

243/43

BOGOTÁ - COLOMBIA
OFICINA FUNDADA EN 1941
APARTADO AEREO 12304
TEL: 57-1-3264270 57-1-6069700
FAX: 57-1-3264271 57-1-6069701
CABLES: LLOREDA
CALLE 72 No. 5-83 5º. PISO
www.lloredacamacho.com
jlcco@lloredacamacho.com

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

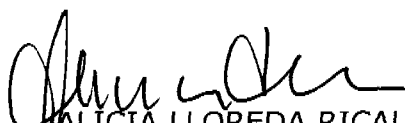
E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
BOGOTÁ, D.C. 120000-0000
RECEIVED 12/12/2020 NUECRACIONE
FASER NACIONAL II

Re: P1.-JANSSEN PHARMACEUTICA N.V.-Solicitud de Patente de
Invencción en Fase Nacional PCT para "COMPOSICIONES
FARMACEÚTICAS QUE COMPRENDEN UN COMPUESTO
FARMACOLÓGICO BÁSICO O ÁCIDO, UN SURFACTANTE Y UN
ÁCIDO O UNA BASE HIDROSOLUBLE FISIOLÓGICAMENTE
TOLERABLE, RESPECTIVAMENTE."-Clase **A61K 9/48.-**
Expediente número 05-051.116.-

1. Me refiero a mi memorial de 29 de Agosto de 2005.
2. De conformidad con lo dispuesto en el Artículo 5.2.12 de la Circular Externa No. 03 de 28 de Abril de 2003, y estando dentro del plazo de seis meses contados desde la fecha de la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial número **575** de 30 de Abril de 2007, solicito a ese Despacho proceder a realizar el examen de patentabilidad de la presente invención.
3. Me permito recordar a usted, que tal como se informó en el Petitorio de la invención, la presente solicitud corresponde a Capítulo II.
4. Anexo me permito acompañar recibo número 07-82.449, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa que dicho examen causa.

Señor Superintendente,


VALICIA LLOREDA RICAURTE
T.P. 53.215

209 2/44

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 82,449
FECHA : OCTUBRE 8 DE 2007



RECIBO OFICIAL DE CAJA No. 07-82449-0000
Fecha de Emisión: 08/10/2007
Valor: \$ 82.449.000.000
Código de Verificación: 079 PASNACIONALII
NIT: 800176089-2

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47999513	08/10/2007	10,026,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTIBILID	202,000.00
		TOTAL :	\$ 202,000.00

SON: DOSCIENTOS DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 05-51116

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **575** DE

FECHA **30 DE ABRIL DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL **31 DE JULIO DE 2007**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI

NO

X

United States Patent [19]
Schepky et al.

[11] **Patent Number:** 4,596,705
[45] **Date of Patent:** Jun. 24, 1986

[54] **ORAL MOPIDAMOL PREPARATION**

[75] **Inventors:** Gottfried Schepky, Biberach; Rolf Brickl, Warthausen; Peter Grüber, Biberach; Jochen Schmid, Warthausen; Ursula Springmeier, Mietingen, all of Fed. Rep. of Germany

[73] **Assignee:** Dr. Karl Thomae GmbH, Biberach an der Riss, Fed. Rep. of Germany

[21] **Appl. No.:** 339,998

[22] **Filed:** Oct. 7, 1983

[30] **Foreign Application Priority Data**
Oct. 9, 1982 [DE] Fed. Rep. of Germany 3237575

[51] **Int. Cl.⁴** A61K 9/20; A61K 9/22;
A61K 9/48
[52] **U.S. Cl.** 424/35; 424/14;
424/16; 424/19; 424/37
[58] **Field of Search** 424/14, 16, 19-22,
424/31-38

[56] **References Cited**

U.S. PATENT DOCUMENTS

4,361,546	11/1982	Stricker et al.	424/19
4,367,217	1/1983	Gruber et al.	424/19
4,427,648	1/1984	Brickl et al.	424/16
4,438,091	3/1984	Gruber et al.	424/21
4,459,279	7/1984	Stricker et al.	424/19

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

3237575 4/1984 Fed. Rep. of Germany
2128088A 4/1984 United Kingdom

OTHER PUBLICATIONS

White et al., CA. 95 #209646w (1981) of Eur. Pat. Appl. 19586, Nov. 26, 1980, 25 pp.
Slichter CA. 94 #529405 (1981) of Ger. Off. 2,964,736, Aug. 28, 1980, 9 pp.
Jardillier et al., CA. 94 #214617w (1981) of Ger. Off. 2,931,573, Feb. 26, 1981, 9 pp.
Niewiarowski et al., CA. 83 #108254p (1975).
Rifkin et al., CA. 79 #132866c (1973).

