

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCION NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.2011-02-04

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-020788- -00005-0000

Fecha: 2011-02-24 11:39:46 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

Abogado
Emilio Ferrero

ASUNTO	Radicación	07- 20788
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	010

Patente de Invención ☐

Vía PCT (fase nacional) ☐

Cap. I ☐

No. Sol. Internacional PCT/EP2005/009266
Fecha de Presentación Internacional 27-08-2005

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: 45 a 75 (Como se radicó inicialmente)

Reivindicaciones: Folios: 76 a 77 (como se radicó inicialmente)

Prioridad:

09-09-2004, ZA2004/7207.

2. Análisis de la Prioridad

La materia comprendida en la prioridad reivindicada corresponde a la materia contenida en la presente solicitud.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Composición Farmacéutica"

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:

Reivindicaciones 1 a 2: consiste en una composición farmacéutica que comprende una composición farmacéutica activa y una composición eutéctica soluble en agua, formándose la mezcla resultante en una forma de dosificación sólida soluble en agua.

Reivindicación 3 a 5: composición farmacéutica en la que la composición eutéctica es una mezcla de urea y 1,3-dimetilurea.

Reivindicaciones 6 a 13: se refieren a composiciones farmacéutica donde el principio activo es: un pesticida, un herbicida. Donde el pesticida sirve para: controlar o erradicar plagas en mamíferos, para controlar o erradicar ectoparásitos etc etc.

Reivindicaciones 14 a 22: composición farmacéutica activa que incluye adicionalmente uno cualquiera o más de al menos un dispersante, al menos un disgregante, al menos un tensioactivo y al menos una carga.

Reivindicación 23: composición farmacéutica activa que incluye carbonato de calcio.

Reivindicaciones 24 a 32: procedimiento para la fabricación de una forma de dosificación sólida que incluye fundir una composición eutéctica soluble en agua, añadir una composición farmacéutica activa y colar la mezcla resultante en moldes.

La solicitud busca proporcionar composición farmacéutica en una forma de dosificación sólida soluble en agua, con el propósito de eliminar el manejo de recipientes vacíos que resulta peligroso.

Clasificación Internacional de Patentes (IPC.). A01N 37/52, 43/00, 47/00; A61K09/00

4. De la solicitud de Patente

4.1 Descripción (artículo 28 D. 486)

El título de la solicitud es muy general.

No se presenta sustento de la efectividad de las composiciones reivindicadas frente a composiciones análogas del arte previo más cercano, con respecto al problema que se pretende solucionar. No existe tampoco nada que muestre la ventaja de utilizar una u otra mezcla eutéctica en la formulación.

4.2 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Las reivindicaciones tal como se presentan no definen la materia a proteger de manera clara y concisa, no es posible establecer lo que es nuevo e inventivo frente a lo conocido en el arte previo. Para mayor claridad las reivindicaciones deben tener un preámbulo y una parte característica que contenga lo que realmente es nuevo e inventivo.

La reivindicación N°1, es muy general y no define en forma clara y concisa la composición farmacéutica, no indica en forma específica e inequívoca los

componentes y proporciones de cada uno de ellos en dicha composición. La reivindicación independiente debe contener todas y cada una de las características esenciales de la invención. En la reivindicación N°1 no se contempla dispersantes, tensioactivos, disgregantes, carbonato de calcio.

Tampoco es claro que se quiere significar con " composición farmacéutica que comprende una composición farmacéutica activa...).

Con respecto a la reivindicaciones dependientes N°s 6 a 10 realmente no están definiendo o especificando la composición farmacéutica, ellas están simplemente dirigidas al uso de la misma.

Las reivindicación N°11 indica en forma muy amplia, que el pesticida pertenece al grupo de amidina o sea no está definiendo nada. De otra parte la reivindicación N°14 igualmente solo enuncia una serie de tipos de componentes que adicionalmente puede contener la composición pero no especifica cual o cuales son.

