

No. 06-094731- -00001-0000

Fecha: 2007-08-15 17:53:15 Dep. 2020 NULCREACION
Tra. 11 PATENTE:YII Lve 378 FASENACIONALI
Act. 538 PLICION -folios 3

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Ref: Expediente No. 06-094.731

Solicitud de patente de invención titulada: "TABLETAS DE DESINTEGRACION QUE
COMPRENDEN LICARBAZEPINA".

Solicitante: NOVARTIS AG

SOLICITUD DE EXAMEN DE PATENTABILIDAD SEGÚN
EL ARTÍCULO 44 DE LA DECISION 486, GACETA No. 573

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado del solicitante, respetuosamente me permito solicitar que se examine si la invención reúne los requisitos de patentabilidad previstos en la misma, dando cumplimiento a lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina de Naciones. Adjunto 2 recibos que sumados dan \$404.000 pesos para cubrir la tasa correspondiente, según la Resolución 36155 del año 2006.

Atentamente,

CARLOS R. OLARTE
C.C. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexo: 2 Recibos \$404.000 pesos

LMB/P2006/0001184 07/08/15

269
69

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-094731- -00001-0000

Fecha: 2007-08-15 17:53:15 Dep. 2020 NUECREACIONE
Trs 11 PATENTEIYU Eje. 378 FASENACIONAL
Act 532 PETICION Folios: 3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

REC : 000176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 05,700
FECHA : ABOGADO 15 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PAGO	VAL. PAGO
CLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	50207833	15/08/2007	1,220,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	
	114 PTE GAP-II EXAMEN DE PATENTIBILIDAD	202,000.00
	TOTAL :	\$ 202,000.00

SON: DOSCIENTOS DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

70 3
18
70

RECIBO DE PAGO
Dep. 2020 NUCLEACION
Eve 378 FASE NACIONAL
Folios: 3
2007-08-15 17:53:15
PATENTIA
Act 332 PETICION

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 900176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 43,717
FECHA : AGOSTO 15 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAG	Val. PAGO
CLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050 00110-6	60287833	15/08/2007	3,220,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTABILIDAD	302,000.00
		TOTAL :	\$ 302,000.00

SON: DOSCIENTOS DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 06-94731

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

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **573** DE

FECHA **28 DE FEBRERO DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA

LEY EXPIRA EL **30 DE MAYO 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



US006296873B1

(12) **United States Patent**
Katzhendler et al.

(10) **Patent No.:** **US 6,296,873 B1**
(45) **Date of Patent:** ***Oct. 2, 2001**

(54) **ZERO-ORDER SUSTAINED RELEASE
DELIVERY SYSTEM FOR
CARBAMAZEPINE DERIVATIVES**

(75) Inventors: **Ifat Katzhendler; Michael Friedman,**
both of Jerusalem (IL.)

(73) Assignee: **Yissum Research Development
Company of the Hebrew University of
Jerusalem, Jerusalem (IL.)**

(*) Notice: Subject to any disclaimer, the term of this
patent is extended or adjusted under 35
U.S.C. 154(b) by 0 days.

This patent is subject to a terminal dis-
claimer.

(21) Appl. No.: **09/539,504**

(22) Filed: **Mar. 31, 2000**

Related U.S. Application Data

(63) Continuation-in-part of application No. 09/436,886, filed on
Nov. 9, 1999, now abandoned, which is a continuation of
application No. 09/012,265, filed on Jan. 23, 1998, now Pat.
No. 5,980,942.

(60) Provisional application No. 60/035,892, filed on Jan. 23,
1997.

(51) Int. Cl.⁷ **A61K 9/20; A61K 9/22**

(52) U.S. Cl. **424/465; 424/464; 424/468;
424/469; 424/484; 424/488; 424/489; 424/499;
424/500; 424/502**

(58) Field of Search **424/464, 465,
424/468, 469, 484, 488, 489, 499, 500,
502**

(56) **References Cited**

U.S. PATENT DOCUMENTS

4,887,336 8/1989 Khanna et al. 424/473
5,284,662 2/1994 Koparkar et al. 424/473

OTHER PUBLICATIONS

P. K. Jensen, et al., Pharmacokinetic Comparison of Two
Carbamazepine Slow-Release Formulations, *Acta Neurol
Scand* 82:135-137 (1990).