Primary Examiner—Shep K. Rose
Attorney, Agent, or Firm—Hammond & Littell,
Weissenberger & Dippert

[57] **ABSTRACT**

This invention relates to vehicles for the administration of mopidamol. More specifically, this invention relates to a method of treating cardiovascular disorders, malignancy, or thrombosis in a host in need of such treatment which comprises administering to said host a cardiovascularly, antimetastatic, or antithrombotic effective amount of a composition comprised of (i) mopidamol or an acid addition salt thereof and (ii) at least one pharmacologically acceptable acid or acid substance, the total amount of acid from acid addition salt present and acid or acid substance being in a ratio of at least about 1 acid equivalent to 1 mol of mopidamol.

12 Claims, 3 Drawing Figures

-continued

Component	Weight (mg)
(4) Corn starch	37.0
(5) Cross-linked polyvinylpyrrolidone	10.0
(6) AEROSIL	3.0
(7) Powdered triglyceride	6.0
(8) Magnesium stearate	3.0
Total:	445.0

PREPARATION OF 1000 FILM-COATED TABLETS

Components (1) and (2) were triturated and moistened with 50 ml of acetone and then further processed as described in Example 1. Ingredients (3) to (8) were finely screened and added thereto. The mixture was compressed.

Diameter of punch: 11 mm

Radius of curvature: 11 mm

The tablets were provided with a flavor-masking coating of hydroxypropyl methylcellulose. The finished film-coated tablets each weighed about 4.5 mg more than the uncoated tablets.

EXAMPLE 14

Each capsule contained the following:

Component	Weight (mg)
(1) Mopidamol	250.0
(2) Fumaric acid	250.0
(3) CREMOPHOR RH 40 ®	200.0
(4) Microcrystalline cellulose	150.0
(5) Pyrogenic silicic acid	50.0
Total:	900.0

PREPARATION OF 1000 CAPSULES

Components (1) and (2) were thoroughly triturated in component (3), and then component (4) and finally component (5) were added. The finished trituration was packed into size 000 capsules.

EXAMPLE 15

Oblong tablets with delayed release of the active substance were prepared. The tablets had the following composition:

Component	Weight (kg)
(1) Mopidamol	3.00
(2) Fumaric acid	2.50
(3) Pyrogenic silicic acid	0.20
Total:	5.70

The above ingredients were mixed together, compressed in a roller compactor, and granulated. After 0.06 kg of magnesium stearate had been added, the mixture was compressed into oblong tablets. These were sprayed with a solution of methacrylic acid/methacrylic acid ester copolymer and hydroxypropylmethyl cellulose phthalate in a ratio of 2:8 (acetone/isopropanol 1:1) until an intact diffusion membrane formed.

EXAMPLE 16

The granulate prepared according to Example 15, by use of a roller compactor and subsequent dry granula-

tion, was mixed with 0.5% magnesium stearate and packed into hard gelatine capsules.

EXAMPLE 17

Hard gelatine capsules were filled with pellets having the following composition:

Component	Weight (mg)
(1) Tartaric acid	165.0
(2) Mopidamol	200.0
(3) Fumaric acid	105.0
(4) Polyvinyl pyrrolidone	44.0
(5) Talc	16.0
(6) Hydroxypropyl methyl-cellulose	7.0
Total:	537.0

PREPARATION

Spherical tartaric acid crystals (1) were coated with component (6). After being moistened with component (4), dissolved in isopropanol, the crystals were coated in small batches with a powdered mixture of components (2), (3), and (5) in a suitable coating vessel. After all the powder mixture had been applied, the resulting pellets are screened, dried, and packed into hard gelatine capsules.

EXAMPLE 18

Hard gelatine capsules were filled with pellets having the following composition:

Component	Weight (mg)
(1) Citric acid	150.0
(2) Mopidamol	200.0
(3) Fumaric acid	105.0
(4) Polyvinylpyrrolidone	30.0
(5) Talc	16.0
(6) Polyoxyethylene-hydrogenated castor oil	29.0
(7) Hydroxypropyl methyl-cellulose	7.0
Total:	537.0

In accordance with the procedure described in Example 17, the isolated citric acid crystals were coated with a mixture of components (2), (3), (5) and (6) using dissolved component (4). The screened pellets were packed into hard gelatine capsules.

