



DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social SMITHKLINE BEECHAM CORPORATION

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica) GERMAN CASTILLO GRAU

País de Domicilio ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

Departamento o Estado PENNSYLVANIA

Dirección

Ciudad

FILADELFIA

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO PODER No.15.479

Nombre

GERMAN CASTILLO GRAU

Dirección y Domicilio

Carrera 13 No.37-43, Piso 12

Ciudad

Santafé de Bogotá

Teléfono 2857460

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

Creighton CONLEY

Nigel Philip McCreath DAVIDSON

Identificación

Dirección

Bristol, Tennessee, Estados Unidos de América

Bristol, Tennessee, Estados Unidos de América

Ciudad

Teléfono

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención FORMULACIONES FARMACEUTICAS

PRIORIDAD REIVINDICADA

SI ☒

NO ☐

TIPO DE PRIORIDAD

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) País E.U.A.

(32) Fecha Abril 29, 1999

(31) No. Solicitud 09/301.838

Fuente: Convención de París.

Para Publicar a los

☐ 6 meses

☐ 12 meses

☒ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

A61K 8/20, 31/545.

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

Un comprimido masticable que comprende amoxicilina, en el que la base masticable comprende esencialmente manitol, el cual está presente en al menos un 25% en peso del comprimido, es útil para tratar una amplia gama de infecciones bacterianas en niños.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica	☒
Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC	☒
Recibo de la tasa respectiva	☒
Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación	☐
Si se reivindica prioridad Andina:	
Copia de la primera solicitud	☐
Traducción oficial	☐
Si se reivindica prioridad Unionista:	
Copia certificada de la primera solicitud:	☐
Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior	
Traducción simple	☐
Capítulo descriptivo	☒
Dibujos, planos necesarios	☐
Capítulo reivindicatorio	☒
Tarjeta archivo propietarios según formato	☒
Tarjeta archivo temático según formato	☒
Extracto para publicación según formato	☒
Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms	☐
Otros Documentos	☐

SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA

NOMBRE GERMAN CASTILLO GRAU

CC.17'017.671 Btá

T.P.No.2978

3

NIT : 800176089-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00030256 00000000 Folios: 45
Fecha (AMD): 2000-04-27 15:06:15
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 24,494
FECHA : ABRIL 14 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CASTILLO GRAU Y ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	2000092256	2,432,000.00

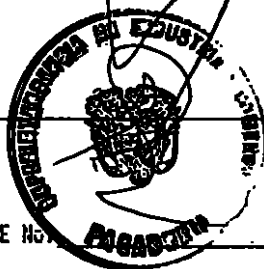
***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	608,000.00
	TOTAL :	\$ 608,000.00

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.



Formulaciones farmacéuticasCampo de la invención

La presente invención se refiere a nuevas formulaciones farmacéuticas que comprenden amoxicilina.

5

Antecedentes de la invención

La amoxicilina es un agente antibacteriano usado extensamente para el tratamiento de una amplia gama de infecciones bacterianas. Está disponible en la actualidad en.
10 una serie de diferentes formulaciones, por ejemplo, en forma de cápsulas, comprimidos masticables, suspensiones orales y gotas pediátricas. Para los pacientes adultos y pediátricos se prevén diferentes formulaciones y diferentes cantidades de amoxicilina. Así, por ejemplo, SmithKline Beecham
15 comercializa, con el nombre "Amoxil", *inter alia* comprimidos masticables que comprenden 125 mg o 250 mg de amoxicilina, para pacientes adultos y, para pacientes pediátricos, una suspensión oral que comprende 125 mg o 250 mg/5 ml de suspensión. Las formulaciones existentes están aprobadas para
20 su dosificación al menos tres veces al día (tid). Estos comprimidos masticables contienen una cantidad sustancial de azúcar (aproximadamente un 21% en peso), lo que hace a la base del comprimido menos idónea para la adaptación a un comprimido pediátrico. Además, SmithKline Beecham
25 comercializa también, con el nombre "Augmentin", *inter alia*,

comprimidos masticables que comprenden 125 mg de amoxicilina y 31,25 mg de clavulanato potásico o 250 mg de amoxicilina y 62,5 mg de clavulanato potásico, para la administración a pacientes adultos y también comprimidos masticables que
5 comprenden 200 mg de amoxicilina y 28,5 mg de clavulanato potásico o 400 mg de amoxicilina y 57,0 mg de clavulanato potásico, para administración a pacientes adultos.

