

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 04-056813-00005-0000
Feb 2006-06-28 14:48:30 Dep 2020 NUECREACIONE
Trib 11 PATENTENYI
E-378 FASENACIONALII
Ad 328 COTONFORIACION F0815 4

REF: EXPEDIENTE 04-056-913

TÍTULO SOLICITADO: "COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS A BASE DE DERIVADOS DE AZETIDINA".

PUBLICACIÓN: Gaceta 559 de 30-12-2005, número de publicación 911

SOLICITANTE: AVENTIS PHARMA S.A.

PRIORIDAD: FR 01 16638 de Diciembre 21 de 2001.

APODERADO: GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO

TRÁMITE: SUSTENTACIÓN DE OPOSICIÓN

JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR, identificado como aparece al pie de mi firma, reconocido apoderado del opositor 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 definidos en el escrito de oposición del 28 de marzo de 2006.

En efecto, es evidente que la composición farmacéutica que comprende un derivado de azetidina eventualmente asociado con otro activo que potencia la

acción del compuesto de azetidina en un sistema que comprende un agente tensioactivo no iónico capaz de provocar la formación de un sistema coloidal y eventualmente un agente lipófilo que estabiliza la formulación, carece de nivel inventivo; veamos por partes cómo se conoce cada uno de los elementos que hace parte de la supuesta invención y de la que se pretende obtener privilegio de patente:

- a) Los artículos citados en el escrito de oposición, describen básicamente que los derivados de azetidina mencionados en la solicitud colombiana en trámite, dada su fuerte afinidad por los receptores de cannabinoides y particularmente por los receptores del tipo CB1, pueden ser adecuados en tratamientos como la obesidad o el control de la ingesta de alimentos.
- b) El segundo principio activo mencionado en la solicitud y que es capaz de potenciar los efectos del derivado de azetidina corresponde a Sibutramina, un conocido fármaco antiobesidad con acciones anorexígenas y termogénicas, que produce su efecto terapéutico por la inhibición en la recaptación de norepinefrina, serotonina y dopamina, el cual por poseer acciones farmacológicas parecidas a los derivados de azetidina, puede ser administrado al tiempo y puede causar un efecto sinérgico en la reducción del consumo de comida.
- c) La presencia de surfactantes no iónicos con carácter hidrofílico como son los glicéridos de polietilenglicol y de ácidos grasos saturados, especialmente, Labrasol®, Gélucire®, o Labrafil®/Labrasol®, capaces de solubilizar el principio activo -en este caso los derivados de azetidina-, formar un sistema coloidal y conseguir una formulación estable y biodisponible, son ampliamente conocidos en el estado del arte y considerablemente usados en formulaciones farmacéuticas con el fin de mejorar la biodisponibilidad de fármacos poco solubles -entre unos de sus aspectos de utilidad-.

En el artículo *"Effect of formulation on the rheology of Theophylline compound suspensions in Gelucires"*, de Ratsimbazafy V, Bourret E., publicado en J Pharm Pharmacol 1997 Sep; 49 (9): 852-7, se muestra anticipadamente que un agente tensioactivo no iónico de carácter hidrófilo -como Gelucire- es capaz de solubilizar un fármaco y es capaz de provocar la formación de un sistema coloidal, tal como se pretende proteger ahora en el capítulo reivindicatorio de la solicitud colombiana en trámite.

De igual manera, es importante recordar que en la patente americana US 2001/0012844 A1 "FORMULATIONS FOR HYDROPHOBIC PHARMACEUTICALS AGENTS" se evidencia la presencia de este tipo de agentes tensioactivos en formulaciones farmacéuticas líquidas, semisólidas o sólidas que mejoran la biodisponibilidad de oral de los agentes farmacéuticos hidrofóbicos que si bien es cierto no se refieren a azetidinas, no lo es menos que este documento revela composiciones de fármacos que siendo poco solubles y poco biodisponibles, se formulan junto a excipientes como los lípidos poliglicolizados (Labrasol®, Gelucire®) capaces de incrementar tanto su solubilidad como su biodisponibilidad. Este hecho demuestra una vez más la falta de nivel inventivo de la solicitud colombiana en trámite puesto que el propósito de mejorar la solubilidad y la biodisponibilidad de fármacos poco solubles por la inclusión en la formulación de agentes tensioactivos no iónicos de carácter lipofílico, pertenece al estado del arte.

En igual sentido, la publicación internacional WO 01/05376 A1 "NEW PHARMACEUTICAL FORMULATION", describe una formulación basada en un principio activo poco soluble como lo es Felodipino, al cual se le mejora no solo su solubilidad sino su biodisponibilidad, mediante su disolución o dispersión en un solubilizante adecuado como Labrasol® o Gelucire®.

De esta forma, se demuestra que para una persona versada en la materia, conociendo tanto la baja solubilidad de los derivados de azetidina como las propiedades de compuestos como Gelucire o Labrasol, podría hacer formulaciones muy adecuadas en presencia de estos dos compuestos, por tanto la inclusión de un agente tensioactivo no iónico en una formulación farmacéutica carece de nivel inventivo.

Así las cosas, y con fundamento en los argumentos expuestos a lo largo del presente escrito, respetuosamente reitero la solicitud para que su despacho se abstenga de conceder el privilegio de patente solicitado, y ordene en consecuencia el archivo del expediente respectivo.

Señor Superintendente.



JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR

C.C. 79'152.473 de Usaquén

T.P. 44.655 de C.S.J.