EXAMPLE 19

Pellets prepared according to Example 18 were sprayed with a solution of hydroxypropyl methylcellulose phthalate (acetone/isopropanol (3:7)), dried, and then packed into hard gelatine capsules.

The preceding specific embodiments are illustrative of the practice of the invention. It is to be understood, however, that other expedients known to those skilled in the art or disclosed herein, may be employed without departing from the spirit of the invention or the scope of the appended claims.

We claim:

1. A composition which comprises (i) mopidamol or an acid addition salt thereof and (ii) at least one pharmacologically acceptable acid or acid substance, the total amount of acid from acid addition salt present and acid or acid substance being in a ratio of at least 1 acid equivalent to 1 mol of mopidamol.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.

Abogada
Alicia Lloreda

ASUNTO	Radicación	05-51116
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	005

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐ Cap. II ☒
No. Sol. Internacional	<u>PCT/EP2003/050890</u>		
Fecha de Presentación Internal.	<u>25 de Noviembre de 2003</u>		

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripción: Folios: 40 a 218 (como se radicó inicialmente)
- 1.2. Reivindicaciones: Folios: 219 a 223 (como se radicó inicialmente)
- 1.3. Prioridad: EP PCT/EP02/13558 de Noviembre 29 de 2002.

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: "COMPOSICIONES FARMACEUTICAS QUE COMPRENDEN UN COMPUESTO FARMACOLÓGICO BÁSICO Ó ÁCIDO, UN SURFACTANTE Y UN ÁCIDO O UNA BASE HIDROSOLUBLE FISIOLÓGICAMENTE TOLERABLE, RESPECTIVAMENTE", folio 1, campo 54.
- El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:

Reivindicaciones 1-18: Composiciones y formas farmacéuticas.
Reivindicación 19: Uso de las composiciones farmacéuticas.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de composiciones del compuesto farmacológico con perfil de disolución más rápido y obtención de mayor biodisponibilidad.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona composiciones farmacéuticas, su uso en manufactura y formas de dosificación.

- La invención se catalogó en la categoría A61K9/48, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC).

3. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

- En la reivindicación 19 se presenta el uso de los compuestos en manufactura. De acuerdo con la decisión 486 el uso no se considera invención y por lo tanto no se le puede otorgar patente.
- Por lo tanto la reivindicación 19 no puede obtener patente.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es la fecha de presentación de la solicitud prioritaria Noviembre 29 de 2002.

Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US4596705A	ORAL MOPIDAMOL PREPARATION	24.06.1986

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

5.1. Novedad (artículo 16 D486)

- En la primera reivindicación se presentan composiciones que comprenden una droga básica, un tenso-activo y un ácido soluble en agua tolerable fisiológicamente caracterizada por una relación ácido: base 1:1 en peso, como se observa en la tabla a continuación.
- El estado de la técnica representado por D1, presenta composiciones de idénticas características según la tabla a continuación. (Mopidamol, una droga básica, ácido fumárico y Cremophor RH40, un tenso-activo).

CARACTERÍSTICAS TÉCNICAS ESENCIALES	
SOLICITUD	D1 (US4596705A)
Primera reivindicación - Una composición farmacéutica que comprende:	Ejemplo 14 (columna 13, líneas 25 a 35) - Una composición que comprende:
1-Un compuesto medicamentoso alcalino (respectivamente ácido)	1-250 mg mopidamol
2-Un surfactante	2-200 mg CREMOPHOR RH 40 ®
3- Un ácido soluble en agua tolerable fisiológicamente (respectivamente básico)	3-250 mg ácido fumárico

Caracterizada por la relación de compuesto medicamentoso : ácido (o base) es por lo menos 1:1 en peso.	Se presentan 18 ejemplos adicionales de formas farmacéuticas sólidas.
--	---

- El elemento característico de las composiciones reivindicadas, es decir droga básica, tenso-activo y ácido en relación 1:1 con la droga básica, ya era divulgado en D1, por lo cual las composiciones no pueden considerarse nuevas.

6. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento Nº	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US4596705A	1 y dependientes (2 a 18)	Novedad

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única Nº 10 de 2001.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha _____

CONCEPTO TÉCNICO No.3083	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202074
------------------------------------	---

3083