El documento EP 0 396 335-A1 (Beecham Group plc)
10 describe comprimidos efervescentes masticables, por ejemplo, un comprimido "masticable efervescente" que comprende amoxicilina (250 mg) en el que la base masticable comprende una mezcla de sorbitol y manitol, presentes en aproximadamente un 15% y un 31% en peso del comprimido,
15 respectivamente. El complemento efervescente ayuda a enmascarar el desagradable sabor amargo de la amoxicilina. También puede estar presente un disgregante tal como un producto a base de celulosa, en una cantidad de un 5 a un 30%, para dar al paciente la opción de dispersar el
20 comprimido en una pequeña cantidad de agua antes de la administración.

El documento WO 92/19227 (Laboratorios Beecham SA) describe comprimidos no masticables que comprenden
25 amoxicilina que se preparan a partir de gránulos formados por

compactación con rodillo de amoxicilina con un disgregante.

Existe todavía la necesidad de proporcionar otras formulaciones que comprendan amoxicilina, que proporcionen una alternativa a las formulaciones existentes y que puedan
5 proporcionar también una pauta de dosificación más conveniente, en especial para niños.

Sumario de la invención

Por consiguiente, en un primer aspecto, la presente
10 invención proporciona un comprimido masticable que comprende trihidrato de amoxicilina en el que la base masticable comprende esencialmente manitol, el cual está presente al menos en un 25% en peso del comprimido.

15 Con preferencia, el comprimido está adaptado para la administración a un paciente pediátrico.

Descripción detallada de la invención

La presente invención proporciona un comprimido
20 masticable que, con preferencia, se prevé en una forma de dosis baja y una forma de dosis alta. De forma convencional, la cantidad de trihidrato de amoxicilina presente en una forma de dosificación se expresa como el peso de la amoxicilina ácido libre correspondiente. Preferiblemente, la
25 forma de dosis baja comprende de aproximadamente 150 a 250

mg, más preferiblemente, de 175 a 225 mg, de forma típica aproximadamente 200 mg de amoxicilina. Preferiblemente, la forma de dosis alta comprende de aproximadamente 350 a 450, más preferiblemente, de 375 a 425 mg, de forma típica, 5 aproximadamente 400 mg de amoxicilina.

Con preferencia, el trihidrato de amoxicilina está presente en un 45 a un 60%, más preferiblemente, en un 50 a un 55% en peso del comprimido.

10

Con preferencia, el manitol está presente en un 30 a un 50%, más preferiblemente, en un 35 a un 45%, todavía más preferiblemente, en un 40 a un 45% en peso del comprimido. Preferiblemente, se usa un manitol de calidad granular.

15

Por conveniencia de fabricación, se prefiere mantener un peso constante de comprimido. Preferiblemente, la cantidad de manitol se ajusta para compensar cualquier variación en la cantidad de trihidrato de amoxicilina, teniendo en cuenta 20 la pureza del mismo. Preferiblemente, el trihidrato de amoxicilina y el manitol comprenden conjuntamente de un 90 a un 97%, más preferiblemente, de un 92 a un 96%, todavía más preferiblemente, de un 93 a un 96% en peso del comprimido.

25 Además de un excipiente para proporcionar una base

46

masticable, un comprimido conforme a la presente invención puede comprender también otros excipientes, por ejemplo, disgregantes, lubricantes, agentes edulcorantes, agentes colorantes y aromatizantes. Dichos excipientes adicionales 5 comprenderán conjuntamente de un 3 a un 10%, más preferiblemente, de un 4 a un 8%, todavía más preferiblemente, de un 4 a un 7% en peso del comprimido.