John Halebian et al., *Pharmaceutical Applications of Poly-
morphism*, vol. 58, No. 8, pp 911-929 (1969).

Tsunco Umeda, et al., Kinetics of the Thermal Transition of
Carbamazepine Polymorphic Forms in the Solid State, 1984.

Paavo Kahela, et al., Pharmacokinetics and Dissolution of
Two Crystalline Forms of Carbamazepine, *International
Journal of Pharmaceutics* 14:103-112 (1983).

Ensio Laine, et al, Formation of Dihydrate From Carbam-
azepine Anhydrate in Aqueous Conditions, *International
Journal of Pharmaceutics*, 20:307-314 (1984).

Christopher F. Terrence, et al., Effect of Baclofen Enantio-
morphs on the Spinal Trigeminal Nucleus and Steric Simi-
larities of Carbamazepine, *Pharmacology* 27: 85-94 (1983).

Ensio Lane, et al., Formation of Dihydrate From Carbam-
azepine Anhydrate in Aqueous Conditions, *International
Journal of Pharmaceutics* 20:307-314 (1984).

Winnie Wai Ling et al., Kinetics of Transition of Anhydrous
Carbamazepine to Carbamazepine Dihydrate in Aqueous
Suspensions, vol. 80, No. 5 pp. 496-500 (May 1991).

H. Pöhlmann, et al., Polymorphie, Tielchengröße und
Blutspiegelwerte von Carbamazepin, *Pharmazie* 30, H. 11
pp 709-711 (1975).

Maria Kuhnert-Brandstätter, *Thermomicroscopy in the
Analysis of Pharmaceuticals*, Pergamon Press vol. 45,
selected pages, 1971.

Ensio Laine, et al., Pharmacokinetics and Dissolution of
Two Crystalline Forms of Carbamazepine, *International
Journal of Pharmaceutics*, 20:307-314 (1984).

Primary Examiner—Thurman K. Page

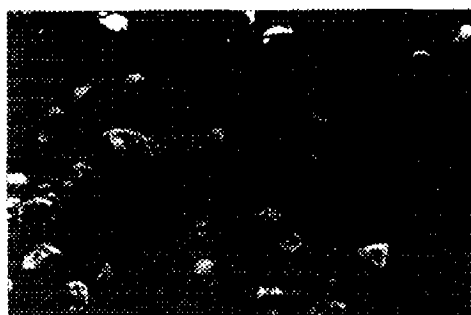
Assistant Examiner—Lakshmi S. Channavajjala

(74) *Attorney, Agent, or Firm*—Hana Verny

(57) **ABSTRACT**

A zero-order sustained-release delivery system for delivery
of carbamazepine or a derivative thereof. A polymeric
matrix formulation of carbamazepine comprises hydrophilic
polymer or hydrophilic-hydrophobic polymer mixture which
permits carbamazepine or carbamazepine derivative to be
released from the polymer matrix in zero-order release
kinetics.

19 Claims, 12 Drawing Sheets



0.1mm 300X 300E2 2293/95 C-POW0



0.1mm 300X 300E2 4082/95 PO-20

5

10-acetyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-propionyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-butyroxyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-pivaloxyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-[(1-naphthoyloxy)imino]-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-benzoyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-succinyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-glutaroyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-isobutoxycarbonyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-methoxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-(S)-(-)-camphanoyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-[(3-methoxybenzoyloxyimino)]-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-nicotinoyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-ethoxycarbonyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-butoxycarbonyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide; and
 10-benzoyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide.

BRIEF DESCRIPTION OF DRAWINGS

FIG. 1 shows scanning electron micrograph of carbamazepine in anhydrous form (FIG. 1A) and in dihydrate crystals (FIG. 1B).

FIG. 2 shows scanning electron micrograph of carbamazepine crystals obtained from suspensions of Methocel K4M after 1 day at 1 mg/ml (FIG. 2A), at 5 mg/ml (FIG. 2B), at 10 mg/ml (FIG. 2C), and at 7 days at 1 mg/ml (FIG. 2D), 5 mg/ml (FIG. 2E) and at 10 mg/ml (FIG. 2F).

