

REYES & REYES

A B O G A D O S

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-088181- -00006-0000

Fecha: 2008-04-16 17:23:39 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Evt. 378 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 5

SEÑOR

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.

REF:

Expediente 06-088-181

**TÍTULO SOLICITADO: "COMPOSICIÓN CRISTALINA QUE CONTIENE
ESCITALOPRAM."**

PUBLICACIÓN:

**Gaceta 581 de 31 de Octubre de 2007, N° de
publicación 665.**

PRIORIDAD:

DK PA200400382 del 05/03/2004

SOLICITANTE:

H. LUNDBECK A/S.

APODERADO:

EMILIO FERRERO

TRÁMITE:

SUSTENTACION DE OPOSICIÓN

JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR, mayor de edad, identificado como aparece al pie de mi firma, abogado en ejercicio, titular de la tarjeta profesional número 44655 del Consejo Superior de la Judicatura, obrando en calidad de apoderado de la sociedad **TECNOQUÍMICAS S.A.** dentro del trámite de la referencia, en ejercicio de lo dispuesto por el artículo 42 inciso 2° de la Decisión 486 de 2000, por medio del presente escrito, procedo a sustentar y complementar la oposición presentada en los siguientes términos:

I. RATIFICACIÓN

Comendidamente me permito insistir en los argumentos planteados en la oposición referida, los cuales, como se dijo en su momento, demuestran que la solicitud de la referencia incumple los requisitos de patentabilidad establecidos por los

259
780

artículos 14, 16 y 18 de la Decisión 486 de 2000, y que por ello no merece recibir el beneficio patentario.

- Primero que todo, el principio activo ESCITALOPRAM, **incluyendo en general sus sales ácidas de adición**, ciertos procesos de obtención y de cristalización, al igual que su utilidad y empleo como antidepresivo, han sido revelados al menos desde la publicación de la patente americana US 4,650,884 en **17-03-1987**; la generalidad de esta documento permite concluir que **la sal oxalato** que ahora se pretende, en tanto **es una sal ácida de adición farmacéuticamente aceptable**, ya había sido revelada en el documento reseñado, razón por la cual su conocimiento afecta la **novedad** de la solicitud en curso.
- La patente DE 2657013 equivalente a la US 4136193 presentada el 7 de junio de 1977 y publicada el **23 de enero de 1979**, de título "Anti-depressive substituted 1-Dimethylaminopropyl-1-Phenyl Phthalans" revela la mezcla racémica o a Citalopram, específicamente describe compuestos seleccionados del grupo de phthalanos de fórmula (I), entre los que se encuentra 1-[4'-fluorophenyl] -1-[3-[Dimethyl-amino] propyl]- -5-phthalan carbonitrile (Citalopram) o una sal de adición ácida del mismo farmacéuticamente aceptable. Más específicamente se describe que el **Citalopram preparado fue aislado en forma cristalina como sal Oxalato**, Bromhidrato y Clorhidrato; y también se revelan composiciones farmacéuticas en forma de tabletas para el tratamiento de la depresión.
- La patente US 4,943,590, publicada el **24/07/1990**, titulada "Pharmaceutically useful (+)- 1-(3-(dimethylaminopropyl) -1-(4'-fluorophenyl) -1,3-dihydro-benzofuran-5-carbonitrile and non-toxic acid addition salts thereof" revela sales farmacéuticamente aceptables de los enantiómeros de Citalopram formadas con ácidos orgánicos o inorgánicos no tóxicos. La posibilidad de formar la sal de Oxalato de Citalopram mediante la reacción de Citalopram con el ácido Oxálico está claramente expuesta en este documento, razón por la cual, la sal revelada en la solicitud colombiana en curso carece por completo, una vez más, del requisito de **Novedad**.

- Las **partículas cristalinas** de Oxalato de escitalopram pertenecen al estado del arte puesto que la anterioridad US 4,943,590 en el ejemplo 2 se describe que: **La sal del ácido oxálico** del isómero (+) ó del isómero (-) -1-(3-(dimethylamino-propyl)-1-(4'-fluorophenyl)-1,3-dihydrobenzofuran-5-carbonitrile **cristaliza** desde acetona, obteniéndose una sal con MP: 147°-148°C, $[\alpha]_D = +12.31^\circ$ (c=1, CH₃OH) ó una sal con MP: 147°-148°C, $[\alpha]_D = +12.08^\circ$ (c=1, CH₃OH), respectivamente.
- Si el fundamento de invención de la solicitud en trámite estuviera dado por los tamaños de partículas proporcionados y la posibilidad de usar tales cristales con esos tamaños en **compresión directa** –tal como se afirma en la parte descriptiva de la solicitud colombiana en trámite-, me permito decir que desde 1990 era posible la fabricación de tabletas donde el principio activo corresponde a (+) Citalopram en la forma de una sal ácida de adición (entre las que puede encontrarse Oxalato de Citalopram), al parecer viables y aptas para el consumo humano, como quiera que entre los objetivos de la anterioridad mencionada está en obtener un producto final sea cual fuere el proceso para llegar a el, que satisfaga al humano luego de la administración del mismo. Del igual manera, la publicación británica GB 2 357 762 A publicada el **04/07/2001**, revela que las formulaciones de Citalopram pueden ser preparadas por compresión directa, en consecuencia, podría pensarse que para esa fecha, es decir para 2001, el problema técnico planteado en la solicitud colombiana en trámite ya había sido resuelto puesto que *“este proceso es mucho más simple y económico que aquellos procesos que involucran granulación”*. Si una persona medianamente versada en la materia, conociendo la sustancia en cuestión desde hace más de 20 años, y deduciendo en consecuencia las eventuales dificultades en materia de formulación y en especial de compresión debido entre otras razones al tamaño de partícula, necesariamente iniciaría actividades experimentales orientadas a solucionar los problemas en cuestión.
- El método planteado para la manufactura de las partículas cristalinas de Oxalato de Escitalopram el cual comprende (reivindicaciones 26 a 35) en una de sus etapas, un enfriamiento gradual de la solución que contiene dicho principio activo en un sistema solvente adecuado (alcohol y opcionalmente agua, o preferiblemente etanol), carece de nivel inventivo puesto que, es ampliamente conocida que para efectuar la cristalización de un sólido, se