Los disgregantes pueden estar presentes de un 1 a un 4%, 10 preferiblemente, en un 1 a un 3%, más preferiblemente, en un 1 a un 2% en peso del comprimido. Disgregantes representativos incluyen crospovidona, almidón glicolato sódico, almidones como almidón de maíz y almidón de arroz, croscarmelosa sódica y productos de la celulosa como celulosa 15 microcristalina, celulosa de finura micrométrica, hidroxipropilcelulosa poco sustituida, usados solos o mezclados. Con preferencia, el disgregante es crospovidona. Se observa que la presencia de un disgregante como crospovidona en el comprimido produce una velocidad de 20 disolución mucho más rápida.

Los lubricantes pueden estar presentes de 0,25 a 2,0%, preferiblemente, de 0,5 a 1,2% en peso del comprimido. Lubricantes preferidos incluyen estearato de magnesio.

a

Con preferencia, el agente edulcorante es un agente edulcorante artificial como sacarina sódica o aspartamo, preferiblemente, aspartamo, que puede estar presente en un 0,5 a 1,5% en peso del comprimido. Con preferencia, un 5 comprimido de la presente invención está sustancialmente exento de azúcar (sacarosa).

Agentes aromatizantes preferidos incluyen aromas de frutas que pueden ser naturales o sintéticos, por ejemplo, 10 menta, cereza y banana, o una mezcla de los mismos. Preferiblemente, un comprimido de la presente invención está sustancialmente exento de un potenciador de aroma como glicina.

15 Con preferencia, el comprimido de dosis baja tiene un peso total en el intervalo de 400 a 500 mg, más preferiblemente, de 425 a 475 mg, de forma típica, aproximadamente 450 mg. Preferiblemente, el comprimido de dosis alta tiene un peso total de 850 a 950 mg, más 20 preferiblemente, de 875 a 925 mg, de forma típica, aproximadamente 900 mg.

En una realización preferida, un comprimido de la presente invención comprende de 50 a 55% de trihidrato de 25 amoxicilina; de 40 a 45% de manitol; de 1 a 2% de

disgregante, preferiblemente, crospovidona; de 0,5 a 1,2% de lubricante, preferiblemente, estearato de magnesio; de 0,5 a 1,5% de agente edulcorante artificial, preferiblemente aspartamo; y agentes aromatizantes y colorantes, estando
5 expresado el % como % en peso del comprimido.

Con preferencia, los comprimidos masticables de la presente invención se usan para tratar una amplia gama de infecciones bacterianas en paciente pediátricos, tales como
10 infecciones del oído, nariz y garganta, infecciones del tracto genitourinario, infecciones del tracto respiratorio inferior e infecciones de la piel y de los tejidos blandos. Con preferencia, la dosis unitaria se toma cada 12 horas (bid, q12 h). Esto proporciona una pauta de dosificación más
15 conveniente para un paciente pediátrico, ya que no existe la necesidad de dosificar al niño durante el transcurso del día, cuando el niño está en el colegio.

Los comprimidos de la presente invención se pueden
20 preparar mezclando conjuntamente las diversos excipientes junto con la amoxicilina por técnicas convenientes, por ejemplo, por compresión directa. Como alternativa, algunos de los ingredientes se pueden conformar primero en forma de discos o placas o someterse a compactación con rodillos y las
25 placas o escamas resultantes molerse a continuación formando

gránulos. Estos gránulos se mezclan entonces con los restantes ingredientes y se compactan finalmente formando comprimidos. La preparación de gránulos que comprenden trihidrato de amoxicilina se ha descrito en el documento WO 92/19227 (Laboratorios Beecham SA) y el documento WO 98/35672 (SmithKline Beecham Laboratories Pharmaceutiques). En un proceso preferido, los gránulos se preparan por compactación con rodillo y seguidamente moliendo a partir de una mezcla primaria que comprende el trihidrato de amoxicilina, manitol, el disgregante y aproximadamente el 50% del lubricante. Los gránulos se mezclan entonces con el resto del lubricante y todos los restantes excipientes formando una mezcla secundaria que se compacta en forma de comprimidos. Con preferencia, los agentes edulcorante y colorante se incorporan en la mezcla primaria, mientras que los agentes aromatizantes se incorporan en la mezcla secundaria.