FIG. 3 shows differential scanning calorimetry thermographs of dry mix of Methocel K4M and carbamazepine mixtures in polymer drug ratios 0:100 (FIG. 3A), 20:80 (FIG. 3B), 30:70 (FIG. 3C), 50:50 (FIG. 3D), 80:20 (FIG. 3E).

FIG. 4 shows differential scanning calorimetry thermographs obtained from the gel layer of formulation containing 50% Methocel K4M at two hydration times—6 hours hydration (FIG. 4A) and 20 hours hydration (FIG. 4B).

FIG. 5 shows scanning electron micrograph photographs obtained from cross section in the gel layer of formulation containing 50% Methocel K4M after 6 hours hydration. Magnification in FIG. 5A is X300; in FIG. 5B it is X1200.

FIG. 6 shows X-ray diffraction patterns of carbamazepine powder (FIG. 6A); Methocel K4M powder (FIG. 6B); 50:50 physical mixture of carbamazepine and Methocel K4M (FIG. 6C); sample from gel layer, 6 hours hydration (FIG. 6D); and sample from gel layer, 20 hours hydration (FIG. 6E).

FIG. 7 shows the effect of HPMC concentration on the dissolution rate of carbamazepine.

FIG. 8 shows the influence of viscosity grade of Methocel on the dissolution rate of carbamazepine wherein Methocel concentration in the matrix is 50%.

6

FIG. 9 shows the effect of viscosity grade of Methocel on the dissolution rate of carbamazepine wherein Methocel concentration in the matrix is 30%.

FIG. 10 shows the influence of additives on the release rate of carbamazepine from matrix tablets containing 50% carbamazepine.

FIG. 11 shows the effect of rotation speed of the baskets on the release rate.

FIG. 12 shows the influence of SDS concentration on carbamazepine release rate from matrix tablets containing 40% Methocel K4M.

FIG. 13 shows carbamazepine (400 mg) release from a formulation containing 30% Methocel K4M.

FIG. 14 shows carbamazepine (600 mg) release from a formulation containing 30% Methocel K4M.

FIG. 15 shows carbamazepine (600 mg) release from a formulation containing 30% Methocel K100LV.

DETAILED DESCRIPTION OF THE INVENTION

The present invention relates to a controlled and sustained release oral drug delivery system comprising carbamazepine or a carbamazepine derivative. Carbamazepine or the derivative thereof is formulated within a polymeric matrix, said matrix optionally further containing additional pharmaceutically acceptable constituents and additives. The polymer in the polymeric matrix permits carbamazepine or its derivative to be released from the matrix by zero-order release kinetics.

I. Components of the Oral Drug Delivery System

The drug delivery system of the invention contains at least two components, namely a pharmaceutically active agent and a hydrophilic polymer.

One component of the drug delivery system of the invention is a pharmaceutically active agent. Pharmaceutically active agent is selected from the group consisting of an antiepileptic drug carbamazepine or any of carbamazepine derivative having the same properties.

Carbamazepine derivatives which possess the same or similar zero-order release kinetics properties from the polymer matrix are:

10,11-dihydro-10-oxo-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide (oxcarbazepine);
 10,11-dihydro-10-hydroxy-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-acetoxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-benzoyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(4-methoxybenzoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(3-methoxybenzoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(2-methoxybenzoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(4-nitrobenzoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(3-nitrobenzoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(2-nitrobenzoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(4-chlorobenzoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(3-chlorobenzoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(2-acetoxybenzoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;

10-propionyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-butyryloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-pivaloyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-[(2-propyl)pentanoyloxy]-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-[(2-ethyl)hexanoyloxy]-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-stearoyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-cyclopentanoyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-cyclohexanoyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-phenylacetoxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(4-methoxyphenyl)acetoxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(3-methoxyphenyl)acetoxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(4-nitrophenyl)acetoxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(3-nitrophenyl)acetoxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-nicotinoyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-isonicotinoyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(4-aminobutanoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(2-amino-3-methylbutanoyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-chloroacetoxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-bromoacetoxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-formyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-ethoxycarbonyloxy-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-(2-chloropropionyloxy)-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-hydroxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-benzoyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-acetyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-propionyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-butyryloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-pivaloyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-[(1-naphthoyloxy)imino]-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-benzoyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-succinoyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-glutaroyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-isobutoxycarbonyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-methoxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;

10,11-dihydro-10-(S)-(-)-camphanoyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-[(3-methoxybenzoyloxyimino)]-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-nicotinoyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10,11-dihydro-10-ethoxycarbonyloxyimino-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide;
 10-butoxycarbonyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide; and
 10-benzoyloxyimino-10,11-dihydro-5H-dibenz/b,f/azepine-5-carboxamide.

