

501 1/a

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 00-097644-00018-0000

Fecha: 2007-08-12 16:28:35 Dep. 2020 NUECREACION
Tm. 2 PATENTES Evt. 1 REGDEPOSITO
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 9

As. 84.048

Señora

JEFE DE DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.

REF: Expediente No. 00 097 644 - solicitud de patente de invención a favor
de PHARMACIA CORPORATION

Respuesta a oficio No. 1798 del 08 de febrero de 2007

JUAN PABLO CADENA SARMIENTO, portador de la tarjeta profesional No. 57.492 del C.S.J., obrando como apoderado sustituto de la sociedad PHARMACIA CORPORATION, según lo acredita el documento de sustitución de poder presentado ante esa División, me permito dar respuesta a las observaciones de carácter técnico y jurídico, relacionadas con la patentabilidad, para la concesión de la patente de acuerdo con la Decisión 486 según el concepto técnico No. 0134 notificado por fijación en lista de fecha 08 de febrero de 2007, cuyo término se prorrogó por escrito presentado el 04 de mayo de 2007.

Con el fin de superar las objeciones relacionadas con excepciones a la patentabilidad y a la claridad de la solicitud presentadas por el señor examinador, se anexa un nuevo capítulo reivindicatorio con 1 - 27 reivindicaciones, el cual reemplaza en su totalidad el capítulo reivindicatorio presentado anteriormente y no anexa materia nueva ni amplía el alcance de la presente solicitud.

El nuevo capítulo reivindicatorio subsana la objeción presentada por falta de claridad eliminando las reivindicaciones 1, 17 y 23 y reduciendo el número de reivindicaciones independientes a una sola.

En cuanto a las objeciones por falta de altura inventiva a la luz de lo divulgado por las anterioridades US 5760068 (D1) y WO 9103235 (D2). Al respecto es necesario realizar los siguientes comentarios.

Como se puede apreciar en el nuevo capítulo reivindicatorio anexo, la presente solicitud propone una forma de dosis unitaria para suministrar formulaciones de celecoxib. Lo propuesto por la presente solicitud requiere el uso de dos fracciones del medicamento, una de liberación inmediata y otra de liberación controlada. La anterioridad D1 enseña formulaciones de liberación controlada de celecoxib, la anterioridad D2 enseña un método de suministro que emplea una cápsula con un orificio de salida. La anterioridad D2 ya no es relevante como arte previo para el nuevo capítulo reivindicatorio anexo. La altura inventiva de la presente solicitud radica en proporcionar una composición que ofrece una disponibilidad inmediata de una cantidad determinada del componente activo, y mantiene la concentración en plasma de dicho componente activo durante un periodo determinado, contrario a la anterioridad D1 que solo proporciona un suministro constante en el tiempo empleando composiciones con recubrimientos de liberación controlada.

La solución propuesta por la presente solicitud es específica y busca proporcionar un efecto de acción inmediata combinado con un efecto de acción en el tiempo. La anterioridad D1 no enseña o sugiere la posibilidad de proporcionar composiciones farmacéuticas como las de la presente solicitud. El técnico con habilidad en la materia no derivaría lo divulgado en la presente solicitud a partir de lo enseñado por la anterioridad D1 por varias razones. En primer lugar dicha anterioridad no enseña o sugiere composiciones farmacéuticas con dos fracciones diferentes. En segundo lugar, no existe un motivo razonable para suponer que el técnico con habilidad en la materia combinaría sus conocimientos sobre composiciones farmacéuticas con lo divulgado por D1 para derivar lo de la presente solicitud. Lo anterior se debe

a que no se trata simplemente de formular una composición con una fracción de liberación inmediata y otra de liberación controlada, se trata de formular una composición que logra unos niveles de concentración en plasma específicos para maximizar el efecto terapéutico del ingrediente activo durante un tiempo determinado.

