

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación: 85033799 00000003

Folios: 7

Fecha (ACE): 2005-05-20 16:56:17

Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE MACI 444 RESPUESTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.-WYETH.-Solicitud de Patente de Invención Fase Nacional PCT para "FORMULACIONES ORALES SOLIDAS DE RAPAMICINA 42-ESTER CON ACIDO 3-HIDROXI-2-(HIDROXIMETIL)-2-METIL PROPIONICO".-Clase A61K 9/00.-Expediente número 05-033.799.-

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista el 6 de Mayo de 2005.
2. Con el fin de dar respuesta al requerimiento mencionado, estando dentro del término legal, por medio del presente, me permito indicar a ese Despacho que el nuevo título para la presente invención es:

"FORMULACIONES ORALES SOLIDAS DE RAPAMICINA 42-ESTER CON ACIDO 3-HIDROXI-2-(HIDROXIMETIL)-2-METIL PROPIONICO"

3. Anexo me permito presentar:

(a) Nuevo extracto de la solicitud en sus dos formas para su publicación, **que reemplaza el originalmente presentado**, en el cual se ha realizado la modificación del título expuesta anteriormente;

64

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

(b) Tarjeta de Propietario; y

(c) Nueva página del resumen-objeto y finalidad de la invención y página 1 de la descripción en las cuales se ha realizado la modificación expuesta anteriormente.

4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor SuperIntendente,


ALICIA LLORED A RICAURTE
T.P. 53.215

PATENTE

MODELO DE UTILIDAD

DISEÑO INDUSTRIAL

OTROS

(FORMA P-104)

EXTRACTO

Solicitud Internacional No.
PCT/US2003/029228

21

05-033.799

22

12-04-2005

31

60/411,264

32

17-09-2002

33

US

51

74

ALICIA LLOREDA RICAURTE

72

ASHRAF, Muhammad y BENJAMIN, Eric, J.

Dibujo Característico
se puede pegar aquí
6 cms. x cms.

67
66

Título No.

Fecha

(57) Reivindicación número 1.-
Una composición farmacéutica para administración oral que comprende una granulación, dicha granulación comprende CCI-779, un polímero soluble en agua, un surfactante, un antioxidante y un agente modificador de pH.

Reivindicación número 7.-
Un proceso para preparar una composición oral de CCI-779, que comprende:

(a) disolver CCI-779 y un antioxidante en un alcohol;
(b) disolver PVP, un agente modificador de pH, y un surfactante en agua;
(c) combinar las soluciones acuosa y alcohólica para proporcionar una solución hidrohólica;
(d) adicionar la solución hidrohólica a un mezclador que contiene uno o más excipientes intragranulares;
(e) granular la mezcla; y
(f) secar la granulación resultante.

Continúa al respaldo

WYETH

Madison, Estado de New Jersey, Estados Unidos de América.

54 TITULO

"FORMULACIONES ORALES SOLIDAS DE RAPAMICINA 42-ESTER CON ACID 3-HIDROXI-2-(HIDR XIMETIL)-2-METIL PROPIONICO"

68
67

**FORMULACIONES ORALES SOLIDAS DE RAPAMICINA 42-ESTER CON
ACIDO 3-HIDROXI-2-(HIDROXIMETIL)-2-METIL PROPIONICO**

RESUMEN, OBJETO Y FINALIDAD DE LA INVENCION

Esta invención proporciona formulaciones orales sólidas de rapamicina 42-éster con ácido 3-hidroxi-2-(hidroximetil)-2-metil propiónico (CCI-779).

F RMULACI NES ORALES SOLIDAS DE RAPAMICINA 42-ESTER CON ACIDO 3-HIDROXI-2-(HIDROXIMETIL)-2-METIL PROPIONICO

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

Esta invención está relacionada con formulaciones orales sólidas de rapamicina 42-éster con ácido 3-hidroxi-2-(hidroximetil)-2-metil propiónico (CCI-779).

La rampamicina es un antibiótico trieno macrocíclico producido por *Streptomyces hygroscopicus*, que se encontró que tenía actividad antifúngica, particularmente contra *Candida albicans*, tanto *in vitro* como *in vivo* [C. Vezina *et al.*, *J. Antibiot.* 28, 721 (1975); S.N. Sehgal *et al.*, *J. Antibiot.* 28, 727 (1975); H.A. Baker *et al.*, *J. Antibiot.* 31, 539 (1978); Patente U.S. 3,929,992; y Patente U.S. 3,993,749]. Adicionalmente, se ha mostrado que la rapamicina sola (Patente U.S. 4,885,171) o en combinación con picibanil (Patente U.S. 4,401,653) tiene actividad antitumoral.

Los efectos inmunodepresivos de la rapamicina se han revelado en FASEB 3, 3411 (1989). La ciclosporina A y FK-506, otras moléculas macrocíclicas, también han mostrado ser efectivas como agentes inmunodepresivos, por lo tanto útiles en la prevención del rechazo de transplante [Patente U.S. 5,100,899]. R. Martel *et al.* [*Can. J. Physiol. Pharmacol.* 55, 48 (1977)] revelaron que la rapamicina es efectiva en el modelo de encefalomiелitis alérgica experimental, un modelo para esclerosis múltiple; en el modelo de artritis adyuvante, un modelo para artritis reumatoidea; e inhibió efectivamente la formación de anticuerpos tipo IgE.

La Rapamicina también es útil en la prevención o tratamiento de lupus sistémico eritematoso [Patente U.S. 5,078,999], inflamación pulmonar [Patente U.S. 5,080,899], diabetes mellitus insulino dependiente [Patente U.S. 5,321,009], desórdenes de la piel, tales como psoriasis [Patente U.S. 5,286,730], desórdenes intestinales [Patente U.S. 5,286,731], proliferación de células de músculo liso y adelgazamiento íntimo seguido de lesión vascular [Patentes U.S. 5,288,711 y 5,516,781], leucemia/linfoma de células T adultas [Solicitud de Patente Europea 525,960 A1], inflamación ocular [Patente U.S. 5,387,589], carcinomas malignos [Patente U.S. 5,206,018],