Los gránulos formados con manitol son nuevos. Por consiguiente, en otro aspecto, la presente invención proporciona gránulos que comprenden trihidrato de amoxicilina presente en un 45 a un 60%, más preferiblemente, en un 50% a un 55% en peso del gránulo y manitol presente en un 25% o más, preferiblemente, en un 30 a un 50%, más preferiblemente, en un 35 a un 45%, todavía más preferiblemente, en un 40 a un 45% en peso del gránulo.

Con preferencia, los gránulos comprenden además un disgregante como el descrito antes en la presente memoria, presente en un 1 a un 4%, preferiblemente, en un 1 a un 3%, más preferiblemente, de un 1 a un 2% en peso del gránulo.

5

Con preferencia, los gránulos comprenden además un lubricante como se ha descrito antes en la presente memoria, presente en un 0,125 a un 1,0%, preferiblemente, en un 0,25 a un 0,6% en peso del gránulo.

10

Los gránulos preferidos comprenden trihidrato de amoxicilina presente en un 50 a un 55%, manitol presente en un 40 a un 45%, crospovidona presente en un 1 a un 2% y estearato de magnesio presente en un 0,25 a un 0,6%; estando
15 todos los porcentajes expresados en peso del gránulo.

En otro aspecto, la presente invención proporciona un comprimido masticable que comprende gránulos como los que se han descrito en la presente memoria. Con preferencia, los
20 comprimidos comprenden un lubricante extragranular, presente en aproximadamente un 50% de la cantidad total de lubricante.

Los comprimidos masticables se envasan preferiblemente en recipientes protectores herméticamente cerrados, tales
25 como frascos con tapón a rosca, tubos metálicos o de

plástico, sobres realizados en una delgada lámina de aluminio, envases blíster de aluminio y similares.

La invención se ilustra por los siguientes Ejemplos:

5

Ejemplo 1 - Comprimido de "200 mg"

	Trihidrato de amoxicilina* (equivalente a amoxicilina ácido libre)	232,5 mg (200)	51,68%
	Manitol (granular)	190,93	42,43
10	Crospovidona	7,02	1,56
	Aspartamo	3,24	0,72
	Estearato de magnesio	4,50	1,00
	Agente colorante	0,27	0,06
	Agentes aromatizantes	11,48	2,55
15	Peso total del comprimido	450	

*en base a una potencia del 86% (siendo la "potencia" un ajuste para tener en cuenta la pureza y el contenido del trihidrato). La cantidad de manitol se ajusta según la potencia del trihidrato de amoxicilina, con el fin de mantener un peso de comprimido constante.

Ejemplo 2 - Comprimido de "400 mg"

	Trihidrato de amoxicilina* (equivalente a amoxicilina ácido libre)	465,12 mg (400)	51,68%
	Manitol (granular)	381,87	42,43
5	Crospovidona	14,04	1,56
	Aspartamo	6,48	0,72
	Estearato de magnesio	9,00	1,00
	Agente colorante	0,54	0,06
	Agentes aromatizantes	22,95	2,55
10	Peso total del comprimido	900	

en base a una potencia del 86% (siendo la "potencia" un ajuste para tener en cuenta la pureza y el contenido del trihidrato). La cantidad de manitol se ajusta según la potencia del trihidrato de amoxicilina, con el fin de mantener un peso de comprimido constante.

Los comprimidos se prepararon mezclando inicialmente el trihidrato de amoxicilina, la crospovidona, el agente colorante, el aspartamo, el manitol y el estearato de magnesio (la mitad de la cantidad). La mezcla se trata a continuación por compactación con rodillo y se muele formando gránulos. Estos gránulos se mezclaron con los agentes aromatizantes y el estearato de magnesio restante y toda la mezcla se compacta formando comprimidos.