El desarrollo de la materia propuesta por la presente solicitud requiere de estudios que permitan establecer cual es la mejor proporción entre la fracción de acción inmediata y la fracción de acción controlada. No es posible asumir que este tipo de estudios se encuentren dentro de la rutina diaria del técnico con habilidad en la materia. Por otro lado, ¿que motivos tendría el técnico con habilidad en la materia para desarrollar una composición con dos fracciones con velocidades de suministro diferentes cuando el arte previo enseña a cabalidad que una sola fracción con recubrimiento de liberación controlada es suficiente?

El solicitante encontró que es posible mejorar el suministro del medicamento si en lugar de emplear una sola fracción recubierta de un recubrimiento de liberación controlada se emplea una fracción de liberación instantánea y una de liberación controlada. Dada la variedad de posibles soluciones disponibles en el arte previo, la solución ofrecida en la presente invención solo es obvia si se analiza retrospectivamente, puesto que nada en D1 le sugiere al técnico con habilidad en la materia las ventajas de formular una composición como la de la presente solicitud en comparación con las formulaciones propuestas en dicha anterioridad.

Por último, los diámetros de partícula manejados en la presente solicitud no los enseña ni sugiere el arte previo citado por el señor examinador, y se encuentran íntimamente relacionados con la forma de actuar de la composición, siendo muy pequeños para la fracción de acción inmediata, y más grandes para la fracción de liberación controlada.

En vista de lo anterior, respetuosamente solicitamos el retiro de las objeciones a la presente solicitud, sobre la base de los argumentos y el nuevo capítulo reivindicatorio presentados ya que, en opinión del solicitante, la presente invención cumple con los requisitos de novedad, altura inventiva y aplicabilidad industrial de la Decisión 486.

De la Señora Jefe,

Atentamente,



JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

T.P. No. 57.492 del C.SJ.

C.C. 80.410.337 de Usaquén

Carrera 7 No. 71-21, Torre B, Of. 402

Bogotá, 12 de Junio de 2007

CH

SOS

A

Reivindicaciones:

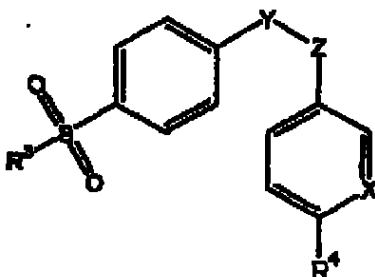
- 1. Una composición farmacéutica que comprende una o más dosis unitarias administrables oralmente, cada una comprende una primera fracción de una droga inhibidora selectiva de ciclooxigenasa-2 de baja solubilidad en agua en una cantidad de a 10 mg a 400 mg, dicha primera fracción se encuentra en solución en un solvente farmacéuticamente aceptable y/o esta presente en partículas sólidas de liberación inmediata que tienen un tamaño de partícula D_{90} menor a 1 μm ; y una segunda fracción de la droga en una cantidad de 10mg a 400 mg, dicha segunda fracción está presente en partículas sólidas que tienen un tamaño de partícula D_{90} mayor a 25 μm y/o en partículas de liberación controlada, liberación lenta, liberación programada, liberación temporizada, liberación en pulsos, liberación sostenida o liberación extendida; en donde dicha primera fracción y dicha segunda fracción de la droga están presentes en una proporción de peso de 10:1 hasta 1:10.**
- 2. Una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende una o más dosis unitarias administrables oralmente, cada una comprende una primera fracción de una droga inhibidora selectiva de ciclooxigenasa-2 de baja solubilidad en agua en una cantidad de a 10 mg a 400 mg, dicha primera fracción se encuentra en solución en un solvente farmacéuticamente aceptable y esta presente en partículas sólidas de liberación inmediata que tienen un tamaño de partícula D_{50} menor a 5 μm ; y una segunda fracción de la droga en una cantidad de 10mg a 400 mg, dicha segunda fracción está presente en partículas sólidas que tienen un tamaño de partícula D_{90} mayor a 25 μm y/o en partículas de liberación controlada, liberación lenta, liberación programada, liberación temporizada, liberación en pulsos, liberación sostenida o liberación extendida; en donde dicha primera fracción y dicha segunda fracción de la droga están presentes en una proporción de peso de 10:1 hasta 1:10.**
- 3. Una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 2 en donde dicha segunda fracción de la droga esta en forma de partículas de liberación controlada, liberación lenta, liberación programada, liberación temporizada, liberación en pulsos, liberación sostenida o liberación extendida.**

586

4. Una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 2 en donde dicha segunda fracción de la droga esta presente en forma de partículas sólidas con un tamaño de partícula D_{90} mayor a $25\mu\text{m}$ y en partículas de liberación controlada, liberación lenta, liberación programada, liberación temporizada, liberación en pulsos, liberación sostenida o liberación extendida.