En las reivindicaciones N°s 16 y 19 se debe especificar el compuesto o componente por su nombre químico, la marca comercial del dispersante y tensioactivo no se acepta.

La reivindicación N° 24 se refiere a un procedimiento para la fabricación de una composición farmacéutica que no define, ni especifica ninguna condición en su forma de realización. Las reivindicaciones dependientes N°s 25 a32 , realmente no están especificando ninguna característica o condición del proceso.

Por lo tanto se debe definir en forma clara y concisa la combinación o composición herbicida, teniendo en cuenta que la reivindicación independiente N°1 debe contener todas y cada una de las características esenciales de la invención. Especificando cada uno de sus componentes y la proporción o porcentaje en el cual se combinan.

La materia a proteger debe tener sustento en la descripción y no puede ampliarse con respecto a la materia originalmente presentada.

5. Determinación del Estado de la Técnica:

Para determinar el estado de la técnica se tuvo en cuenta la fecha de la prioridad reclamada (09-09-2004), y se encontraron los siguientes documentos relacionados con la composición objeto de la solicitud.

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	US3.800.038	Uterine administration of eutectic solid solutions of steroid Hormones in a steroidal Lipid Carrier	26-03-1974
D2	WO 01/80822	Efervcent granules and methods for their preparation	01-11-2001
D3	US6.071.539	Efervcent granules and methods for their preparation	06-06-2000

D4	US6.488.961	Efervcent granules and methods for their preparation	03-12-2002

D1 enseña composiciones farmacéuticas sólidas que comprenden un principio activo y una mezcla eutéctica, así como formulaciones y procesos de obtención de las mismas.

D2 se refiere a formulaciones consistentes en gránulos producidos por extrusión, los cuales comprenden un agente ácido y un ligante que forman una mezcla eutéctica y un ingrediente activo.

D3 se refiere a formulaciones sólidas, gránulos efervescentes, que comprenden un agente ácido, un agente alcalino, un ligante extruible capaz de formar una mezcla eutéctica con el agente ácido. Los gránulos efervescentes pueden ser usados en composiciones farmacéuticas, hortícolas, agrícolas etc.

D4 se refiere a gránulos efervescentes, que comprenden un agente ácido, un agente alcalino, un ligante extruible capaz de formar una mezcla eutéctica con el agente ácido y opcionalmente un plastificante y al proceso de obtención de los mismos. Los gránulos efervescentes pueden ser usados en composiciones farmacéuticas, hortícolas, agrícolas etc.

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1 Novedad (artículo 16 D486)

Tal como se reivindica la composición farmacéutica, la novedad de las reivindicaciones N°s 1 y 2, se puede ver afectada a partir de cualquiera de los documentos citados como antecedentes (D1 a D4), dado que en ellos se enseñan composiciones que comprenden un ingrediente activo y una composición eutéctica soluble en agua, composición que corresponde a lo reivindicado en la solicitud.

De acuerdo con la reivindicación N° 14 se indica de forma general que además adicionalmente la composición incluye al menos un dispersante, un disgregante, al menos un tensioactivo y al menos una carga, lo cual igualmente se divulga en los documentos citados (ver ejemplos).

6.2 Nivel inventivo (artículo 18 D486)

El documento D2 (páginas 21 a 23), enseña gránulos efervescentes que comprenden una composición eutéctica soluble en agua y un ingrediente activo, la composición farmacéutica de la presente solicitud comprende una mezcla eutéctica y un ingrediente activo, preferiblemente un pesticida. Es de anotar que la composición de la solicitud se presenta de forma muy general, tal como se indica en el numeral (4.2) abarca la composición antes anotada en combinación con cualquier principio activo, y donde opcionalmente puede tener cualquier dispersante, tensioactivo, excipiente, etc. por lo tanto se puede derivar del documento D2. De otra parte el arte previo divulga el uso de mezclas eutécticas para formulaciones farmacéuticas, agrícolas, hortícolas etc, con el propósito de superar las desventajas en el manejo de formulaciones líquidas o en polvo.