Carbamazepine derivatives and their preparation has been disclosed in the European Patent Application 96110490.8, filed on Jun. 28, 1996, published on Jan. 1, 1997 and 97108465.2, filed on May 26, 1997, hereby incorporated by reference.

In the drug delivery system of the invention, the drug is present in amount from about 100 mg to about 1,200 mg per tablet, preferably from about 200 mg to about 500 mg per tablet.

The second component of the delivery system is the polymeric matrix comprising at least one hydrophilic polymer but may contain two or more hydrophilic polymers in admixture. When hydrated, the polymer forms a gel layer around the dry tablet core. The matrix of the invention is made of low or high viscosity erodible polymers or mixtures thereof.

Polymers are mixed with drug in a weight ratio of polymer to drug from about 1:99% to about 99:1%, preferably from about 5:95% to about 90:10%, most preferably from about 10:90% to about 80:20%, depending on the viscosity grade of the polymer, on the tablet dimension and shape and on the desired release rate.

The polymer matrix carbamazepine formulation is preferably fabricated into tablets, capsules or granules for oral use. Rate of carbamazepine release from the tablets is controlled by the erosion mechanism of the polymer from which carbamazepine is released by zero-order kinetics. Examples of hydrophilic polymers which are suitable as the matrix for the zero-order release kinetics delivery system of the invention are hydrophilic cellulose derivatives.

In general, for producing a tablet on an industrial scale, the drug and polymer are granulated alone or in combination as described below. Lubricants, glidants and other additives may be added and the mixture is compressed into tablets.

Preferred hydrophilic cellulose derivatives are methyl cellulose, hydroxypropyl methylcellulose, hydroxyethyl cellulose, hydroxypropyl cellulose, hydroxyethyl methylcellulose, carboxy methylcellulose and sodium carboxy methylcellulose. The most preferred hydrophilic cellulose derivative is hydroxypropyl methylcellulose (HPMC).

HPMC is particularly preferred for use with carbamazepine or a carbamazepine derivative because of very low water solubility of carbamazepine or its derivative. HPMC is available in a low, normal or high viscosity grades. The viscosity of the polymer controls the release rate of the drug from the formulation and affects its zero-order release kinetics. Specific HPMCs which are most suitable for the current formulation are Methocel K100M, K15M, F4M, E4M, K4M, K100LV, K3, E15LV, E15LN, E15CLV, E50, E5 and E3, commercially available from Colorcon, Orpington, England.

Viscosity grade and molecular weights of various hydrophilic polymers are seen in Table 1.

75

75

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.

Abogado
CARLOS OLARTE

ASUNTO	Radicación	06-94731
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio	330.6
	Folios	006

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Cap. I	☒
		Cap. II	☐

No. Sol. Internacional PCT/EP2005/002987
Fecha de Presentación Internacional. 21/03/2005

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

Descripción: Folios 33 a 55 como se radicó inicialmente.

Reivindicaciones: Folios 56 a 59 como se radicó inicialmente.

Prioridad: Folio 1 GB 0406381.4 del 22/03/2004 y GB 0406737.7 del 25/03/2004

2. Objeto de la invención

Título: TABLETAS DE DESINTEGRACION QUE COMPRENDEN LICARBAZEPINA

Objeto: El objeto de la solicitud consiste en composiciones farmacéuticas orales de 10,11-dihidro-10-hidroxi-5H-dibenz[b,f]azepina-5-carboxamida (licarbazepina o HHD) de liberación controlada.