Ejemplo de referencia 1 - Comprimido masticable de 250 mg existente (Amoxil)*

Amoxicilina 250 mg (como trihidrato de amoxicilina)

Ingredientes inactivos: ácido cítrico, almidón de maíz", Rojo
5 FD&C N° 40, aromatizantes, glicina, manitol, estearato de
magnesio, sacarina sódica, gel de sílice y sacarosa.

* Physicians Desk Reference, 49 Ed. Medical Economics Data
Production Co., Montvale NJ 07645-1742, 2351, 1995.

10 " un constituyente del producto que comprende los
aromatizantes

Ensayo de disolución

El procedimiento usado fue el descrito en la Farmacopea
de los Estados Unidos (USP 23, 1995) en la página 104, para
15 comprimidos de amoxicilina y clavulanato potásico, adaptado
como sigue:

Aparato: 2 (paletas)

RPM: 75

Medio: 900 ml de agua a 37°C

20

Para comprimidos masticables de 200 y 400 mg (Ejemplos 1 y
2)

Tiempo 30 minutos

Q 75%

25

Para una formulación de cápsula que comprende amoxicilina:

Aparato: 1 (cestas)

RPM: 100

5 Medio: 900 ml de agua a 37°C

Tiempo: 90 minutos

Q = 80%

Así pues, se encontró que la presencia de un
10 disgregante, crospovidona, en los comprimidos masticables de
la presente invención aumenta considerablemente la velocidad
de disolución del comprimido masticable, al comparar con un
comprimido masticable existente (Ejemplo de Referencia 1) que
no tiene disgregante. Se produjo una disolución del 75%
15 después de 30 minutos, comparada con una disolución del 80%
después de 90 minutos. Además, los comprimidos masticables
de la invención tuvieron una mayor velocidad de disolución
al comparar con la formulación de cápsula existente,
Amoxil™.

20

Estudio de bioequivalencia

Además, en un estudio de bioequivalencia en voluntarios
humanos, se demostró que el comprimido masticable de 400 mg
era bioequivalente a una suspensión pediátrica de amoxicilina
25 que comprende una cantidad correspondiente de amoxicilina por

5 ml de suspensión.

Todas las publicaciones, incluyendo aunque sin quedar limitadas a las patentes y solicitudes de patente, citadas en esta memoria descriptiva se incorporan en la presente memoria como referencia como si se indicara de forma específica e individual que cada una de las publicaciones individuales se incorporan en la presente memoria como referencia, tal y como se describen en su totalidad.

10

La descripción anterior describe de forma completa la invención, incluyendo las realizaciones preferidas de la misma. Las modificaciones y mejoras de las realizaciones descritas de manera específica en la presente memoria están dentro del alcance de las siguientes reivindicaciones. Sin elaboración adicional, se cree que un experto en la técnica puede, usando la descripción anterior, utilizar la presente invención en toda su extensión. Por tanto, los presentes ejemplos se considerarán meramente ilustrativos y no limitantes del alcance de la presente invención en modo alguno. Las realizaciones de la invención en las que se reivindica una propiedad o privilegio exclusivos se reivindican y definen como sigue:

Habiendo descrito la invención como antecede, se declara como propiedad lo contenido en las siguientes

REIVINDICACIONES

1. Un comprimido masticable que comprende trihidrato de amoxicilina, en el que la base masticable comprende ~~(esencialmente)~~ manitol, el cual está presente al menos en un 25% en peso del comprimido.
2. Un comprimido según la reivindicación 1, adaptado para la administración a un paciente pediátrico.
3. Un comprimido según la reivindicación 1, proporcionándose el comprimido en una forma de dosis baja que comprende de aproximadamente 150 a 250 mg de amoxicilina y en una forma de dosis alta que comprende de aproximadamente 350 a 450 mg de amoxicilina.
4. Un comprimido según la reivindicación 1, en el que la amoxicilina está presente en un 45 a un 60% en peso del comprimido.
5. Un comprimido según la reivindicación 1, en el que el manitol está presente en un 30 a un 50% en peso del comprimido.

