

Commentaires des examinateurs - Épreuve A 2016 (Chimie)

Traduction du texte original anglais

1. Généralités

L'invention décrite dans la lettre du client porte sur des nanoparticules biodégradables de 2-cyanoacrylate de polyalkyle (PACA) piégeant des peptides biopharmaceutiques tels que des peptides métaboliques, en particulier l'insuline.

La lettre du client aborde clairement le problème de l'administration de l'insuline par voie orale dans le traitement du diabète ([001]).

Ce problème comporte deux aspects, celui de la préservation de l'intégrité de l'insuline et de sa bioactivité lors de son passage à travers l'estomac, et celui d'améliorer l'absorption intestinale pour atteindre un effet thérapeutique efficace, à savoir abaisser les taux de glucose dans le sang pendant une période prolongée après l'administration par voie orale ([008], [017]). Ceci est important pour la conception des formes posologiques pharmaceutiques pour une administration par voie orale dans le traitement du diabète.

2. Contribution et portée des revendications

La lettre du client décrit la préparation de nanoparticules de PACA chargées d'insuline ([027]).

Dans la figure 1 de la lettre du client, il est montré que les compositions B, E, J, L et N obtiennent diverses réductions, par rapport au contrôle, des niveaux de glucose dans le sang après administration par voie orale. Ces réductions sont maintenues sur une période de temps prolongée. Il est souligné que la durée prolongée de cet effet indique une meilleure absorption de l'insuline dans l'intestin grêle, ce qui est avantageux pour maintenir des taux d'insuline physiologiques ([030]), et par conséquent pour le traitement du diabète, comme le diabète de type 2 ([034]).

Les documents D1 et D2 divulguent tous deux des nanoparticules de PACA chargées d'insuline.

D1 décrit des nanoparticules de PACA préparées par polymérisation de 2-cyanoacrylate d'isobutyle capables de piéger et de transporter de l'insuline pour une absorption intestinale par voie orale pour le traitement du diabète de type 2. D1 indique implicitement l'aptitude d'autres 2-cyanoacrylates d'alkyle en indiquant que "le taux de biodégradation des cyanoacrylates d'alkyle (PACA) dépend de la longueur de la chaîne alkyle." Dans D1, les nanoparticules de PACA sont fabriquées par polymérisation interfaciale.

La lettre du client mentionne la polymérisation interfaciale ([020]), mais ne décrit qu'un procédé pour la préparation de nanoparticules de PACA par polymérisation anionique ([021] - [026] et exemples).

D2 décrit des nanoparticules de PACA chargées d'insuline obtenues par polymérisation anionique de 2-cyanoacrylate d'éthyle et de 2-cyanoacrylate de n-butyle.

Alors que des nanoparticules de PACA préparées par polymérisation de 2-cyanoacrylates d'alkyle autres que le 2-cyanoacrylate d'isobutyle, le 2-cyanoacrylate d'éthyle et le 2-cyanoacrylate de n-butyle seraient nouvelles par rapport à D1 et D2, la lettre du client indique clairement que des 2-cyanoacrylates d'alkyle à courte chaîne, tels que les alkyles C₆ ou inférieurs, sont préférés en raison des taux de dégradation du polymère ([018]). Une revendication portant sur des nanoparticules PACA ne couvrant pas les polymères de 2-cyanoacrylates d'alkyle ayant un groupe alkyle C₆ ou inférieur irait à l'encontre des instructions explicites du client.

Dans D2, la question des propriétés de libération des nanoparticules de PACA piégeant divers peptides bioactifs, y compris l'insuline, est abordée. Il est divulgué que la formation de liaisons covalentes peptide-polymère peut avoir pour conséquence qu'une grande quantité de peptides encapsulés dans les nanoparticules ne se libèrent pas, effet indésirable compromettant la bioactivité et l'efficacité thérapeutique des nanoparticules de PACA.

Pour l'insuline, cependant, aucune interaction peptide-polymère covalente n'est signalée, et il est expliqué que l'insuline n'interfère pas avec la réaction de polymérisation à un pH égal à 5. Des résultats très différents sont obtenus lorsque la réaction de polymérisation est effectuée à un pH de 1,9. Dans ce cas, les nanoparticules de PACA sont instables et ont une trop faible charge d'insuline ([007] de D2).