5. Una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende una o más dosis unitarias administrables oralmente, cada una comprende una primera fracción de una droga inhibidora selectiva de ciclooxigenasa-2 de baja solubilidad en agua en una cantidad de a 10 mg a 400 mg, dicha primera fracción se encuentra presente en partículas sólidas de liberación inmediata que tienen un tamaño de partícula D_{50} menor a $5\mu\text{m}$; y una segunda fracción de la droga en una cantidad de 10mg a 400 mg, dicha segunda fracción está presente en partículas sólidas que tienen un tamaño de partícula D_{90} mayor a $25\mu\text{m}$ y/o en partículas de liberación controlada, liberación lenta, liberación programada, liberación temporizada, liberación en pulsos, liberación sostenida o liberación extendida; en donde dicha primera fracción y dicha segunda fracción de la droga están presentes en una proporción de peso de 10:1 hasta 1:10.

6. La composición de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en donde la droga inhibidora selectiva de ciclooxigenasa-2 es un compuesto de fórmula



en donde R^3 es un grupo metilo o amino, R^4 es hidrógeno o un grupo C1-4 alquilo o alcoxi, X es N o CR^5 en donde R^5 es hidrógeno o halógeno, e Y e Z son independientemente átomos de carbono o nitrógeno que definen átomos adyacentes de un anillo de cinco o seis miembros que no está sustituido o esta sustituido en una o más posiciones por grupos oxo, halo, metilo o halometilo.

SPX
X

7. La composición de la reivindicación 6 en donde el anillo de cinco o seis miembros se selecciona del grupo que consiste de anillos de ciclopentanona, furanona, metilpirazol, isoxazol y piridina sustituidos en no más de una posición.
8. La composición de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en donde la droga inhibidora selectiva de ciclooxigenasa-2 se selecciona de celecoxib, deracoxib, valdecoxib, rofecoxib, 5-cloro-3-(4-metilsulfonil)fenil-2-(2-metil-5-piridinil)piridina, 2-(3,5-difluorofenil)-3-[4-(metilsulfonil)fenil]-2-ciclopentan-1-ona y ácido (S)-6,8-dicloro-2-(trifluorometil)-2H-1-benzopyran-3-carboxílico.
9. La composición de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en donde la droga inhibidora selectiva de ciclooxigenasa-2- es celecoxib.
10. La composición de cualquiera de las reivindicaciones 1 – 4 en donde dicha primera fracción de la droga se encuentra en solución en un solvente farmacéuticamente aceptable.
11. La composición de la reivindicación 10 en donde el solvente comprende polietilen glicol.
12. La composición de la reivindicación 10 en donde las partículas que comprenden dicha segunda fracción de la droga son estables en suspensión en una solución matriz que comprende dicha primera fracción de la droga.
13. La composición de la reivindicación 12 que esta en forma de cápsulas de dosis unitaria.
14. La composición de la reivindicación 1 en donde dicha primera fracción de la droga se encuentra presente en partículas sólidas de liberación inmediata que tienen un tamaño de partícula D_{90} menor a 5 μm .
15. La composición de la reivindicación 14 que esta en forma de cápsulas duras de dosis unitaria.

16. La composición de la reivindicación 15 en donde dicha primera fracción y dicha segunda fracción de la droga están presentes en gránulos separados o perlas dentro de las cápsulas.

17. La composición de la reivindicación 16 en donde dicha segunda fracción de la droga esta presente en una multiplicidad de perlas recubiertas que tienen propiedades de liberación controlada, liberación lenta, liberación programada, liberación temporizada, liberación en pulsos, liberación sostenida o liberación prolongada.

