

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA



00 97406

SOLICITU
INTE
NCH

Ediccionario: 0057456 2/2000
Fecha (NCH): 2000-12-22 16:15:12
Trámite: 132 PATENTES D. 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC.
Dependencia: 2120 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Folios: 36

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social JOHNSON & JOHNSON CONSUMER COMPANIES, INC.

No. de Identificación _____

Representante Legal (Persona Jurídica) _____

País de Domicilio ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA

Departamento o Estado NEW JERSEY

Dirección Gordonview Road, Skillman, New Jersey, 08558

Ciudad SKILLMAN Teléfono _____

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre JIMENA ESCOBAR URIBE

Dirección y Domicilio GRA. 11A No. 84-78, OFICINA 305

Ciudad BOGOTÁ, D.C. Teléfono 6 162031/61

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es) 1. SHUN Y. LIN; 2. KALPANA J. PATEL; 3. MARTIN LINK; 4. MARIA L. KANG.

Identificación _____

Dirección 1. PLAINSBORO, NEW JERSEY, E.U.A.; 2. WEST WINDSOR, NEW JERSEY, E.U.A.; 3. SARASOTA, FLORIDA, E.U.A.; 4. BELLE MEAD, NEW JERSEY, E.U.A.

Ciudad E.U.A. Teléfono _____

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención METODO PARA PREPARAR UNA PELICULA SOLUBLE EN AGUA.

PRIORIDAD REIVINDICADA sí ☒ NO ☐ TIPO DE PRIORIDAD ANDINA ☐ UNIONISTA ☒

(33) País ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA Fecha DICIEMBRE 23, 1999 (31) No. Solicitud 69/172.985
ESTADOS UNIDOS DE AMERICA ENERO 12, 2000 02/481.178

Para publicar a los ☒ 6 meses ☐ 12 meses ☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL A61 K 9/32 2418/P.

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

Proveer un método para preparar una película soluble en agua, el método comprende los pasos de (a) preparar una solución que comprende (i) un formador de película seleccionado del grupo que consiste en ácidos poliacrílicos, derivados de celulosa, óxido de polietileno, alcohol polivinílico, y cualquier combinación de los anteriores, (ii) un plastificante soluble en agua que tiene por lo menos un grupo hidroxilo, amido o amino y un punto de ebullición de más de alrededor de 150°C, (iii) un agente farmacéuticamente activo, y (iv) un solvente; (b) secar la solución a una temperatura de alrededor de 50 y aproximadamente 100°C para formar una película; y (c) curar la película a una temperatura de alrededor de 15 a aproximadamente 60°C y a una humedad relativa de por lo menos aproximadamente 30%.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica No. 18.247	☒
Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC No. 18.247	☒
Recibo de la tasa respectiva No. 76, 796	☒
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 propiedad 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


JIMENA ESCOBAR URIBE

C.C. 39.779.452 de Usaquén

T.P. No. 69.228

2418

2



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

NIT : 800176089-2

SE-INDUSTRIA Y COMERCIO
Eradicator : 63097406 63000000
Fecha (Acto) : 2005-12-22 16:06:30
Trámite : C-2 PATENTES D 1 REGISTRADO/ 311 PRESENTADO
Superintendencia: 2005 DIVISION DE RECURSOS ECONOMICOS

Folios: 3:

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 76,796
FECHA : DICIEMBRE 14 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
ESCOBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	2947523	8,497,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SOM: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

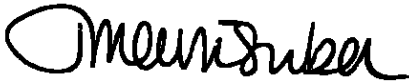
RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
e-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

Solicito expresamente a nombre de la sociedad
**JOHNSON & JOHNSON CONSUMER
COMPANIES, INC.**, sociedad constituida de
conformidad con las leyes de New Jersey,
domiciliada en Skillman, New Jersey, Estados
Unidos de América, el otorgamiento de Patente para
la invención titulada " MÉTODO PARA PREPARAR UNA
PELÍCULA SOLUBLE EN AGUA ".

Clase : A 61


JIMENA ESCOBAR URIBE
C.C. 39.779.452 de Usaquén
T.P. 68.228
Cod. 5376

METODO PARA PREPARAR UNA PELICULA SOLUBLE EN AGUA

Esta solicitud reclama la prioridad del documento de E.U.A número de serie 60/172,085, expedido el 23 de diciembre de 1999, que se
5 incorpora en la presente como referencia.

CAMPO DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a un método para preparar una
10 película soluble en agua para usarse en formas de dosificación unitarias, tales como tampones y aplicadores.

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

15 Las formas de dosificación vaginales actuales, excepto la esponja y la película, provocan ensuciamiento cuando se utilizan y escurren fácilmente de la vagina. Además, la esponja requiere remoción después de su uso y se cree que provoca infección. Las películas con frecuencia causan irritación debido a su rigidez y bordes afilados.

20 Las patentes de E.U.A. Nos. 5,393,528 y 5,529,782 describen un dispositivo que tiene un elemento que se puede disolver para administración de un material agente en un área interna del cuerpo. El elemento que se

puede disolver es un película hecha de alcohol polivinílico, óxido de polietileno, y/o un material de carbohidrato complejo.

BREVE DESCRIPCION DE LA INVENCION

5

La presente invención provee un método para preparar una película soluble en agua. El método comprende los pasos de (a) preparar una solución que comprende un formador de película, un plastificante soluble en agua, un agente farmacéuticamente activo, y un solvente; (b) secar la solución a una temperatura de alrededor de 50 a aproximadamente 100°C para formar una película; y (c) curar la película a una temperatura de alrededor de 15 a aproximadamente 60°C y a una humedad relativa de por lo menos aproximadamente 30%. El formador de película es un ácido poliacrílico, derivado de celulosa, óxido de polietileno, alcohol polivinílico, o cualquier combinación de los anteriores. El plastificante soluble en agua contiene por lo menos un grupo hidroxilo, amido o amino y tiene un punto de ebullición de más de aproximadamente 150°C. La película soluble en agua de la presente invención puede incorporarse en dispositivos vaginales, tales como tampones y aplicadores. La formulación de la película puede optimizarse como se conoce en la técnica para proveer liberación controlada del agente farmacéuticamente activo.