Au vu de D2, les candidats devaient se rendre compte que les nanoparticules chargées d'insuline de 2-cyanoacrylate de polyéthyle et de 2-cyanoacrylate de poly-n-butyle préparées à pH de 5 détruisaient la nouveauté des compositions A et B de l'exemple 1 de la lettre du client. Les nanoparticules instables préparées à un pH de 1,9 détruisaient la nouveauté des compositions I et K de l'exemple 3 de la lettre du client.

La lettre du client met en évidence les résultats inattendus observés pour l'encapsulation de l'insuline lorsque la polymérisation anionique est effectuée à un pH de 2 ou moins. Dans ces conditions, un complexe non covalent d'insuline et de PACA se forme lors de la réaction de polymérisation et est ensuite piégé dans les nanoparticules de PACA ([028], [029]). Ces nanoparticules présentent l'avantage surprenant de libérer l'insuline lentement sur une période prolongée et améliorent l'absorption intestinale de l'insuline. Il en résulte des concentrations d'insuline thérapeutiquement efficaces dans le sang pendant de longues périodes ([030]).

Toutefois, la stabilisation de surface des nanoparticules de PACA au moyen d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable, tel que le dextrane, le chitosane ou la pectine, est requise afin d'obtenir un chargement d'insuline suffisant ([031], [032]).

Il est souligné dans la lettre du client que la stabilisation efficace des nanoparticules dépend également de la longueur de la chaîne alkyle des monomères 2-cyanoacrylate d'alkyle ([032]). Dans l'exemple 3 (tableau 3), on montre que les nanoparticules de PACA préparées à partir de 2-cyanoacrylate de 2-octyle ne peuvent pas être efficacement stabilisées à l'aide d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable ([042]) et présentent une trop faible charge d'insuline.

Ainsi, il devait être clair pour les candidats que les preuves fournies par le client suggèrent une nouvelle contribution technique liée à la possibilité de maintenir une réduction pharmacologiquement efficace des niveaux de glucose dans le sang sur une période prolongée, à savoir au moins 12 heures après l'administration orale (figure 1, compositions J, L, N).

La lettre du client n'identifie pas la nature chimique du complexe non covalent avec davantage de précision, et les candidats ne devaient pas essayer de définir dans leurs réponses le complexe non covalent plus précisément que la lettre du client ne le permet. Il suffisait de se rendre compte qu'un complexe non covalent de l'insuline avec le PACA n'est divulgué ni dans D1 ni dans D2.

3. Revendications indépendantes

Un total de **70 points** pouvait être obtenu pour une revendication indépendante.

Les candidats étaient censés proposer des revendications indépendantes portant sur :

- a) Des nanoparticules biodégradables de PACA chargées d'insuline piégeant l'insuline sous la forme d'un complexe non covalent avec le PACA et comprenant un stabilisant pharmaceutiquement acceptable.

- b) Un procédé de préparation par polymérisation anionique de nanoparticules biodégradables de PACA chargées d'insuline, conformément au paragraphe [021] de la lettre du client, préparation effectuée à un pH de 2 ou moins en présence d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable.

- c) Une forme posologique orale pharmaceutique comprenant les nanoparticules biodégradables de PACA chargées d'insuline.

- d) Des nanoparticules de PACA biodégradables chargées d'insuline, ou une forme posologique orale pharmaceutique comprenant des nanoparticules, pour une utilisation en tant que médicament, ou plus spécifiquement pour une utilisation dans un procédé de traitement d'une maladie métabolique telle que le diabète.

Les catégories des revendications a), b) et c) sont clairement requises par les instructions du client ([014]) afin de protéger tous les aspects de sa technologie. D1 contient des exemples de formulation des revendications devant donner aux candidats une idée des catégories et des types de revendications attendues. Il est souligné que les candidats étaient encouragés à rechercher des indices dans toute l'épreuve, y compris dans l'art antérieur, et non pas seulement dans la lettre du client.

3.1. Revendication de produit (nanoparticules)

Un maximum de **32 points** était à gagner pour une revendication de produit indépendante. La revendication peut s'énoncer comme suit :

Nanoparticules biodégradables de 2-cyanoacrylate de polyalkyle (PACA) comprenant un (homo)polymère d'un 2-cyanoacrylate d'alkyle C2 à C6, d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable (choisi parmi le dextrane, le chitosane ou la pectine), et de l'insuline (ou un analogue synthétique de l'insuline) piégée, l'insuline étant sous forme d'un complexe non covalent avec le PACA et les nanoparticules ayant un diamètre hydrodynamique de 10 nm à 300 nm mesuré par diffusion dynamique de la lumière.