18. La composición de la reivindicación 17 en donde las perlas tienen un recubrimiento de liberación sostenida que comprende uno o más polímeros que prolongan la liberación, farmacéuticamente aceptables.

19. La composición de la reivindicación 18 en donde dicha primera fracción de la droga esta presente en una multiplicidad de perlas de similar tamaño que contienen dicha segunda fracción de la droga, pero que no tienen recubrimiento o tienen un recubrimiento que no es un recubrimiento de liberación controlada, liberación lenta, liberación programada, liberación temporizada, liberación en pulsos, liberación sostenida o liberación prolongada.

20. La composición de la reivindicación 18 en donde los polímeros que prolongan la liberación se seleccionan de etilcelulosa y polímeros y copolímeros de ácido acrílico, ácido metacrílico,

21. La composición de la reivindicación 15 en donde dicha primera fracción y dicha segunda fracción de la droga están presentes juntas en las perlas, cada perla individual tiene propiedades de doble liberación.

22. La composición de la reivindicación 21 en donde cada perla tiene una capa interna de liberación sostenida que contiene dicha segunda fracción de la droga y una capa externa de liberación inmediata que contiene dicha primera fracción de la droga.

23. La composición de la reivindicación 14 que está en forma de tabletas de dosis unitaria.

24. La composición de la reivindicación 23 en donde dicha primera fracción y dicha segunda fracción de la droga están presentes en capas separadas dentro de las tabletas.

25. La composición de la reivindicación 24 en donde dicha segunda fracción de la droga esta presente en partículas que tienen propiedades de liberación controlada, liberación lenta, liberación programada, liberación temporizada, liberación en pulsos, liberación sostenida o liberación prolongada.

26. La composición de la reivindicación 25 en donde dicha segunda fracción de la droga está distribuida en una matriz de liberación sostenida que comprende hidroxipropilmetilcelulosa que tiene una viscosidad, al 2% en agua, de 0.01 8 Pa.s.

27. La composición de la reivindicación 1, en donde la composición está adaptada para ser administrada oralmente de 1 a 4 dosis por día.

540

EXAMEN TÉCNICO DE FONDO			
Nº Radicación	00 097 644	Fecha de presentación	26 -12 - 2000
	60 181 604 60 202 270 (NO SE TIENEN EN CUENTA por adjuntar Copias extemporáneas)		10 - 02 - 2000 05 - 05 - 2000
Nº Prioridad		Fecha de Prioridad	

Palabra clave	
---------------	--

CLASIFICACIONES INTERNACIONALES DE BÚSQUEDA			
A 61 K 31/44	// 31/10	// 31/42	

DOCUMENTOS CORRESPONDIENTES EN OTROS PAISES	
Patente Original	WO 01 45706
Otros	EP1239857 (A0) CA2394232 (A1) EP1239857 (B1) CN1230167C (C) AU780774B (B2)

BASES DE DATOS CONSULTADAS			
OEPM	Epollne	Espacenet	Oficina US

INFORMES DE EXÁMENES EN OTRAS OFICINAS		
Documento	Fecha	Relv. Afectadas
WO 01 45706	28 junio 2001	1 - 16, 19 - 31

ANTERIORIDADES ENCONTRADAS		
Documento de Prioritas	Relv. Afectadas	Relevancia
US 5 760 068	1 - 16, 19 - 31	Novedad y Nivel Inventivo
WO 91 03235	1 - 16, 19 - 31	Novedad y Nivel Inventivo
WO 00 32189	1 - 16, 19 - 31	Novedad y Nivel Inventivo
US 5 833 272	1 - 16, 19 - 31	Novedad y Nivel Inventivo
EP 0 863 134	1 - 16, 19 - 31	Novedad y Nivel Inventivo

LITERATURA NO PATENTES		
Documento no Patentes	Relv. Afectadas	Relevancia
(*) GENNARO, Alfonso R. "Remington Farmacia". 19 ava. ed. Editorial Médica Panamericana. págs. 2536 - 2538 y 2544 - 2549.	1 - 16, 19 - 31	Nivel Inventivo

Observaciones	
Fecha del examen	Junio 14 de 2006