Este método produce una película uniforme y homogénea que es más flexible y escurre menos que las películas solubles en agua anteriores,

especialmente las que se incorporan en formas de dosificación vaginal. Como resultado, la película es menos irritante. Además, a diferencia de la mayoría de las películas solubles en agua de la técnica anterior, la película puede configurarse para proveer un área de contacto más grande dentro de una
5 cavidad del cuerpo, tal como la vagina, para poder incrementar el suministro de fármaco. La película tampoco provoca ensuciamiento.

Otra modalidad de la presente invención es una forma de dosis unitaria, tal como un tampón o aplicador, que comprende una película soluble en agua preparada mediante el método antes mencionado.

10

DESCRIPCION DETALLADA DE LA INVENCION

El método de la presente invención comprende los pasos de (a) preparar una solución que comprende un formador de película, un plastificante
15 soluble en agua, un agente farmacéuticamente activo, y un solvente; (b) secar la solución a una temperatura de alrededor de 50 a aproximadamente 100°C para formar una película, y (c) curar la película a una temperatura de alrededor de 15 y aproximadamente 60°C y a una humedad relativa de por lo menos aproximadamente 30%. Los inventores han descubierto que si la
20 película se cura bajo las condiciones antes mencionadas, se produce una película significativamente más flexible que escurre menos cuando se administra en la vagina y otras cavidades del cuerpo que la misma película

preparada sin curación. La película tampoco provoca ensuciamiento, es uniforme y homogénea.

La solución puede prepararse mezclando los ingredientes, si el agente farmacéuticamente activo es soluble en agua.

5 Los agentes farmacéuticamente activos insolubles en agua pueden dispersarse, preferiblemente de manera uniforme, en el solvente mediante cualquier método conocido en la técnica. Los otros ingredientes pueden agregarse antes o después de dispersar el agente farmacéuticamente activo.

10 El formador de película es un ácido poliacrílico, derivado de celulosa, óxido de polietileno, alcohol polivinílico, o cualquier combinación de los anteriores. Los derivados de celulosa adecuados incluyen, pero no se limitan a, hidroxietilcelulosa, carboximetilcelulosa, hidroxipropilcelulosa, hidroxipropilmetilcelulosa y cualquier combinación de los anteriores. El
15 formador de película es preferiblemente alcohol polivinílico. Muy preferiblemente, el formador de película es un alcohol polivinílico parcialmente hidrogenado, tal como Elvanol™ grado 51-05, 52-22, y 50-42 disponible de DuPont Co. de Wilmington, DE, y Airvol™ grado 205S y 523S disponible de Air Products & Chemicals, Inc., de Allentown, PA. La viscosidad del alcohol
20 polivinílico generalmente varía entre alrededor de 3 y aproximadamente 1000 cps y preferiblemente está en la escala de alrededor de 3 a aproximadamente 50 cps. La solución típicamente comprende de alrededor de 5 a aproximadamente 40% en peso y preferiblemente de alrededor de 15 a

aproximadamente 35% en peso del formador de película, con base en 100% en peso total de la solución.

El plastificante soluble en agua contiene por lo menos un grupo hidroxilo, amido, o amino y tiene un punto de ebullición de más de alrededor de 150°C. De manera preferida, el punto de ebullición del plastificante es de más de alrededor de 180°C. Los plastificantes adecuados incluyen, pero no se limitan a, compuestos polihidroxi, tales como propilenglicol, polietilenglicol, glicerina, y cualquier combinación de los anteriores. Otros plastificantes adecuados incluyen, pero no se limitan a, derivados de ácido graso que tienen un punto de fusión de menos de alrededor de 45°C, tales como aceite vegetal hidrogenado disponible como Wecobee™ de Stepan Company de Northfield, IL, y coco-glicéridos hidrogenados disponibles como Witpsol H15™ de Hüls America de Somerset, N.J.; y derivados de alcohol graso que tienen un valor hidroxilo de más de alrededor de 30. La solución típicamente comprende de alrededor de 0.1 a aproximadamente 10% en peso y preferiblemente de alrededor de 0.5 a aproximadamente 5% en peso de plastificante soluble en agua, con base en el 100% de peso total de la solución.

El agente farmacéuticamente activo puede ser insoluble en agua o soluble en agua. Los agentes farmacéuticamente activos adecuados incluyen, pero no se limitan a, agentes antifúngicos de imidazol, dichos agentes antifúngicos de imidazol incluyen pero no se limitan a, miconazol, econazol, terconazol, ketoconazol, saperconazol, itraconazol, clotrimazol, tioconazol y butaconazol; agentes antibacterianos, tales como nistatina,

neomicina, polimicina, tetraciclina, clindamicina y metronidazol; agentes antisépticos, tales como benzoato de oxiquinolina y aminacrina; hormonas, tales como estrógenos, testolactona, andrógenos, progestinas, acetato de megestrol, acetato de medroxiprogesterona, estrógenos esterificados, 5 estrógenos conjugados, estradiol, poliestradiol, etinilestradiol, estropipato, difosfato de dietilestilbestrol, fosfato de poliestradiol, y acetato de leuprolido; agentes antiinflamatorios, hidrocortisona, triamcinolona, betametasona, flucinonida, y halcinonida; anestésicos, tales como lidocaína y benzocaína; espermicidas, tales como nonoxinol-9 y octoxinol-9; y cualquier combinación 10 de los anteriores. Un agente antifúngico preferido es el nitrato de miconazol. Un agente antibacteriano preferido es metronidazol. Un espermicida preferido es nonoxinol-9.