Une revendication de produit indépendante définissant les nanoparticules de PACA chargées d'insuline par un procédé d'obtention est également possible, car il s'agit du procédé de fabrication par polymérisation anionique à un pH de 2 ou moins en présence d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable qui confère aux nanoparticules leurs propriétés inventives.

Toutefois, la jurisprudence constante suggère qu'une revendication de produit caractérisé par son procédé d'obtention n'est acceptable que quand il est impossible de définir le produit revendiqué autrement qu'en termes d'un procédé de fabrication (Jurisprudence des chambres de recours de l'OEB, 7ème édition 2013, II.A.7.3). Les candidats devaient être au courant de ces dispositions. Dans le présent document, il est possible de définir les nanoparticules de PACA en utilisant uniquement les caractéristiques de produits structurelles, à savoir "nanoparticules de PACA piégeant l'insuline sous la forme d'un complexe non covalent" ([030]). Ainsi, une revendication de produit caractérisé par son procédé d'obtention rapportait au plus 22 points seulement sur les 32 points disponibles.

Le jeu de revendications doit satisfaire aux exigences de la règle 43(2) CBE. Si le jeu de revendications contient plus d'une revendication de produit indépendante portant sur des nanoparticules de PACA chargées d'insuline, seule la moins bonne revendication récoltait des points.

Une revendication manquant de nouveauté par rapport à D1 et/ou D2 ne rapportait aucun point.

Des nanoparticules de 2-cyanoacrylate de polyisobutyle chargées d'insuline préparées par polymérisation interfaciale, comme divulguées dans D1, ainsi que des nanoparticules de 2-cyanoacrylate de polyéthyle chargées d'insuline et des nanoparticules de 2-cyanoacrylate de poly-n-butyle obtenues par polymérisation anionique à un pH de 5, comme décrit dans D2, comprennent de l'insuline sous forme libre ([028]). Selon la lettre du client, un complexe non covalent d'insuline avec le PACA ne se forme durant la polymérisation anionique qu'à un pH de 2 ou moins ([029]). Par conséquent, la caractéristique "complexe non covalent" est nécessaire pour établir la nouveauté par rapport à D1.

Les nanoparticules instables de 2-cyanoacrylate de polyéthyle et de 2-cyanoacrylate de poly-n-butyle divulguées dans D2 ont une forme irrégulière et une charge d'insuline faible. Elles sont obtenues à un pH de 1,9 et comprennent un complexe non covalent d'insuline avec le PACA. La formation d'un complexe insuline-PACA non covalent est inhérente à la méthode de polymérisation anionique à un pH de 2 ou moins ([028], [029], [031]), peu importe que les nanoparticules soient stables ou ne le soient pas. Par conséquent, la caractéristique "stabilisant pharmaceutiquement acceptable" est nécessaire pour établir la nouveauté par rapport à D2.

La caractéristique "stabilisant pharmaceutiquement acceptable" à elle seule établit la nouveauté par rapport à D2, mais non par rapport à D1, qui divulgue aussi l'incorporation d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable dans les nanoparticules ([006] of D1).

Toute tentative d'établir la nouveauté par rapport à D1 et D2 seulement en excluant les nanoparticules de PACA préparées à partir du 2-cyanoacrylate d'isobutyle, du 2-cyanoacrylate d'éthyle et du 2-cyanoacrylate de n-butyle, par exemple en se limitant aux monomères 2-cyanoacrylate d'alkyle C₆ ou supérieurs, est vouée à l'échec. Une telle revendication indûment restreinte ayant une nouveauté purement formelle ne couvrirait que des alternatives triviales et des modes de réalisation qui ne fonctionnent pas, tout en excluant simultanément les nanoparticules de PACA préférées du client, lesquelles comprennent du 2-cyanoacrylate d'éthyle et du 2-cyanoacrylate de n-butyle ([018]). Une telle revendication ne rapportait aucun point.

Les candidats devaient revendiquer un objet nouveau fournissant également une solution crédible au problème technique formulable sur la base des preuves fournies dans la lettre du client. Cela est mis en évidence par le souhait du client d'éviter tout retard dans l'examen, à savoir d'éviter toute objection pour absence d'activité inventive de la part de la division d'examen. Ceci définit les limites de l'objet qui doit être revendiqué pour faire gagner le maximum de points.

Bien que la lettre du client se réfère en plusieurs endroits aux produits biopharmaceutiques peptidiques en général, et plus particulièrement aux peptides métaboliques, il devait apparaître clairement aux candidats que la seule divulgation suffisante fournie par les inventeurs portait sur la préparation de nanoparticules de PACA chargées d'insuline.

