

RECIBIDA HOY 16-11-04.
DIVISION NVA CREACIONES

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 02062117 00000007 Folios: 7
Fecha (AMB): 2004-10-22 17:07:24
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRAL/ 329 COMPLETES
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.

REF: EXPEDIENTE 02-062-117

TÍTULO SOLICITADO: "Composiciones farmacéuticas y uso de las mismas"

PUBLICACIÓN: Gaceta 539 de 30-04-2004, número de publicación 80

SOLICITANTE: NOVARTIS AG

APODERADO: JIMENA ESCOBAR URIBE

TRÁMITE: SUSTENTACIÓN DE OPOSICIÓN

JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR, identificado como aparece al pie de mi firma, reconocido apoderado de las sociedades opositoras en el trámite de la referencia, estando dentro de los términos de la prórroga solicitada, por medio del presente escrito me permito ratificar y sustentar los argumentos del escrito principal de oposición, también radicado dentro del plazo de ley ante esa entidad.

I. RATIFICACIÓN

Reitero a su Despacho la solicitud de negar el beneficio patentario para la totalidad de las reivindicaciones contenidas en el expediente en referencia, por los argumentos que fueron expuestos en el escrito de oposición de 30/06/2004, en donde se ha explicado que las composiciones farmacéuticas reveladas en la solicitud colombiana CO 02-062-117 carecen de nivel inventivo, en primer término, por obra de la materia revelada en la publicación PCT WO01/52895 A1. Sobre este documento vale advertir que si bien es cierto que su fecha de publicación es posterior a la fecha de dos de las prioridades invocadas por la solicitud colombiana en trámite, no lo es menos que la fecha de prioridad de

aquella (20/01/2000) es anterior a las fechas de prioridad de la solicitud colombiana en trámite (20-07-2001; 04-12-2001 y 27-05-2002). Este hecho permite inferir que para la fecha de presentación de la solicitud prioritaria de la CO 02-062-117 ya se habían desarrollado y propuesto formulaciones farmacéuticas de esta naturaleza. El conocimiento de la materia revelada en este documento, combinado con otros documentos y anterioridades de la misma índole, en particular relacionados con el amplio conocimiento anterior de composiciones farmacéuticas de Terbinafina y su uso en el tratamiento de enfermedades fúngicas, permite reiterar que la solicitud que nos ocupa carece de Nivel Inventivo.

Es del caso reiterar que la mencionada publicación PCT WO01/52895 A1 ya revelaba composiciones farmacéuticas cuyo fin último es el de formular Terbinafina en composiciones farmacéuticas que permitan enmascarar el sabor de dicho principio activo.

II. COMPLEMENTO DE INFORMACIÓN

Ruego al Despacho tener en cuenta que antes de la fecha de prioridad de la presente solicitud existían en el estado de la técnica formulaciones farmacéuticas basadas en principios activos distintos a Terbinafina, que al igual que en este caso pretenden resolver el problema del sabor amargo de los mismos, hecho que ratifica la absoluta carencia de Nivel Inventivo de que adolece esta solicitud. Veamos:

1. EP 0 458 751 A1 "Delivery system for cyclic amino acids, with improved taste, texture and compressibility (17-05-1991):

Para resolver el problema del enmascaramiento del sabor, en el documento EP 0 458 751 A1, se ha propuesto presentar la Gabapentina en forma de partículas recubiertas con una primera capa hidrófila de un polímero insoluble en agua y de una segunda capa hidrófoba.

264
263

2. Solicitud colombiana en trámite 99-048-774 (Prioridad FR 98.10091 de agosto 3 de 1998) equivalente a publicación Internacional WO 00/07568 (Publicada 17-02-2000):

Esta solicitud propone un procedimiento de fabricación de partículas de un análogo del ácido γ -aminobutírico recubiertas -con una solución de recubrimiento que incluye al menos un polímero en al menos un disolvente orgánico-, que permite un contenido de lactama inferior al 0.5% con relación al peso del análogo de GABA, así mismo el recubrimiento con el polímero permite enmascarar el sabor sin retrasar su liberación.

En el caso de Gabapentina se logra el enmascaramiento del sabor sin alterar su liberación, mediante el empleo del polímero entre 60 y 80% en peso de la Gabapentina; con una proporción de polímero inferior al 60% no se consigue enmascarar de manera suficiente el sabor, con una porción superior al 80%, el sabor de la Gabapentina se enmascara perfectamente pero puede suceder que el principio activo no se libere con la suficiente rapidez.

Así mismo, para el caso de la Pregabalina, se logra en enmascaramiento del sabor sin alterar su liberación, mediante el empleo del polímero entre 15 y 30% en peso de Pregabalina, con una proporción de polímero inferior al 15% no se consigue enmascarar de manera suficiente el sabor, con una porción superior al 35%, el sabor de la Gabapentina se enmascara perfectamente pero puede suceder que el principio activo no se libere con la suficiente rapidez.

3. WO 96/13252 "Process for preparing solid pharmaceutical dosage forms":

Este documento fue publicado el 9 de mayo de 1996 y reivindica un proceso para la preparación de formas sólidas orales de rápida desintegración, basadas en una sustancia farmacéuticamente activa que presenta un sabor inaceptable. De igual manera, revela la forma de enmascarar el sabor persistente de un principio activo - como es el caso de Sildenafil -, sin sacrificar la solubilidad y rápida desintegración de la formulación obtenida.