En general, la cantidad de agente farmacéuticamente activo en la solución es una cantidad efectiva para lograr el propósito para el cual es 15 utilizado. La cantidad de agente farmacéuticamente activo es típicamente una cantidad farmacéuticamente activa. Sin embargo, la cantidad puede ser menos que una cantidad farmacéuticamente activa cuando la película se utiliza en una forma de dosificación unitaria, debido a que la forma de dosificación unitaria puede comprender una multiplicidad de películas o puede 20 comprender una cantidad farmacéuticamente efectiva dividida. La cantidad total efectiva puede determinarse en unidades acumulativas que contienen, en total, una cantidad farmacéuticamente efectiva de agente farmacéuticamente activo. La cantidad total de agente farmacéuticamente activo puede

determinarse por el experto en la técnica. En general, la solución comprende de alrededor de 1 a aproximadamente 30% en peso y preferiblemente de alrededor de 5 a aproximadamente 20% en peso de agente farmacéuticamente activo, con base en 100% en peso total de la solución.

5 El solvente puede ser agua, etanol, glicerina, etilenglicol, amidas, aminas, o cualquier combinación de los anteriores. El solvente es preferiblemente agua o una mezcla de agua y etanol. De manera preferida, la mezcla comprende menos de alrededor de 30% en peso de etanol, con base en 100% en peso total de la mezcla. La solución típicamente comprende de
10 alrededor de 20 a aproximadamente 90% en peso y preferiblemente de alrededor de 40 a aproximadamente 80% en peso de solvente, con base en 100% en peso total de la solución.

De acuerdo con una modalidad preferida de la presente invención, la solución comprende alrededor de 26.4% en peso de alcohol
15 polivinílico, alrededor de 2.4% en peso de glicerina, alrededor de 11.2% en peso de nonoxinol-9, y aproximadamente 60% en peso de agua, con base en el 100% en peso total de la solución.

La solución puede incluir otros auxiliares, tales como agentes tensioactivos, conservadores, incrementadores de viscosidad, colorantes,
20 fragancias, saborizantes, lubricantes, llenadores, aglutinantes, agentes humectantes, agentes de penetración, ajustadores de pH, desintegradores, excipientes, o cualquier combinación de los anteriores. Los agentes tensioactivos preferidos incluyen pero no se limitan a, éter polietilenglicólico de

alcohol cetearílico, tal como cetareth-20; cocoglicéridos hidrogenados; y cualquier combinación de los anteriores.

La solución típicamente tiene una viscosidad de alrededor de 15,000 a aproximadamente 30,000 cps a temperatura ambiente antes de
5 secar. En general, la película soluble en agua preparada por el método de la presente invención tiene un espesor de alrededor de 0.03 a aproximadamente 0.50 mm. De manera preferida, el espesor de la película es de alrededor de 0.05 a aproximadamente 0.10 mm.

El paso de secado se lleva a cabo generalmente a una
10 temperatura de alrededor de 50 a aproximadamente 100°C. De manera preferida, el paso de secado se realiza en dos etapas. En la primera etapa, la solución se calienta a alrededor de 50 y aproximadamente 70°C. La solución en la primera etapa se calienta típicamente durante menos de alrededor de 5 minutos. Después la solución se calienta a alrededor de 70 y alrededor de
15 100°C durante la segunda etapa. La solución en la segunda etapa es típicamente calentada durante menos de alrededor de 25 minutos.

De manera preferida, el paso de curación se lleva a cabo inmediatamente después del paso de secado. La curación se realiza generalmente a una temperatura de alrededor de 15 y aproximadamente 60°C
20 y a una humedad relativa de por lo menos 30%. De manera preferida, el paso de curación se lleva a cabo a una temperatura de alrededor de 25 a aproximadamente 60°C. El paso de curación se realiza preferiblemente a una humedad relativa de por lo menos 50% y muy preferiblemente a una humedad

relativa de alrededor 60 y aproximadamente 90%. La solución puede secarse y curarse con un túnel de secado que tiene zonas o cámaras múltiples, tal como un túnel de secado de 5, 6 ó 7 zonas.

Una película soluble en agua preferida preparada por el método de la presente invención comprende alrededor de 66% en peso de alcohol polivinílico, alrededor de 6% en peso de glicerina, y alrededor de 28% en peso de nonoxinol 9, con base en el 100% en peso total de la película soluble en agua.

La película soluble en agua puede recubrirse o laminarse en un substrato, tal como una fibra no tejida o algodón, vertiendo o vaciando la solución en el substrato y luego secando y curando la solución como se describió con anterioridad. El vaciado puede llevarse a cabo mediante cualquier método conocido en la técnica, tal como mediante un recipiente para pesar, charola de acero inoxidable, barra de teflón, barra en forma de cono, y rodillo inverso.

La película soluble en agua sola o recubierta o laminada sobre un substrato puede incorporarse en una forma de dosificación unitaria para administración en una cavidad del cuerpo, tal como la vagina, el recto y la boca. La forma de dosificación unitaria puede ser un tampón o un aplicador. Por ejemplo, la película recubierta sobre un substrato puede utilizarse como un forro para un tampón. La forma de dosificación unitaria es preferiblemente flexible. La forma de dosificación unitaria puede tener cualquier forma, tal como una hoja plana o forma de dedal. De manera preferida, la película está

contorneada para llevar al máximo su área de contacto con la cavidad del cuerpo para la que pretende administrarse.