Les informations de la lettre du client ne rendent pas plausible que l'effet technique qui sous-tend l'invention, à savoir la fourniture d'une absorption intestinale prolongée d'insuline pour maintenir une action pharmacologique sur au moins 12 heures après l'administration par voie orale, puisse être extrapolé à d'autres peptides métaboliques. Bien au contraire. La lettre du client explique que la formation d'un complexe non covalent d'insuline avec le PACA en fonction du pH est liée aux propriétés physico-chimiques de l'insuline ([029]). La lettre du client ne fournit aucune base pour supposer des propriétés physico-chimiques spécifiques aux peptides métaboliques autres que l'insuline, et elle ne fournit aucun exemple spécifique de peptides métaboliques autres que l'insuline.

En outre, D2 devait décourager les candidats de concevoir des hypothèses non fondées à cet égard, car il identifie clairement un comportement physico-chimique différent en ce qui concerne la sécrétine (un des peptides métaboliques mentionnés dans la lettre du client) piégée dans des nanoparticules de PACA, avec formation de liaisons peptide-polymère covalentes (indépendamment du pH), ce qui entrave la libération du peptide, la bioactivité et l'efficacité thérapeutique ([005] de D2). Seuls les analogues synthétiques de l'insuline se comportent comme l'insuline, et le terme "insuline" utilisé dans la lettre du client les englobe effectivement ([013]).

Ainsi, les candidats devaient considérer les affirmations de la lettre du client relative à d'autres peptides métaboliques que l'insuline comme de simples spéculations. Une revendication trop large portant sur des nanoparticules de PACA piégeant des "peptides métaboliques" basée uniquement sur des hypothèses spéculatives dénuées de fondement faisait perdre 15 points.

Des nanoparticules de PACA préparées par polymérisation anionique de 2-cyanoacrylates d'alkyle C₈ ou supérieurs à un pH de 2 ou moins sont clairement considérées dans la lettre du client comme des modes de réalisation qui ne fonctionnent pas, puisqu'une stabilisation efficace des nanoparticules n'est pas possible (tableau 3, [042]). Par conséquent, les revendications attendues devaient être limitées de sorte à ne pas englober les alkyles C₈ ou supérieurs (il fallait donc définir la plage "alkyle C₂-C₆" ou "alkyle C₆ ou inférieur" ([015], [018])). 10 points étaient perdus si une revendication comprenait les alkyles C₈ ou supérieurs.

Le dextrane est le stabilisant pharmaceutiquement acceptable utilisé dans les exemples, mais la lettre du client indique clairement qu'au moins le chitosane et la pectine peuvent également être utilisés à cet effet avec des résultats aussi satisfaisants que ceux obtenus par le dextrane ([032]). Une restriction induite au dextrane faisait perdre 10 points.

La lettre du client établit clairement que seuls les nanoparticules de PACA ayant un diamètre hydrodynamique de 300 nm ou moins, tel que mesuré par diffusion dynamique de la lumière, conviennent pour l'absorption intestinale ([016]), ce qui est essentiel pour résoudre le problème technique sous-jacent consistant à libérer de l'insuline sur une période prolongée après administration orale. Par conséquent, les candidats devaient définir la plage "10 nm à 300 nm" à partir des valeurs fournies dans la lettre du client. Si cette caractéristique essentielle manquait, ou si la plage plus large "10 nm à 500 nm" couvrant des modes de réalisation qui ne fonctionnent pas était revendiquée, soit directement ou en terme de produit caractérisé en fonction de son procédé d'obtention, 15 points étaient déduits. Cependant, il était également possible de revendiquer un diamètre hydrodynamique de "300 nm ou moins" sans perdre de points, car aucune signification particulière n'était attribuée dans la lettre du client à la valeur de 10 nm. Une restriction induite à une plage plus étroite de "100 nm à 300 nm" coûtait 8 points.

La revendication de produit indépendante n'avait pas besoin d'être limitée par un paramètre tel que la charge d'insuline. Le tableau 3 de la lettre du client indique que les nanoparticules de PACA préparées à partir de 2-cyanoacrylate d'alkyle C₂-C₆ et comprenant un stabilisant pharmaceutiquement acceptable (compositions J, L et N) présente de façon inhérente, du fait du procédé de fabrication, la charge d'insuline minimale requise d'au moins 10% en poids définie dans la lettre du client comme étant suffisante pour produire un effet significatif sur le plan pharmacologique ([024]). Il n'y a pas besoin de fournir cette valeur minimale dans la formulation de la demande. Cela n'entraînait toutefois aucune perte de points.