Los documentos D3 (páginas 11 a 12, 21 a 23, reivindicaciones) y D4 (resumen, reivindicaciones, col 2 a 13) divulgan al igual que D2, composiciones en gránulos efervescentes que comprenden una mezcla eutéctica, un ingrediente activo y excipientes

De manera que la composición farmacéutica tal como se reivindica, se puede derivar del arte previo, dado que se puede combinar un ingrediente activo cualquiera con una mezcla eutéctica, o sea se trata del uso de la mezcla eutéctica para formulaciones farmacéuticas sólidas.

En cuanto al procedimiento para la preparación farmacéutica, de la reivindicación N° 24, éste no presenta ninguna etapa o condición específica, simplemente se trata de un método general para la elaboración de formas sólidas como se desprende de cualquiera de los documentos citados. En cuanto a las reivindicaciones dependientes 25 a 32, nuevamente se indica que no proporcionan o aportan ninguna característica técnica particular del procedimiento.

7. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	US3.800.038	1,2,14 y 24 a 25	Novedad
D2	WO 01/80822	1,2,14 y 24 a 25	Novedad
		1-32	Nivel inventivo
D3	US6.071.539	1,2,14 y 24 a 25	Novedad
		1-32	Nivel inventivo
D4	US6.488.961	1,2,14 y 24 a 25	Novedad
		1-32	Nivel inventivo

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 60 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 N° 10 de 2001.



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 23/05/2013

CONCEPTO TÉCNICO No. 620	EXAMINADOR TÉCNICO No.202013	Código
--------------------------	---------------------------------	--------

[54] UTERINE ADMINISTRATION OF EUTECTIC
SOLID SOLUTIONS OF STEROID
HORMONES IN A STEROIDAL LIPID
CARRIER

[75] Inventor: Harry W. Rudel, New York, N.Y.

[73] Assignee: Biological Concepts, Inc., New
York, N.Y.

[22] Filed: Apr. 21, 1972

[21] Appl. No.: 246,171

Related U.S. Application Data

[63] Continuation-in-part of Ser. No. 138,317, April 28,
1971, abandoned.

[52] U.S. Cl. 424/239, 424/242, 128/13 D,
128/264, 128/271

[51] Int. Cl. A61k 17/00

[58] Field of Search 424/236, 238, 239

References Cited

OTHER PUBLICATIONS

Snart, R. S. Nature 215:957-958 Aug. 26, 1967 "Liq-

uid Crystalline Behaviour in Mixtures of Cholesterol
With Steroid Hormones"

Fuenzalida, F., J. Clin. Endocrinology 10:1511-1516
(1950) "Absorption of Steroids From Subcutaneously
Implanted Tablets of the Pure Hormone and of the
Hormone Mixed with Cholesterol"

Kincl et al., Acta Endocrinologica 64:253-264 June
1970 "Sustained Release Hormonal Preparations-Dif-
fusion of Various Steroids From Cholesterol Pellets"

Primary Examiner—Shep K. Rose

[57]

ABSTRACT

A pharmaceutical preparation suitable for parenteral
administration comprises an active therapeutic ingre-
dient in solid solution with a steroidal lipid carrier.
The therapeutic ingredient may be for example, a nat-
ural or synthetic steroid hormone, a prostaglandin, or
an antibiotic.

6 Claims, No Drawings

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
1 November 2001 (01.11.2001)