De acuerdo con una modalidad, la envoltura externa del tampón comprende fibra no tejida laminada con la película soluble en agua. De acuerdo con otra modalidad, la película soluble en agua se coloca entre el material interno de un tampón, tal como algodón, y una cubierta externa, tal como un material de fibra no tejida.

Una forma de dosificación unitaria de la presente invención que contiene un agente antifúngico, tal como miconazol, puede administrarse para tratar infecciones por levadura. Es posible tratar una infección por levadura en 3 días, en vez del periodo común de 5 días, con una forma de dosificación unitaria de la presente invención, debido a que una película preparada mediante el método de la presente presenta muy poco escurrimiento y puede tener una liberación controlada del agente antifúngico.

La película puede formularse para ser resistente a la ruptura y resistente al desgarro. Además, la película puede formularse para lograr velocidades de liberación deseadas del agente farmacéuticamente activo como se conoce en la técnica.

Los siguientes ejemplos se diseñaron para describir la presente invención sin limitación.

EJEMPLOS 1-32

Las películas solubles en agua que tienen las formulaciones del cuadro 1 se prepararon como sigue. Se calentó agua a 50-80°C. El formador de película, es decir, alcohol polivinílico, se agregó al agua con mezclado constante. El ingrediente activo, es decir, nonoxinol-9, se agregó a la solución con mezclado constante. La solución se mezcló, se le evacuó el aire, y se enfrió a temperatura ambiente. La solución se recubrió en un sustrato en el dispositivo de vaciado indicado en el cuadro 1 posterior. El sustrato para los ejemplos 1-8 fue polipropileno. El sustrato para los ejemplos 9-18 y 32 fue acero inoxidable. El sustrato para los ejemplos 19-25 fue poliéster. El sustrato para los ejemplos 26-28 fue teflón. El sustrato para el ejemplo 29 fue un forro de poliéster. El sustrato para el ejemplo 30 fue aclar con forro de aluminio. El sustrato para el ejemplo 31 fue polietileno y forro de papel.

La solución se secó en un túnel de secado de zonas múltiples para formar una película. En los ejemplos 1-28 y 31, la solución se secó a una temperatura de alrededor de 80-90°C durante menos de 30 minutos. En los ejemplos 29 y 30, la solución se secó primero a una temperatura de alrededor de 60-75°C durante menos de alrededor de 8 minutos y luego se secó a una temperatura de 75-90°C durante menos de alrededor de 15 minutos. En el ejemplo 32, la solución se secó primero a una temperatura de alrededor de 60-80°C durante menos de aproximadamente 5 minutos y luego se secó a una

temperatura de alrededor de 70-90°C durante menos de aproximadamente 25 minutos.

Después de secar, la película se curó con humedad a una humedad relativa de alrededor de 30-60% y a aproximadamente temperatura ambiente. Para los ejemplos 29 y 32, la película se curó con humedad a una humedad relativa de alrededor de 60-90% y a una temperatura de aproximadamente 40-60°C.

El espesor de la película se midió. Los resultados se muestran en el cuadro 1 a continuación.

CUADRO 1

5

10

15

Ejemplo	Dispositivo de vaciado	Nonoxinol-9 (% en peso)	Alcohol polivinílico (<60 cps) (% en peso)	Alcohol polivinílico (<30 cps) (% en peso)	Alcohol polivinílico (<10 cps) (% en peso)	Plastificante (% en peso)	Espesor de película seca (mm)
1	Recipiente para pesar	33 33	33 33	-	-	33 33% PG	0 3
2	Recipiente para pesar	33 33	33 33	-	-	33 33% PEG 300	0 3
3	Recipiente para pesar	33 33	50 00	-	-	16 67% PEG 300	0 45
4	Recipiente para pesar	33 33	58 33	-	-	8 33% Glicerina	0 3
5	Recipiente para pesar	33 33	41 67	-	-	25 00% Glicerina	0 1
6	Recipiente para pesar	33 33	50 00	-	-	16 67% Glicerina	0 1
7	Recipiente para pesar	33 33	50 00	-	-	16 67% PG	0 2
8	Recipiente para pesar	33 33	41 67	-	-	25 00% PG	0 1
9	Bandeja de acero inoxidable	33 00	58 67	-	-	8 33% Glicerina	0 07
10	Bandeja de acero inoxidable	33 33	63 33	-	-	3 33% Glicerina	0 05
11	Bandeja de acero inoxidable	33 33	58 33	-	-	8 33% PEG 300	-
12	Bandeja de acero inoxidable	33 33	58 67	-	-	8 33% PG	0 06
13	Bandeja de acero inoxidable	27 78	69 44	-	-	2 78% Glicerina	-
14	Bandeja de acero inoxidable	33 33	-	-	58 33	8 33% Glicerina	0 06
15	Bandeja de acero inoxidable	32 79	-	-	49 18	18 03% Glicerina	0 07
16	Bandeja de acero inoxidable	33 33	-	-	41 67	25 00% Glicerina	-
17	Bandeja de acero inoxidable	33 33	-	-	63 33	3 33 Glicerina	0 07
18	Bandeja de acero inoxidable	28 33	-	-	68 00	3 67% Glicerina	-
19	Recurso I*	33 33	-	58 33	-	8 33% Glicerina	-
20	Recurso I*	33 11	-	62 913	-	3 97% Glicerina	-
21	Recurso I*	33 33	-	49 50	-	17 16 Glicerina	-

17

CUADRO 1 (CONTINUACION)