3.2. Revendication de procédé

Un maximum de **24 points** était attribuable pour une revendication de procédé indépendante. Elle pouvait s'énoncer comme suit :

Méthode pour produire des nanoparticules biodégradables de 2-cyanoacrylate de polyalkyle (PACA) comprenant de l'insuline piégée à l'intérieur, comprenant les étapes suivantes :

- a) on dissout une quantité thérapeutiquement efficace d'un peptide dans une solution aqueuse acide ayant un pH de 2 ou moins et comprenant un stabilisant pharmaceutiquement acceptable (choisi parmi le dextrane, le chitosane ou la pectine);
- b) on mélange la solution aqueuse à une huile et un tensioactif non ionique, et on agite pour former une nanoémulsion eau dans huile;
- c) on dissout un monomère de 2-cyanoacrylate d'alkyle C₂-C₆ dans un solvant organique;
- d) on ajoute lentement la solution organique du monomère de l'étape c) à la nanoémulsion de l'étape b) sous agitation continue pour amorcer spontanément la polymérisation;
- e) on laisse la polymérisation se poursuivre et le solvant organique s'évaporer pour produire des nanoparticules de PACA;
- f) on sépare les nanoparticules de la nanoémulsion et on les purifie.

L'utilisation d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable à l'étape a) est une caractéristique essentielle. L'omission de cette caractéristique entraînait un manque de nouveauté par rapport à la méthode de polymérisation anionique de D2 exécutée à un pH de 1,9. Aucun point n'était attribué dans ce cas.

La caractéristique "pH de 2 ou moins" est essentielle pour la formation d'un complexe non covalent d'insuline avec le PACA ([028]).

Il n'y a pas de fondement dans la lettre du client pour une revendication générique portant sur un "pH inférieur au point isoélectrique" pour tous les peptides métaboliques envisageables. La formation d'un complexe non covalent avec le PACA est due aux propriétés physicochimiques spécifiques de l'insuline, et exige clairement un pH de 2 ou moins ([029]). En outre, revendiquer un "pH inférieur au point isoélectrique" entraînerait un manque de nouveauté par rapport à D2 qui décrit un pH de 5, inférieur au point isoélectrique de l'insuline. Une telle revendication ne rapportait aucun point.

Revendiquer la gamme de pH plus large de 1 à 6 ([026]), avec un stabilisant pharmaceutiquement acceptable, ne ferait que couvrir les variations triviales de la méthode de polymérisation anionique à un pH de 5 divulguée dans D2, comme il est démontré dans la lettre du client. Ceci est pénalisé par la perte de 16 points.

Il ressort aussi clairement de la lettre du client que la formation d'un complexe non covalent d'insuline avec le PACA est due au "mécanisme de polymérisation anionique" ([029]). Rien ne permet de spéculer qu'un complexe non covalent pourrait aussi se former par polymérisation interfaciale. Par conséquent, la revendication de procédé doit idéalement inclure les étapes a)-f) du paragraphe [021] de la lettre du client, ou au moins indiquer que la polymérisation s'effectue par "polymérisation anionique" (où la phase aqueuse a un pH de 2 ou moins et comprend un stabilisant pharmaceutiquement acceptable). L'omission de cette caractéristique essentielle coûtait 12 points.

Il n'était pas nécessaire d'indiquer la caractéristique non essentielle "0,5-1% en poids" d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable, s'agissant là, selon la lettre du client, d'une concentration typique ([025]). 5 points étaient perdus pour cette limitation indue.

Si la raison d'une perte de points (caractéristique essentielle manquante, limitation indue ou manque de clarté) s'applique tant à la revendication de produit indépendante qu'à la revendication de procédé indépendante, des points ne sont déduits qu'une fois, pour la revendication de produit (pas de double pénalité).

3.3. Revendication de produit subsidiaire (forme posologique pharmaceutique orale)

Un maximum de **8 points** était attribuable pour une revendication de produit indépendante portant sur une forme posologique pharmaceutique orale comprenant les nanoparticules de PACA chargées d'insuline inventives. La revendication peut s'énoncer comme suit :

Forme posologique (pharmaceutique) orale, ou forme posologique (pharmaceutique) pour administration orale, comprenant les nanoparticules biodégradables de PACA chargées d'insuline telles que revendiquées à la revendication x (avec des excipients pharmaceutiquement acceptables).

