego

Cómo definir la materia prima

Variedad	Procedencia	% p activo
Silvestre	Cáceres	5.8
Silvestre	Almería	9.5
Silvestre	Murcia	8.3
Silvestre	Córdoba	7.4
Cultivada	Murcia	3.5
Cultivada	Murcia	3.6

• • • Cómo definir la materia prima

- Qué se define: Género, especie, variedad..
- Se debe indicar el lugar de recolección
- Se debe indicar la época de recolección
- Es posible que los efectos técnicos (mayor actividad) sea debido a la materia prima utilizada y no los medios.

Como definir la materia prima

- Con el propósito de evitar problemas, sería aconsejable el depósito del material biológico.
- La Ley 10/2002, ya lo detalla:
- Cuando una invención tenga por objeto una materia biológica de origen vegetal...deberá incluir el lugar geográfico de recolección

Convenio Biodiversidad de Río

- Objetivos:
- Conservación de diversidad biológica
- Uso sostenible de sus componentes
- Participación justa de los beneficios que se deriven de los recursos genéticos

Convenio de Biodiversidad de Río

- ¿ Podría ser nula una patente que utiliza una fuente natural y el propietario no respeta el convenio de Biodiversidad , por atentar el orden público y las buenas costumbres?

Conclusiones

- Importancia de los extractos como fuentes de fármacos
- Ilustrar la invención con el máximo número de variantes de obtención e identificación
- Si el principio activo está descrito comprobar y especificar que el extracto tiene mayor actividad que el principio activo

Conclusiones

- Reivindicar el extracto mediante proceso de obtención.
- Introducir reivindicaciones dependientes con parámetros de identificación (componentes identificados)
- Si el principio activo no está descrito, reivindicar el principio activo

Conclusiones

- Poner en la memoria, todos las operaciones obvias para la extracción: secado, triturado, desengrado, que puedan optimizar el rendimiento; pero no reivindicarlas
- Buscar el estado de la técnica la literatura etnobotánica.
- Buscar en Patentes chinas para comercializar nuevos extractos (si no hay equivalente en ES)