6. Un comprimido según la reivindicación 1, que comprende otros excipientes, por ejemplo, disgregantes, lubricantes, agentes edulcorantes, agentes colorantes y aromatizantes. } *comina.*

5 7. Un comprimido según la reivindicación 1, en el que puede estar presente un disgregante en un 1 a un 4% en peso del comprimido.

8. Un comprimido según la reivindicación 7, en el que el
10 disgregante es crospovidona.

9. Un comprimido según la reivindicación 1, en el que puede estar presente un lubricante en un 0,25 a un 2,0% en peso del comprimido.

15

10. Un comprimido según la reivindicación 9, en el que el lubricante es estearato de magnesio.

11. Un comprimido según la reivindicación 1, en el que el
20 agente edulcorante es un agente edulcorante artificial.

12. Un comprimido según la reivindicación 11, en el que el agente edulcorante artificial es aspartamo.

25 13. Un comprimido según la reivindicación 3, en el que el

P32295

-17-

comprimido de dosis baja tiene un peso total en el intervalo de 400 a 500 mg y el comprimido de dosis alta tiene un peso total en el intervalo de 850 a 950 mg.

- 5 14. Un comprimido masticable que comprende de un 50 a un 55% de trihidrato de amoxicilina; de un 40 a un 45% de manitol; de un 1 a un 2% de disgregante; de un 0,5 a un 1,2% de lubricante; de un 0,5 a un 1,5% de agente edulcorante artificial; y agentes aromatizantes y colorantes.

10

- cf.
15. Un procedimiento para tratar una infección bacteriana en un paciente pediátrico que comprende administrar a dicho paciente una cantidad eficaz de un comprimido según la reivindicación 1.

15

- cf.
16. Un procedimiento según la reivindicación 14, en el que la dosis se administra cada 12 horas.

20

17. Un gránulo farmacéutico que comprende trihidrato de amoxicilina presente en un 45 a un 60% en peso del gránulo y manitol presente en un 25% o más en peso del gránulo.

25

18. Un gránulo según la reivindicación 18, que comprende además un disgregante presente en un 1 a un 4% en peso del gránulo.

P32295

-18-

19. Un gránulo según la reivindicación 18, que comprende además un lubricante presente en un 0,125 a un 1,0% en peso del gránulo.

5 20. Un gránulo según la reivindicación 18, que comprende trihidrato de amoxicilina presente en un 50 a un 55%, manitol presente en un 40 a un 45%, crospovidona presente en un 1 a un 2% y estearato de magnesio presente en un 0,25 a un 0,6%; estando todos los porcentajes expresados en peso del gránulo.

10

21. Un comprimido masticable que comprende gránulos formados por trihidrato de amoxicilina presente en un 45 a un 60% en peso del gránulo y manitol presente en un 25% o más en peso del gránulo.

md.
? 2
1

15

22. Un comprimido masticable según la reivindicación 20, que comprende además un lubricante extragranular, presente en aproximadamente un 50% de la cantidad total de lubricante en el comprimido.

? 1

20

22
2

P32295

-19-

Resumen de la invención

Un comprimido masticable que comprende amoxicilina, en el que la base masticable comprende esencialmente manitol, el cual está presente en al menos un 25% en peso del 5 comprimido, es útil para tratar una amplia gama de infecciones bacterianas en niños.

/

13 Los folios 43 y 44 son tarjetas #202012#.
A mayo 25/2000#.

23

**EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION**

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL

(21) No. SOLICITUD:

(51) INT. CL.:

(22) FECHA DE
PRESENTACIÓN:

(71) SOLICITANTE:
SMITHKLINE BEECHAM CORPORATION

(30) PRIORIDAD:

(31) No. DE SOLICITUD: 09/301.883

(72) INVENTOR/ES:
Creighton CONLEY
Nigel Philip McCreath DAVIDSON

(32) FECHA DE
PRESENTACIÓN: Abril 29 de 1999

(33) PAÍS: E.U.A.