Ejemplo	Dispositivo de vaciado	Nonoxinol-9 (% en peso)	Alcohol polivinílico (<80 cps) (% en peso)	Alcohol polivinílico (<30 cps) (% en peso)	Alcohol polivinílico (<10 cps) (% en peso)	Plastificante (% en peso)	Espesor de película seca (mm)
5	22	Recurso I*	33 33	-	-	63 35	3 33% Glicerina
	23	Recurso I*	33 33	50 00	-	-	16 33% PEG 300
	24	Recurso I*	33 33	58 33	-	-	8 33% PEG 300
	25	Recurso I*	33 33	63 33	-	-	3 33% PEG 300
	26	Barra de teflón, dedal	33 33	-	-	-	3 33% Glicerina
10	27	Barra en forma de cono, dedal	31 58	-	-	-	3 16% Glicerina & 5 26% H-15
	28	Barra en forma de cono, dedal	30 51	-	-	57 97	3 05% Glicerina & 8 47% H-15
	29	Rodillo Inverso, Rampa ascendente, con forro de poliéster	33 33	-	-	63 33	3 33% Glicerina
	30	Rodillo Inverso, Rampa ascendente, con Aclar y forro de aluminio	33 33	-	-	63 38	3 30% Glicerina
	31	Cuchilla sobre rodillo, Rampa ascendente, con polietileno y forro de papel	28 00	-	-	67 00	5 00% Glicerina
15	32	Extrusión, Rampa ascendente, con portador de superficie de acero inoxidable	28 00	-	-	67 00	5 00% Glicerina

* - Recurso I es un dispositivo de vaciado para soluciones disponible de Byk-Gardner Instruments de Silver Spring, MD.

El alcohol polivinílico es un alcohol polivinílico soluble en agua, tal como Elvanol™ disponible de DuPont Co. de Wilmington, DE, o Airvol™ disponible
5 de Air Products & Chemicals, Inc., de Allentown, PA.

PG es propilenglicol.

PEG 300 es polietilenglicol que tiene un promedio de 300 unidades de repetición de óxido de etileno.

H-15 es Witepsol H-15, que es coco-glicéridos hidrogenados y está disponible
10 de Hüls America de Somerset, NJ.

La velocidad de liberación de nonoxinol-9 de las películas preparadas y VCF® disponible de Apothecus Pharmaceutical Corp. de Oyster Bay, NY, en un regulador de pH de fosfato de citrato que tiene un pH de 4.0, se determinó por el método de canasta USP (Sección <711> del Método de
15 Farmacopea de Estados Unidos). Los resultados se muestran en el cuadro 2 posterior. El tiempo para alcanzar la meseta es el tiempo después del cual no hay incremento importante en la velocidad de liberación.

CUADR 2

	Formulación	Tiempo de para alcanzar la meseta (minutos)	Velocidad de liberación (% en peso por minuto)
5	VCF [®]	15-20	5.45
	Ejemplo 6	50-60	2.59
	Ejemplo 7	50-60	3.76
	Ejemplo 9	40-50	2.33
	Ejemplo 10	40-50	2.97
10	Ejemplo 12	40-50	3.15
	Ejemplo 14	10-15	6.08
	Ejemplo 15	10-15	6.66
	Ejemplo 17	10-15	6.01
	Ejemplo 19	15-20	5.82
15	Ejemplo 20	30-40	4.33
	Ejemplo 21	30-40	3.93
	Ejemplo 22	10-15	6.10
	Ejemplo 23	40-50	2.34
	Ejemplo 24	30-40	2.72
20	Ejemplo 25	30-40	2.76
	Ejemplo 26	10-15	7.23
	Ejemplo 27	5-10	8.47
	Ejemplo 28	5-10	8.89
	Ejemplo 29	<15	>6.0
	Ejemplo 30	<15	>6.0
	Ejemplo 31	<15	>6.0
	Ejemplo 32	<15	>16

EJEMPLOS 33-42

Las películas solubles en agua que tienen las formulaciones del cuadro 3 se prepararon como se describen en los ejemplos 1-32. En los
5 ejemplos 33-41, la solución se secó a una temperatura de aproximadamente 60-90°C durante menos de alrededor de 30 minutos. En el ejemplo 42, la solución se secó primero a una temperatura de alrededor de 60-75°C durante menos de alrededor de 8 minutos y luego se secó a una temperatura de alrededor de 75-90°C durante menos de alrededor de 15 minutos. Después de
10 secar, la película se curó con humedad a una humedad relativa de alrededor de 30-60% y a aproximadamente temperatura ambiente.

El sustrato para los ejemplos 33-35 fue poliéster. El sustrato para los ejemplos 36-41 fue poliéster y fibra no tejida. El sustrato para el ejemplo 42 fue una fibra y forro de poliéster.

15 La velocidad de liberación de nitrato de miconazol de las películas preparadas en un regulador de fosfato de citrato teniendo un pH de 4.0, se determinó por el método USP basket para los ejemplos 33-35 y por mediante el siguiente método USP modificado para los ejemplo 36-38, 40, y 41. Una membrana de diálisis con corte de peso molecular y diámetro
20 conocidos se utilizó en vez de una canasta de malla para retener las muestras de prueba. La membrana limitó la cantidad de medio de disolución que tuvo contacto con la capa de liberación o composición. Este procedimiento de disolución modificado se diseñó para simular un ambiente vaginal en donde

sólo cantidades limitadas de un medio típicamente se ponen en contacto con la composición. Cada capa de liberación y composición se probó en un medio acuoso y un medio acuoso regulado, que se mantuvo a un pH de alrededor de 4.