El problema planteado en la solicitud es la necesidad de proveer composiciones farmacéuticas orales de liberación controlada de licarbazepina que puedan ser utilizadas en el tratamiento de alteraciones psicosomáticas.

Para solucionar este problema técnico la solicitud proporciona composiciones farmacéuticas de liberación controlada de licarbazepina (MHD).

2006 094731

Reivindicaciones 1 a 14: Una composición de liberación controlada oral farmacéutica que comprende 10,11-dihidro-10-hidroxi-5H-dibenz[b,f]azepina-5-carboxamida (MHD)

Reivindicaciones 15 a 18: Una tableta de desintegración que tiene granulos de liberación modificada, que comprende 10,11-dihidro-10-hidroxi-5H-dibenz[b,f]azepina-5-carboxamida (MHD) y por lo menos un polímero como agente retardador.

Reivindicación 19: Uso de 10,11-dihidro-10-hidroxi-5H-dibenz[b,f]azepina-5-carboxamida para la preparación de un medicamento.

Reivindicación 20: Un método de administración oral de 10,11-dihidro-10-hidroxi-5H-dibenz[b,f]azepina-5-carboxamida.

Se catalogó el objeto de la invención según la IPC en las categorías A61K 9/20, A61P 25/18 y A61P 25/24.

3. De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Las reivindicaciones 12 a 14, 17 y 18 se refieren a composiciones farmacéuticas caracterizadas por su uso, lo cual no las hace diferentes, ni les otorga ninguna característica adicional.

4. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 11/09/2000, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US 6296873	Zero-order sustained release delivery system for carbamazepine derivatives	02/10/2001

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D 486)

Se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

Novedad: (artículo 16 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 18 de la solicitud se refieren a una composición de liberación controlada oral farmacéutica que comprende:

- 10,11-dihidro-10-hidroxi-5H-dibenz[b,f]azepina-5-carboxamida (MHD) y
- Por lo menos un polímero como agente retardador seleccionado de polimetacrilatos, etilcelulosa, hidroxietilcelulosa, hidroxipropilcelulosa y metilcelulosa.

77
77

El documento D1 describe composiciones farmacéuticas orales de liberación controlada con las mismas características esenciales a las de la presente solicitud, ya que comprenden derivados de carbamazepina como principio activo y polímeros hidrofílicos.

Entre los derivados de carbamazepina se encuentra específicamente el 10,11-dihidro-10-hidroxi-5H-dibenz[b,f]azepina-5-carboxamida (columna 6 línea 44) y entre los polímeros se encuentran derivados de celulosas como etilcelulosa (columna 8 líneas 36 a 54).

Como se puede apreciar, D1 divulga composiciones farmacéuticas idénticas a las de la presente solicitud, por lo tanto estas no cumplen con el requisito novedad.

6. Conclusión

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

Nº	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	US 6296873	1 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
Directora de Nuevas Creaciones (c)

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

CONCEPTO TECNICO No. 3924	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202077
---------------------------	---

2006 094731

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION 18919

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. PCT/06-94731

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 3, numeral 30 del decreto 3523 de 2009, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que la solicitud de patente de invención titulada "TABLETAS DE DESINTEGRACION QUE COMPRENDEN LICARBAZEPINA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP 2005/002987 de fecha 21 de marzo del 2005, fue radicada en esta Superintendencia el 20 de septiembre del 2006 bajo el número 06-094731-00000-0000, para que se iniciara la fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma en cuanto a los requisitos que debe llenar la solicitud y cumplidas las exigencias legales, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: *"Si la oficina nacional competente encontrara que la invención no es patentable o que no cumple con alguno de los requisitos establecidos en esta Decisión para la concesión de la patente, lo notificará al solicitante. Este deberá responder a la notificación dentro del plazo de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación. Este plazo podrá ser prorrogado por una sola vez por un periodo de treinta días adicionales.(...) Si el solicitante no respondiera a la notificación dentro del plazo señalado, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, la oficina nacional competente denegará la patente"*.

CUARTO: Que realizado el examen de fondo, se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico visibles a folios 72 a 77 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente. Frente a dicho requerimiento no hubo pronunciamiento alguno por parte del solicitante, por lo cual es procedente negar el privilegio de patente solicitado con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486.