3.4. Revendication portant sur une utilisation médicale

Un maximum de **6 points** était attribuable pour une revendication indépendante de substance proposée à une fin spécifique selon les art. 54(4) ou 54(5) CBE portant sur les nanoparticules de PACA inventives chargées d'insuline, ou sur une forme posologique pharmaceutique orale les comprenant, pour une utilisation dans une méthode de traitement médical. La revendication peut s'énoncer comme suit :

Nanoparticules de PACA biodégradables chargées d'insuline telles que revendiquées à la revendication x, ou forme posologique (pharmaceutique) orale les comprenant telle que revendiquée à la revendication y, pour une utilisation comme médicament, ou spécifiquement, pour une utilisation dans une méthode de traitement par administration orale d'une maladie métabolique liée à des taux élevés de glucose dans le sang, ou plus spécifiquement, pour une utilisation dans une méthode de traitement du diabète par administration orale.

Aucun point n'était perdu si une utilisation plus générique ("comme médicament") ou une maladie plus spécifique ("diabète") était indiquée dans la revendication. Les deux options fournissaient des revendications d'utilisation médicale adéquates. Si les deux types de revendication sont présents, les 6 points disponibles sont répartis entre les deux.

La totalité des points était également attribuée pour une revendication portant sur les nanoparticules de PACA chargées d'insuline, ou sur une forme posologique orale les comprenant, pour une utilisation dans une méthode pour fournir de l'insuline à des patients qui en ont besoin, tels que les diabétiques ([034]). Une telle revendication concerne une limitation acceptable des intentions d'utilisation au titre de l'art. 54(5) CBE.

La lettre du client met l'accent sur l'utilisation des nanoparticules de PACA biodégradables de l'invention pour traiter des maladies métaboliques, notamment le diabète, par administration orale. Si la caractéristique essentielle "par administration orale" n'est pas indiquée, 2 points sont perdus, puisqu'il s'agit en fait de l'utilisation médicale spécifique que fournit l'invention.

4. Revendications dépendantes

Il y avait jusqu'à **15 points** à gagner pour des revendications dépendantes fournissant des positions de repli solides. Exemples : monomères de 2-cyanoacrylate d'alkyle pour lesquels les meilleurs résultats figurent à l'exemple 3 incluant non seulement de façon préférentielle le 2-cyanoacrylate d'éthyle et le 2-cyanoacrylate de n-butyle mais aussi le 2-cyanoacrylate de n-hexyle (3 points) ; distribution préférée de la taille des nanoparticules d'au moins 90% entre 100 nm et 300 nm (2 points) ; charge d'insuline de 10% à 30% en poids (2 points) ; stabilisants pharmaceutiquement acceptables spécifiques (2 points) ; teneur de 0.5-1% en poids de stabilisant dans la solution aqueuse (1 point) ; comprimés ou gélules (1 point) ; revêtement de la forme posologique orale (2 points) ; traitement du diabète de type 2 (2 points).

5. Description

Il y avait jusqu'à **15 points** à gagner pour une description adéquate de l'invention, avec une discussion de l'art antérieur D1 (3 points) et D2 (4 points). L'accent doit être mis sur D2 (résultats antérieurs obtenus par les inventeurs) afin d'identifier et de discuter la contribution technique décrite dans la lettre du client, à savoir les propriétés nouvelles et surprenantes des nanoparticules de PACA chargées d'insuline fabriquées par polymérisation anionique à un pH de 2 ou moins en présence d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable pour ce qui est de la libération prolongée d'insuline et de l'absorption intestinale améliorée, le tout menant à la possibilité de maintenir un effet pharmacologique significatif pendant des périodes plus longues après l'administration orale. 5 points étaient accordés pour une discussion exhaustive incluant tous les aspects susmentionnés avec référence aux résultats comparatifs indiqués à la figure 1 (compositions J, L, N). Enfin, les passages pertinents de la lettre du client devaient être adaptés de sorte à inclure les limitations à l'insuline, à un pH de 2 ou moins, et à l'utilisation d'un C₂-C₆ 2-cyanoacrylate d'alkyle C₂-C₆ et d'un stabilisant pharmaceutiquement acceptable (3 points).

EXAMINATION COMMITTEE I

Paper A (Chemistry) - 2016 - Marking Sheet

Category		Maximum possible
Independent claims	Product claim	32
	Method for preparing the nanoparticles	24
	Oral dosage and medical use	14
Dependent claims		15
Description		15
Total		100