La publicación comentada proporciona por vía general una propuesta alternativa a los problemas de sabor en formulaciones sólidas, incluyendo

265
264

desde luego al Sildenafil, mediante el uso de una forma de la sustancia farmacéuticamente activa que sea menos soluble en el agua, -por ejemplo la sustancia en su forma de base libre- ya que al ser suficientemente insoluble en este medio la sustancia sería insípida en la boca.

4. Solicitud Colombiana 99-030-493 desistida (Prioridad US 60/085.646 de mayo 15 de 1998) equivalente a la aplicación europea EP 0 960 621 A2 (Publicada 01-12-1999):

En la parte descriptiva de esta solicitud se menciona que, "(...) uno de los problemas con las formas de dosificación sólidas que se dispersan rápidamente, es que el paciente saboreará la sustancia farmacéuticamente activa cuando la forma de dosificación se desintegre en la boca."

Para algunas sustancias farmacéuticamente activas, el sabor, si sólo es ligeramente desagradable, se puede volver aceptable mediante el uso de agentes edulcorantes o agentes saborizantes para su enmascaramiento. Sin embargo esta técnica no enmascara completamente el sabor del citrato de Sildenafil. Otro camino para enmascarar el sabor es mediante microencapsulación, utilizando un revestimiento polimérico que protege mientras al ingrediente activo en la boca. (...).

EN CONCLUSIÓN

En las circunstancias narradas es evidente que no existe alternativa diferente para su Despacho que negar en su totalidad las reivindicaciones de la solicitud de patente de la referencia y ordenar, una vez cumplidas las instancias administrativas que correspondan, el archivo de la misma.

III. PRUEBAS

Además de las solicitadas en el escrito de oposición, y de aquellas que oficiosamente considere el despacho, ruego que se tengan como tales las siguientes:

366
265

- Copia de la primera página la aplicación europea EP 0 458 751 A1 (27 de noviembre de 1991).
- Copia de la primera página la aplicación internacional PCT WO 96/13252 (9 de mayo de 1996).

Señor Superintendente,



JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR

C.C. 79'152.473 de Usaquén
T.P. 44.655 de C.S.J.

267
266



⑪ Publication number : 0 458 751 A1

⑫

EUROPEAN PATENT APPLICATION

⑪ Application number : 91810300.6

⑪ Int. Cl.⁵ : A61K 31/195, A61K 9/54,
A61K 31/215

⑫ Date of filing : 17.05.91

⑬ Priority : 25.05.90 US 530768

⑭ Date of publication of application :
27.11.91 Bulletin 91/48

⑮ Designated Contracting States :
BE CH DE DK ES FR GB GR IT LI NL SE

⑯ Applicant : WARNER-LAMBERT COMPANY
281 Tabor Road
Morris Plains New Jersey 07060 (US)

⑰ Inventor : Cherukuri, Subraman Rao
19 Jean Drive
Towaco, New Jersey 07082 (US)
Inventor : Chau, Tommy Linkwong
3 Dartmouth Avenue-3A
Bridgewater, New Jersey 08807 (US)

⑱ Representative : Stibiger, Jakob, Dr.
c/o CAPSUGEL AG Fabrikstrasseweg 2-4
CH-4144 Arlesheim (CH)

⑲ Delivery system for cyclic amino acids with improved taste, texture and compressibility.

⑳ A new delivery system for cyclic amino acid compounds and the process for its preparation is disclosed, which has use in a variety of products including comestibles such as chewing gum compositions, confections, and pharmaceutical such as chewable tablets. More particularly, this invention relates to a process for preparing a delivery system that provides enhanced masking of the bitter flavour characteristic of the active, reduced grittiness, retained stability at the elevated temperatures of product formulation, and improved compressibility for formation into tablets.

EP 0 458 751 A1

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification 6 : A61K 9/20	A1	(11) International Publication Number: WO 96/13252 (43) International Publication Date: 9 May 1996 (09.05.96)
(21) International Application Number: PCT/GB95/02486 (22) International Filing Date: 20 October 1995 (20.10.95) (30) Priority Data: 9421837.7 28 October 1994 (28.10.94) GB (71) Applicant (for all designated States except US): R.P. SCHERER CORPORATION [US/US]; Suite 700, 2075 West Big Beaver Road, Troy, MI 48064 (US). (72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (for US only): YARWOOD, Richard, John [GB/GB]; 1 Thatchers View, Off Cuss Lane, Bishopcote, Wiltshire SN6 8PL (GB). KEARNEY, Patrick [GB/GB]; 59 Belsay, Toothill, Swindon, Wiltshire SN5 8HD (GB). THOMPSON, Andrew, Roy [GB/GB]; 1 Willowbrook, Purton, Swindon, Wiltshire SN5 8RJ (GB). (74) Agent: BOULT WADE TENNANT; 27 Fumival Street, London EC4A 1PQ (GB).		(81) Designated States: AM, AT, AU, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, HU, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LK, LR, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TT, UA, UG, US, UZ, VN, European patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO patent (KE, MW, SD, SZ, UG). Published <i>With international search report.</i>
(54) Title: PROCESS FOR PREPARING SOLID PHARMACEUTICAL DOSAGE FORMS		
(57) Abstract A process for the preparation of an oral solid rapidly disintegrating dosage form of a pharmaceutically active substance which has an unacceptable taste which process comprises forming a solution or a suspension in a solvent of a form of the pharmaceutically active substance which is less soluble in water and more palatable than the form with the unacceptable taste together with a water-soluble or water-dispersible carrier material, forming discrete units of the suspension or solution and removing the solvent from the discrete units under conditions whereby a network of the carrier material carrying a dosage of the less soluble and more palatable form of the pharmaceutically active substance is formed.		