PCT

(10) International Publication Number
WO 01/80822 A2

- (51) International Patent Classification⁷: **A61K 9/00**
- (21) International Application Number: **PCT/EP01/05017**
- (22) International Filing Date: **20 April 2001 (20.04.2001)**
- (25) Filing Language: **English**
- (26) Publication Language: **English**
- (30) Priority Data:
09/553,528 20 April 2000 (20.04.2000) **US**
- (71) Applicant (*for all designated States except US*): **LABORATOIRES DES PRODUITS ETHIQUES ETHYPHARM S.A.** [FR/FR]; 21, rue Saint Matthieu, F-78550 Houdan (FR).
- (72) Inventors; and
- (75) Inventors/Applicants (*for US only*): **ROBINSON, Joseph, R.** [US/US]; 41 Chequamegon Bay, Madison, WI 53719 (US). **McGINITY, James, William** [US/US]; 4209 Dunning Lane, Austin, TX 78746 (US). **DELMAS, Pascal** [FR/CA]; 97 McCulloch, Outremont, Quebec H2Y 3L8 (CA).
- (74) Agents: **TOUATI, Catherine** et al.; Cabinet Plasseraud, 84, rue d'Amsterdam, F-75440 Paris Cedex 09 (FR).
- (81) Designated States (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (84) Designated States (*regional*): ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- Published:**
— *without international search report and to be republished upon receipt of that report*
- For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.*



WO 01/80822 A2

(54) Title: **EFFERVESCENT GRANULES AND METHODS FOR THEIR PREPARATION**

(57) Abstract: Disclosed here are effervescent granules having a controllable rate of effervescence. In some embodiments, the such granules comprise an acidic agent, an alkaline agent, a pharmacologically active agent, hot-melt extrudable binder capable of forming a eutectic mixture with the acidic agent and, optionally, a plasticizer. The effervescent granules are made by a hot-melt extrusion process. The present invention also provides a thermal heat process for preparing a pharmacologically active agent containing effervescent granule. In certain aspects, the granules contain pharmacologically active agents such as narcotics, antidiarrheal agents, antiviral agents, anxiolytic agents, a cholesterol lowering agent, an alpha adrenergic blocking agent, a phenanthrene derivative. By way of example, some of the narcotics that may be included in the granules and in the process of preparing the granules include, by way of example: phenanthrene derivatives (e.g., morphine sulfate), and morphine derivatives (e.g., hydromorphone hydrochloride).



US006071539A

86

United States Patent [19]
Robinson et al.

[11] **Patent Number:** **6,071,539**
 [45] **Date of Patent:** **Jun. 6, 2000**

[54] **EFFERVESCENT GRANULES AND
 METHODS FOR THEIR PREPARATION**

[75] **Inventors:** **Joseph R. Robinson, Madison, Wis.;**
James W. McGinity, Austin, Tex.

[73] **Assignee:** **Ethypharm, SA, France**

[21] **Appl. No.:** **08/934,109**

[22] **Filed:** **Sep. 19, 1997**

Related U.S. Application Data

[60] **Provisional application No.** 60/026,991, Sep. 20, 1996.

[51] **Int. Cl.⁷** **A61K 9/46; A61K 9/16;**
A61K 9/20

[52] **U.S. Cl.** **424/466; 424/464; 424/489;**
424/490

[58] **Field of Search** **424/405, 464,**
424/465, 466, 489, 490, 497

[56] **References Cited**

U.S. PATENT DOCUMENTS

1,262,888	4/1918	Westlake	424/44
3,653,914	4/1972	Schmitt	426/302
3,667,929	6/1972	Fleming, Jr.	504/151
3,962,417	6/1976	Howell	424/52
4,004,036	1/1977	Schmitt	426/285
4,153,678	5/1979	Quinlan	424/44

4,267,164	5/1981	Yeh et al.	424/44
4,613,497	9/1986	Chavkin	424/44
4,639,368	1/1987	Niazi et al.	424/48
4,659,696	4/1987	Hirai et al.	514/15
4,670,419	6/1987	Uda et al.	514/16
4,687,662	8/1987	Schobel	424/44
4,689,218	8/1987	Gazzaniga et al.	424/43
4,725,427	2/1988	Ashmead et al.	424/44
4,753,792	6/1988	Aberg	424/44
4,812,303	3/1989	Iorio	424/44
4,940,588	7/1990	Sparks et al.	424/490
5,055,306	10/1991	Barry et al.	424/482
5,100,674	3/1992	Ser et al.	424/466
5,178,878	1/1993	Wehling et al.	424/466
5,223,246	6/1993	Kondo et al.	424/44

Primary Examiner—Robert H. Harrison

Attorney, Agent, or Firm—Locke Liddell & Sapp LLP;
 Denise L. Mayfield

[57] **ABSTRACT**

According to the present invent, effervescent granules having a controllable rate of effervescence are provided. Such granules comprise an acidic agent, an alkaline agent, a hot-melt extrudable binder capable of forming a eutectic mixture with the acidic agent and, optionally, a plasticizer. The effervescent granules are made by a hot-melt extrusion process.