5 Los resultados se muestran en el cuadro 3 a continuación.

CUADRO 3

	Ejemplo	Dispositivo de vaciado	Alcohol polivinílico (<30 cps) (% en peso)	Plastificante (% en peso)	Nitrato de miconazol (% en peso)	Velocidad de liberación
5	33	Recurso I	36.2	18.4% Glicerina & 9.2% EB2	36.2	3.3% /min
	34	Recurso I	40.0	19.9% Glicerina	40.1	4.7%/min
	35	Recurso I	38.0	19.0% Glicerina & 4.8% EB2	38.2	4.7%/min
	36	Recurso I & fibra	36.2	18.4% Glicerina & 9.2% EB2	36.2	3.50%/hr
10	37	Recurso I & fibra	34.7	17.3% Glicerina & 13.2% EB2	34.8	3.13%/hr
	38	Recurso I & fibra	38.0	19.0% Glicerina & 5.0% EB2	38.0	3.33%/hr
	39	Recurso I & fibra	39.6	20.6 Glicerina	39.8	-
	40	Recurso I, fibra & Tampón OB	34.7	17.3% Glicerina & 13.2% EB2	34.8	0.81%/hr
15	41	Recurso I, fibra & Tampón OB	38.0	19.0% Glicerina & 5.0% EB2	38.0	1.07%/hr
20	42	Rodillo inverso, Rampa ascendente, Fibra & Forno de poliéster	38.1	19.1% Glicerina & 4.17% EB2	38.1	-

EB es Eumulgin B2, que es ceteareth-20 y está disponible de Henkel Corp. de Hoboken, NJ.

El alcohol polivinílico es un alcohol polivinílico soluble en agua, tal como Elvanol™ disponible de DuPont Co. de Wilmington, DE, o Airvol™
5 disponible de Air Products & Chemicals, Inc., de Allentown, PA.

EJEMPLO 43-46

Las películas solubles en agua que tienen las formulaciones del
10 cuadro 4 se prepararon como se describe en los ejemplos 1-32. En los ejemplos 43-46, la solución se secó a una temperatura de alrededor de 60-90°C durante menos de alrededor de 30 minutos. Después de secar, la película se curó con humedad a una humedad relativa de alrededor de 30-60% y a aproximadamente temperatura ambiente. El substrato para los
15 ejemplos 43-46 fue poliéster.

El tiempo para la velocidad de disolución para alcanzar la meseta se determinó como se discutió con anterioridad.

Los resultados se muestran en el siguiente cuadro 4.

CUADRO 4

5

10

Ejemplo	Dispositivo de vaciado	Polímero (% en peso)	Plastificante (% en peso)	Metronidazol (% en peso)	Disolución (tiempo para alcanzar la meseta) (min)
43	Recurso I	67.2% PVA 52-22	21.7% PEG 400	11.1	20-30
44	Recurso I	58.22% PVA 52-22	18.9% PG & 15.7% EB2	7.2	20-30
45	Recurso I	34.9% PVA 52-22 y 11.7% PVA 71-30	20.9% PG & 17.5% EB	15.0	10-15
46	Recurso I	46.6% HPMC E50LV	20.9% PG & 17.5% EB2	15.0	5-10

- PG es propilenglicol
- PEG es polietilenglicol
- EB2 es Eumulgin B2, que es ceteareth-20 y está disponible de Henkel Corp. de Hoboken, NJ.
- 15 PVA es un alcohol polivinílico soluble en agua, tal como Elvanol™ disponible de DuPont Co. de Wilmington, DE o Airvol™ disponible de Air Products & Chemicals, Inc., de Allentown, PA.
- HPMC es hidroxipropilmetilcelulosa

20

EJEMPLO 47

Una película soluble en agua que tiene la formulación del cuadro 5 se preparó como se indica a continuación. Glicerina y nonoxinol-9 se

agregaron en agua fría y se mezclaron hasta volverse uniforme. La solución se calentó a aproximadamente 60-80°C y el formador de película, es decir alcohol polivinílico, se agregó bajo mezclado constante. La solución se mezcló, se le evacuó el aire y se enfrió a aproximadamente temperatura ambiente. La solución se recubrió en una superficie de acero inoxidable con un espesor de cinta de 0.01 a 0.03 cm. La solución se secó en un túnel de secado de zonas múltiples a una temperatura de alrededor de 60-90°C durante menos de aproximadamente 30 minutos para formar una película. Luego, se curó la película con humedad a una humedad relativa de alrededor de 65-90% y a una temperatura de alrededor de 40-80°C.

CUADRO 5

	Ingrediente	% en peso
	Alcohol polivinílico (5 cps)	66.0
15	Glicerina	6.0
	Nonoxinol-9	28.0

Todas las patentes, publicaciones, solicitudes, y métodos de prueba mencionados con anterioridad se incorporan en la presente como referencia. Muchas variaciones de la presente serán sugeridas a los expertos en la técnica a la luz de la descripción detallada anterior. Todas dichas variaciones obvias están dentro del alcance patentado de las reivindicaciones anexas.

NOVEDAD DE LA INVENCION

REIVINDICACIONES

5 1.- Un método para preparar una película soluble en agua, el
método comprende los pasos de (a) preparar una solución que comprende (i)
un formador de película seleccionado del grupo que consiste en ácidos
poliacrílicos, derivados de celulosa, óxido de polietileno, alcohol polivinílico, y
cualquier combinación de los anteriores, (ii) un plastificante soluble en agua
10 que tiene por lo menos un grupo hidroxilo, amido o amino y un punto de
ebullición de más de alrededor de 150°C, (iii) un agente farmacéuticamente
activo, y (iv) un solvente; (b) secar la solución a una temperatura de alrededor
de 50 y aproximadamente 100°C para formar una película; y (c) curar la
película a una temperatura de alrededor de 15 a aproximadamente 60°C y a
15 una humedad relativa de por lo menos aproximadamente 30%.