(74) APODERADO:
GERMAN CASTILLO GRAU

(64) TÍTULO: FORMULACIONES FARMACEUTICAS

(57) RESUMEN:

1. Un comprimido masticable que comprende trihidrato de amoxicilina, en el que la base masticable comprende esencialmente manitol, el cual está presente al menos en un 25% en peso del comprimido.

14. Un comprimido masticable que comprende de un 50 a un 55% de trihidrato de amoxicilina; de un 40 a un 45% de manitol; de un 1 a un 2% de disgregante; de un 0,5 a un 1,2% de lubricante; de un 0,5 a un 1,5% de agente edulcorante artificial; y agentes aromatizantes y colorantes.

17. Un gránulo farmacéutico que comprende trihidrato de amoxicilina presente en un 45 a un 60% en peso del gránulo y manitol presente en un 25% o más en peso del gránulo.

REQUISITOS MINIMOS PARA AD

Radicacion : 00030256 00000000 Folios: 45
Fecha (ARD): 2000-04-27 15:00:15
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PATENTE DE INVENCION [✓]

MODELO DE UTILIDAD []

- Nombre e identificación del Solicitante []
- Nombre e identificación del Inventor []
- Título o nombre de la Invención []
- Descripción []
- Reivindicaciones 18 []
- Resumen 42 []
- Comprobante de Pago 3 []

COMPLETA [✓]

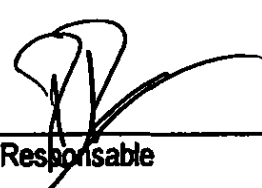
INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Nombre e identificación del peticionario []
- Nombre e identificación del inventor o diseñador []
- Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse []
- Representación gráfica []
- Comprobante de pago []

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha: _____

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador: 334 12 21-2-3-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

INFORME DE PROTOCOLO

Expediente 00-030256.

Fecha: 28 de abril del 2000.

Se certifica que:

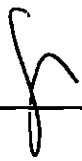
Desde fecha 13 de octubre de 1994,
del folio 78.086 al folio 78.091 del
libro de Protocolo N° 265, obra el poder
N° 15.479 conferido por SMITHKLINE
BEECHAM CORPORATION

domiciliado(a) en Filadelfia - Pensilvania,
E.U.A.

al doctor GERMAN CASTILLO GRAU y/o ADRIANA
CASTILLO GIBSON y/o LUIS FELIPE CASTILLO
GIBSON

Representante en Santafé de Bogotá D.C. Los
mismos

Facultad para desistir SI.

Revisado .

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PRIMER EXAMEN DE FORMA

EXPEDIENTE 00-030256

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- | | | |
|---|---|---|
| SI ☒ | NO ☐ | NO APLICABLE ☐ Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a). |
| SI ☒ | NO ☐ | NO APLICABLE ☐ Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94). |
| SI ☒ | NO ☐ | NO APLICABLE ☐ Presentó, en forma correcta el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de enero del 2000). |
| SI ☒ | NO ☐ | EXTEMPORANEAMENTE ☐ Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de Paris. |
| SI ☐ | NO ☒ | NO APLICABLE ☐ Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional. |
| SI ☐ | NO ☒ | NO APLICABLE ☐ Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.). |
| SI ☐ | NO ☒ | CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS |

OBSERVACIONES JURIDICAS CONVENIO DE PARIS: En todo caso, deberá presentar copia certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, **en cualquier momento dentro del plazo de tres (3) meses**, contados a partir de la fecha de depósito de la solicitud posterior. La omisión de esta formalidad implicará la pérdida del derecho de prioridad.

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

- | | | |
|------------------------------------|---|--|
| SI ☐ | NO ☒ | Se ajusta a los aspectos FORMALES indicados en la Decisión 344 y por tanto, |
| SI ☐ | NO ☒ | Se recomienda PUBLICAR el extracto correspondiente. |

Santafé de Bogotá, D.C., 28 de abril del 2000.