16 Claims, No Drawings



US006488961B1

8X

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

(10) **Patent No.:** **US 6,488,961 B1**
(45) **Date of Patent:** ***Dec. 3, 2002**

(54) **EFFERVESCENT GRANULES AND
METHODS FOR THEIR PREPARATION**

6,071,539 A * 6/2000 Robinson et al. 424/466

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

(75) Inventors: **Joseph R Robinson**, Madison, WI
(US); **James W. McGinity**, Austin, TX
(US)

(73) Assignee: **Ethypharm, Inc.** (FR)

(*) 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.: **09/468,513**

(22) Filed: **Dec. 21, 1999**

Related U.S. Application Data

(60) Provisional application No. 60/026,991, filed on Sep. 20,
1996.

(51) Int. Cl.⁷ **A61K 9/46**; **A61K 9/16**;
A61K 9/20

(52) U.S. Cl. **424/466**; **424/43**; **424/464**;
424/489; **424/44**

(58) Field of Search **424/466**, **44**, **464**,
424/489, **43**

(56) **References Cited**

U.S. PATENT DOCUMENTS

1,262,888 A	4/1918	Westlake
3,667,929 A	6/1972	Fleming
3,962,417 A	6/1976	Howell
4,153,678 A	5/1979	Quinlan
4,267,164 A	5/1981	Yeh
4,613,497 A	9/1986	Chaukin
4,639,368 A	1/1987	Niazi
4,687,662 A	8/1987	Schobel
4,725,427 A	2/1988	Ashmead
4,753,792 A	6/1988	Aberg
4,940,588 A	7/1990	Sparks
5,055,306 A	10/1991	Barry
5,100,674 A	3/1992	Ser
5,178,878 A	1/1993	Wehling

BE	664197	11/1965
DE	1938709	4/1970
DE	2020893	11/1970
EP	0189114	7/1986
EP	0190689	8/1986
EP	0217631	4/1987
EP	0396335	11/1990
GB	0003160	10/1872
GB	917456	2/1963
GB	1055854	1/1967
GB	1276839	6/1972
GB	1300998	12/1972
GB	1370766	10/1974
GB	2019844	11/1979
GB	2083997	4/1982

* cited by examiner

Primary Examiner—Jose' G. Dees

Assistant Examiner—Mina Haghighatian

(74) *Attorney, Agent, or Firm*—Denise L. Mayfield;
Lathrop & Gage L.C.

(57) **ABSTRACT**

Disclosed here are effervescent granules having a control-
lable rate of effervescence. In some embodiments, the such
granules comprise an acidic agent, an alkaline agent, a
pharmacologically active agent, hot-melt extrudable binder
capable of forming a eutectic mixture with the acidic agent
and, optionally, a plasticizer. The effervescent granules are
made by a hot-melt extrusion process. The present invention
also provides a thermal heat process for preparing a phar-
macologically active agent containing effervescent granule.
In certain aspects, the granules contain pharmacologically
active agents such as narcotics, antidiarrheal agents, anti-
viral agents, anxiolytic agents, a cholesterol lowering agent,
an alpha adrenergic blocking agent, a phenanthrene deriva-
tive. By way of example, some of the narcotics that may be
included in the granules and in the process of preparing the
granules include, by way of example: phenanthrene deriva-
tives (e.g., morphine sulfate), and morphine derivatives
(e.g., hydromorphone hydrochloride).

52 Claims, No Drawings