2.- El método de conformidad con la reivindicación 1,
caracterizado además porque la solución tiene una viscosidad de alrededor de
15,000 a aproximadamente 30,000 cps a temperatura ambiente antes de
secar.

20 3.- El método de conformidad con la reivindicación 1,
caracterizado además porque el formador de película es alcohol polivinílico.

4.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el formador de película es un alcohol polivinílico parcialmente hidrogenado.

5 5.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el plastificante es un compuesto polihidroxi.

6.- El método de conformidad con la reivindicación 5, caracterizado además porque el plastificante se selecciona del grupo que consiste en propilenglicol, polietilenglicol, glicerina, y cualquier combinación de los anteriores.

10 7.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el agente farmacéuticamente activo se selecciona de agentes antifúngicos de imidazol, agentes antibacterianos, agentes antisépticos, hormonas, agentes antiinflamatorios, anestésicos, espermicidas, y cualquier combinación de los anteriores.

15 8.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el agente farmacéuticamente activo es nonoxinol-9.

20 9.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el agente farmacéuticamente activo es miconazol.

10.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el agente farmacéuticamente activo es metronidazol.

11.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el solvente se selecciona del grupo que consiste en agua, etanol, glicerina, etilenglicol, amidas, aminas y cualquier combinación de los anteriores.

5. 12.- El método de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado además porque el solvente es agua.

13.- El método de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado además porque el solvente es una mezcla de agua y etanol.

10 14.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque la solución comprende de alrededor de 5 a aproximadamente 40% en peso de formador de película, con base en el 100% en peso total de la solución.

15 15.- El método de conformidad con la reivindicación 14, caracterizado además porque la solución comprende de alrededor de 15 a aproximadamente 35% en peso de formador de película, con base en el 100% en peso total de la solución.

16.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque la solución comprende de alrededor de 0.1 a aproximadamente 10% en peso de plastificante, con base en el 100% en peso
20 total de la solución.

17.- El método de conformidad con la reivindicación 16, caracterizado además porque la solución comprende de alrededor de 0.5 a

aproximadamente 5% en peso de plastificante, con base en el 100% en peso total de la solución.

18.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque la solución comprende una cantidad
5 farmacéuticamente efectiva de agente farmacéuticamente activo.

19.- El método de conformidad con la reivindicación 18, caracterizado además porque la solución comprende de alrededor de 1 a aproximadamente 30% en peso de agente farmacéuticamente activo, con base en el 100% en peso total de la solución.

10 20.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque la solución comprende de alrededor de 20 a aproximadamente 90% en peso de solvente, con base en el 100% en peso total de la solución.

21.- El método de conformidad con la reivindicación 1,
15 caracterizado además porque la solución comprende (a) alrededor de 26.4% en peso de alcohol polivinílico; (b) alrededor de 2.4% en peso de glicerina; (c) alrededor de 11.2% en peso de nonoxinol 9; y (d) alrededor de 60% en peso de agua, con base en el 100% en peso total de la solución.

22.- El método de conformidad con la reivindicación 1,
20 caracterizado además porque la película soluble en agua también comprende (i) una agente tensioactivo, (ii) un conservador, (iii) un incrementador de viscosidad, (iv) un colorante, (v) una fragancia, (vi) un saborizante, (vii) un lubricante, (viii) un llenador, (ix) un aglutinante, (x) un agente humectante, (xi)

un agente de penetración, (xii) un ajustador de pH, (xiii) un desintegrador, (xiv) un excipiente, o (xv) cualquier combinación de los anteriores.

23.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el paso de secado comprende (i) calentar la
5 solución a alrededor de 50 y aproximadamente 70°C; y (ii) calentar la solución a alrededor de 70 y aproximadamente 100°C.

24.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el paso de curación se lleva a cabo a una temperatura de alrededor de 25 a aproximadamente 60°C.

10 25.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el paso de curación se lleva a cabo a una humedad relativa de por lo menos aproximadamente 50%.

26.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el paso de curación se lleva a cabo a una
15 humedad relativa de alrededor de 60 a aproximadamente 90%.

27.- El método de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque la película soluble en agua tiene un espesor de alrededor de 0.03 a aproximadamente 0.50 mm.

28.- El método de conformidad con la reivindicación 1,
20 caracterizado además porque el paso (a) consiste en (i) preparar una solución que comprende (i) un formador de película seleccionado del grupo que consiste en ácidos poliacrílicos, derivados de celulosa, óxido de polietileno, alcohol polivinílico, y cualquier combinación de los anteriores, (ii) un

plastificante soluble en agua que tiene por lo menos un grupo hidroxilo, amido o amino y un punto de ebullición de más de alrededor de 150°C, (iii) un agente farmacéuticamente activo, y (iv) un solvente; y (ii) verter o vaciar la solución en un substrato.

5 29.- El método de conformidad con la reivindicación 28, caracterizado además porque el substrato es algodón o fibra no tejida.

30.- Una película soluble en agua preparada mediante el método de conformidad con la reivindicación 1.

10 31.- Una forma de dosificación unitaria que tiene una película soluble en agua preparada mediante el método de conformidad con la reivindicación 1.

32.- Un tampón que tiene una película soluble en agua preparada mediante el método de conformidad con la reivindicación 1.

15 33.- Un aplicador que tiene una película soluble en agua preparada mediante el método de conformidad con la reivindicación 1.

RESUMEN DE LA INVENCION

La presente invención provee un método para preparar una película soluble en agua; el método consiste en (a) preparar una solución que
5 comprende un formador de película, un plastificante soluble en agua, un agente farmacéuticamente activo, y un solvente; (b) secar la solución a una temperatura de alrededor de 50 y aproximadamente 100°C para formar una película; y (c) curar la película a una temperatura de alrededor de 15 a aproximadamente 60°C y a una humedad relativa de por lo menos 30%; el
10 formador de película es un ácido poliacrílico, derivados de celulosa, óxido de polietileno, alcohol polivinílico o cualquier combinación de los anteriores; el plastificante soluble en agua contiene por lo menos un grupo hidroxilo, amido o amino y tiene un punto de ebullición de más de alrededor de 150°C; la película soluble en agua de la presente invención puede incorporarse en
15 dispositivos vaginales, tales como tampones y aplicadores; este método produce una película uniforme y homogénea que es más flexible y escurre menos que las películas solubles en agua anteriores, especialmente las que se incorporan en formas de dosificación vaginales; como resultado, la película es menos irritante; además, a diferencia de la mayoría de las películas
20 solubles en agua de la técnica anterior, la película puede configurarse para proveer un área de contacto mayor dentro de una cavidad del cuerpo, tal como la vagina, para poder incrementar el suministro de fármaco; la película tampoco provoca ensuciamiento.

PG/osu*jtc*pbg*kra*

P00/1858

RESUMEN DE LA INVENCION

La presente invención provee un método para preparar una película soluble en agua; el método consiste en (a) preparar una solución que
5 comprende un formador de película, un plastificante soluble en agua, un agente farmacéuticamente activo, y un solvente; (b) secar la solución a una temperatura de alrededor de 50 y aproximadamente 100°C para formar una película; y (c) curar la película a una temperatura de alrededor de 15 a aproximadamente 60°C y a una humedad relativa de por lo menos 30%; el
10 formador de película es un ácido poliacrílico, derivados de celulosa, óxido de polietileno, alcohol polivinílico o cualquier combinación de los anteriores; el plastificante soluble en agua contiene por lo menos un grupo hidroxilo, amido o amino y tiene un punto de ebullición de más de alrededor de 150°C; la película soluble en agua de la presente invención puede incorporarse en
15 dispositivos vaginales, tales como tampones y aplicadores; este método produce una película uniforme y homogénea que es más flexible y escurre menos que las películas solubles en agua anteriores, especialmente las que se incorporan en formas de dosificación vaginales; como resultado, la película es menos irritante; además, a diferencia de la mayoría de las películas
20 solubles en agua de la técnica anterior, la película puede configurarse para proveer un área de contacto mayor dentro de una cavidad del cuerpo, tal como la vagina, para poder incrementar el suministro de fármaco; la película tampoco provoca ensuciamiento.

PG/osu*jtc*pbg*kra*

P00/1858

Reirado folio, 34
por publicación
202050
Oct 15 2002.

Folios 35 y 36
tarjetas
G

REQUISITOS MINIMOS PARA /

Radicación: 13097466 0300049 Folios: 35
Fecha (C/D): 2020-12-22 16:05:22
Trámite: 032 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESEVTC
Dependencia: 2020 DIVISION DE CLAVES ENECEN 22

PATENTE DE INVENCION [✓]

MODELO DE UTILIDAD []

- Indicación de que se solicita la concesión de una patente [✓]
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [✓]
- Descripción de la invención [✓]
- Dibujos de ser estos pertinentes []
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas [✓]

COMPLETA [✓]

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud. []
- Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño. []
- Comprobante de pago de las tasas establecidas. []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

- Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de trazado. []
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud. []
- Representación gráfica del esquema de trazado []
- Comprobante de pago de las tasas establecidas. []

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha: _____

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador: 334 12 21-23-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@ic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia



35

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

INFORME DE PROTOCOLO

Expediente 00-97406.

Fecha: 21 de Marzo del 2001.

Se certifica que:

Desde fecha 2 de abril de 1998

del folio 97007 al folio 97012
del libro de Protocolo N° 334, obra el
poder N° 18247 conferido por JOHNSON
& JOHNSON CONSUMER COMPANIES, INC.

domiciliado(a) en Skillman,
New Jersey, Estados Unidos de América

al doctor JIMENA ESCOBAR URIBE Y/O
IGNACIO ESCOBAR URIBE

Facultad para desistir Si.

Revisado _____.

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 382 2695
E-mail: Info@sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

2020
Bogotá, D.C.

Doctora
JIMENA ESCOBAR URIBE
Apoderada

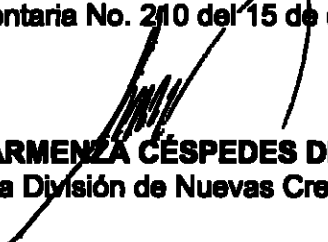
REFERENCIA:	Radicación No.	00-97406
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio No.	0819
	Folios	001

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica que:

- Debe allegar copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente otorgado por el inventor al solicitante o a su causante (art. 28-k, Dec 486/2000).
- El interesado debe informar la dirección del solicitante, debido a que en la solicitud no aparece la misma. (Art. 27-b, D 486/00).

En cumplimiento del artículo 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le requiere para que dentro del término de dos (2) meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el artículo 8 de la Resolución Reglamentaria No. 210 del 15 de enero del 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 29 MAR. 2001.

Se recuerda al interesado que debe presentar, dentro de los dieciséis meses siguientes contados a partir de la fecha de presentación de las solicitudes cuya prioridad se invoca, copia de las mismas certificadas por la autoridad que las expidió y, en los casos en que haya lugar, la traducción simple del capítulo reivindicatorio. El incumplimiento de éste plazo, acarreará la pérdida de la prioridad invocada.

202027/202022

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 382 2695
E-mail: Info@slc.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

~~Handwritten signature~~
29/09/2007