EXAMINADOR JURIDICO

1° EXAMEN DE FORMA

Radicación n° 00-30256

CONCEPTO TÉCNICO N° 776

IPC: A61K 9/20, 31/543

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención:

- SI ☒ NO ☐ Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e).
- SI ☐ NO ☒ Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13-b).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c).
- SI ☐ NO ☐ Contiene los dibujos correctos (Art.14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto. 117 del 94).
- SI ☒ NO ☐ Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art.14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980).
- SI ☐ NO ☒ Contiene una o más reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d).
- SI ☐ NO ☒ Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94.
- SI ☐ NO ☐ Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto. 117 /94.
- SI ☐ NO ☒ Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P-104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94).
- SI ☐ NO ☒ Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P-105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94).
- SI ☐ NO ☒ CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

Santa Fe de Bogotá, D.C., 24 de mayo de 2000

202012

1º EXAMEN DE FORMA

CONCEPTO TÉCNICO N°776

Radicación n° 00-30256

IPC: A61K 9/20, 31/545

- -El título es muy general, debe estar acorde con el capítulo reivindicatorio y descriptivo, los cuales se refieren a un comprimido masticable de amoxicilina.
- -La reivindicación 1, con tiene el termino "esencialmente" que no define nada y si causa ambigüedad.
- -La reivindicación 2 no define ninguna característica técnica del comprimido masticable o sea las reivindicaciones deben definir la invención por medio de características técnicas específicas.
- -La reivindicación 3 no es clara, porque define las cantidades de manera ambigua con términos como "... de aproximadamente."
- -Las reivindicaciones 17 a 20 no guardan el requisito de unidad inventiva, porque esta reivindicación no conserva todas las características técnicas especiales, de comprimido masticable que comprende de un 50% a un 55% de trihidrato de amoxicilina; de un 40 a 45% de manitol; de un 1 a un 2% de disgregante; de un 0,5% a un 1,2% de lubricante; de un 0,5% a un 1,5% de agente edulcorante artificial; y agentes aromatizantes y colorantes; los gránulos son un objeto diferente a lo que son comprimidos masticables.
- -Las reivindicaciones 20 y 21 no guardan el requisito de unidad inventiva, porque esta reivindicación no conserva todas las características técnicas esenciales del comprimido masticable que comprende de un 50% a un 55% de trihidrato de amoxicilina; de un 40 a 45% de manitol; de un 1 a un 2% de disgregante; de un 0,5% a un 1,2% de lubricante; de un 0,5% a un 1,5% de agente edulcorante artificial; y agentes aromatizantes y colorantes; los comprimidos de las reivindicaciones objetadas son diferentes a los de la reivindicación 14 por ejemplo.

NOTA: El capítulo reivindicatorio tal como se presenta contiene tres objetos diferentes un comprimido masticable, unos gránulos y otro comprimido masticable hecho con los gránulos, que no se relacionan de manera alguna con los comprimidos de las reivindicaciones 1 a 14

para que se conserve la unidad inventiva; entonces se debería plantear de acuerdo a que si la invención reside en la mezcla de los compuestos manitol+amoxicilina, entonces se debería reorganizar el capítulo reivindicatorio, de tal manera que pueda conservar la unidad inventiva.

*Se entiende por características técnicas esenciales, las características nuevas y que sean indispensables para la invención.

202012

Santa Fe de Bogotá D.C., 25 de mayo de 2000.

EXPEDIENTE 00-030256

AUTO 1260

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DISPONE

ARTICULO PRIMERO: Reconocer personería al doctor GERMAN CASTILLO GRAU, como apoderado del solicitante, en los términos y para los efectos del poder conferido

ARTICULO SEGUNDO: Conforme lo establece el artículo 22 de la Decisión 344 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena, requiérsele al solicitante, para que dentro del plazo de treinta (30) días hábiles siguientes a la fecha de notificación del auto, presente respuesta a las observaciones o complemente los antecedentes señalados en el examen de forma.

ARTICULO TERCERO: Notificar por estado el presente auto, advirtiéndole que contra el no procede recurso alguno en la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

06 JUN 2000

Dado en Santafé de Bogotá D.C., a los _____

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C.: **08 JUN 2000** notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI _____ NO _____

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA