

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTAR

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

Organizacion CSA Ltda

1/2

00-39195

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO Formas poliformas de un citrato de 97obiciob [2,2,2] acton -3-amina y sus composiciones farmaceuticas

* Nuevo título (folio 46)

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL A61K 31/13 // 31/395

71. SOLICITANTE Pfizer Products INC.

DOMICILIO Eastern Point Road, Groton. - U.S.A.

74. APODERADO Carlos R. Olarte

22. BOGOTÁ, D. C., 00-05-26

202038

2010107



DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social

PFIZER PRODUCTS INC.

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

ESTADOS UNIDOS DE AMERICA.

Departamento o Estado

ESTADO DE CONNECTICUT

Dirección

EASTERN POINT ROAD, GROTON, CONNECTICUT 06340

Ciudad

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

CARLOS R. OLARTE

Dirección

CALLE 35 No. 7-25 Piso 4

Ciudad

SANTAFE DE BOGOTÁ

Teléfono

285-14-00/570-0010

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

MICHAEL JAMES CASTALDI, GEORGE JOSEPH QUALLICH,
LEWIN THEOPHILUS WINT.

Identificación

Dirección

Ciudad

Teléfono

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención FORMAS POLIMORFAS DE UN CITRATO DE AZOBICICLO [2,2,2]OCTAN-3-AMINA Y SUS COMPOSICIONES FARMACEUTICAS.

PRIORIDAD REIVINDICADA

SI ☒

NO ☐

TIPO DE PRIORIDAD

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) País

US

(32) Fecha

Junio 1, 1999

(31) No. Solicitud

60/136,992

Para Publicar a los

☐ 6 meses

☐ 12 meses

☒ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica☒

Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC *Adjunto*☒

Recibo de la tasa respectiva☒

Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras de la publicación☐

Si se reivindica prioridad Andina:☐

Copia de la primera solicitud☐

Traducción oficial☐

Si se reivindica prioridad Unionista:☐

Copia certificada de la primera solicitud☒

Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior

Traducción simple☒

Capítulo descriptivo☒

Dibujos, planos necesarios☐

Capítulo reivindicatorio☒

Tarjeta archivo propietarios según formato☒

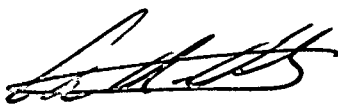
Tarjeta archivo temático según formato☒

Extracto para publicación según formato☒

Arte final 12 x 12 y 6 x 6 cms☐

Otros Documentos☐

SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO
QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA 

NOMBRE CARLOS R. OLARTE

CC. 79.782.747 de Bogotá

T.P.No. 74.295



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

3
R

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 00039195 00000000

Folios: 39

Fecha (AMD): 2000-05-26 17:10:29

Tracite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 900174000-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 30,063
FECHA : MAYO 12 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	Nº. PAGO	Vr. PAGO
JOSÉ LUIS GOMEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	596315	16,450,000.00

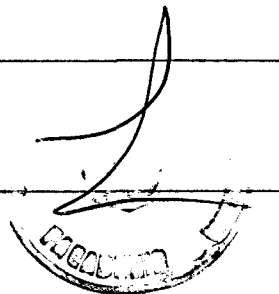
***** CONCEPTO *****

CANT. CONCEPTOS	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 00005 01 01	SOLICITUDES	
1	TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	600,000.00
	TOTAL :	\$ 608,000.00

SOM: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE N.º. _____



Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

47

pot

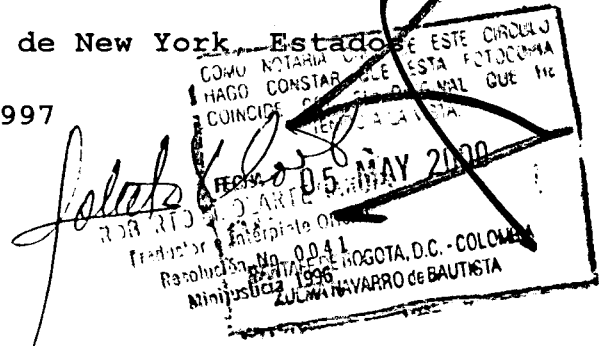
Raisbeck, Lara, Rodríguez
Miembros de la Firma
BAKER & MCKENZIE
Abogados
Apartado Aéreo 3746
Teléfono : 285-1400
Santa fe de Bogotá, D.C.
Colombia

PODER

La abajo firmante **PFIZER PRODUCTS INC.**, una sociedad constituida bajo las leyes del Estado de Connecticut, Estados Unidos de América, domiciliada en **Eastern Point Road, Groton Connecticut 06340, Estados Unidos de América**, declara por el presente otorgar a **ALVARO CORREA ORDOÑEZ y/o JAMES W.F. RAISBECK y/o LUZ HELENA VILLAMIL y/o CARLOS R. OLARTE** poder especial amplio y bastante para recabar de las oficinas y autoridades nacionales que correspondan, la obtención de: **Registro de marcas, renovaciones, fusiones, cambios de nombre, traspasos, presentación y tramitación de oposiciones, depósitos de nombres comerciales, cambios de dirección registro de patentes de invención, fusiones, cambios de nombre, traspasos, presentación y tramitación de oposiciones, cambios de dirección**, a cuyo efecto los faculta para dar ante dichas autoridades, todos los pasos necesarios al objeto indicado, elevar solicitudes, formular descripciones, protestas, declaraciones, apelaciones y reclamos, oblar impuestos, solicitar testimonios, recibir documentos y valores, desistir y percibir. Se concede a los expresados mandatarios poder bastante par recibir notificaciones a nombre de la compañía, otorgar poderes a quien vayan a representar a la compañía judicial y estrajudicialmente, responder en juicio a todas las reclamaciones o demandas que por motivo de las marcas se presentaren y hacer cuanto fuere necesario, ante las autoridades administrativas o judiciales de cualquier orden, dándoles asimismo facultad para sustituir el presente y en caso necesario revocar dichas sustituciones.

Dado y firmado en Nueva York, Estado de New York, ~~Estado de Nueva York~~ **Estados Unidos de América.**

A los 8 días del mes de Octubre de 1997



PFIZER PRODUCTS INC.

(Firma ilegible)

ALLEN J. SPIEGEL

Vicepresidente

Estado de nueva York)

Condado de nueva York)

SUSCRITO Y JURADO ante mí a los 8 días del mes de octubre de 1997.

Firmado John (ilegible)

JOHN ALPHONSO

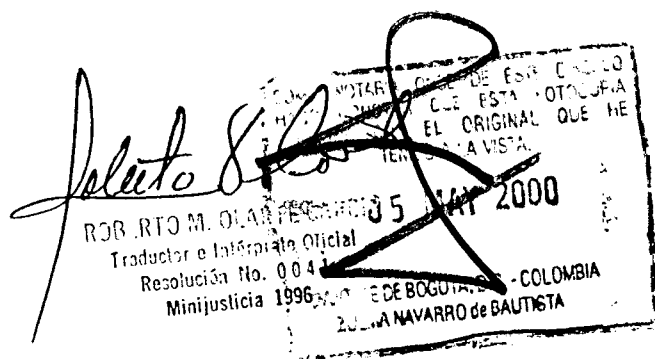
Notario Público, Estado de Nueva York

No. 30-4859888

Calificado en el Condado de Nassau

Certificado Registrado en el Condado de Nueva York

Comisión expira el 19 de mayo de 1998



64

Raisbeck, Lara, Rodríguez
Miembros de la Firma
BAKER & MCKENZIE
Abogados
Apartado Aéreo 3746
Teléfono : 285-1400
Santa fe de Bogotá, D.C.
Colombia

CERTIFICADO NOTARIAL

A los 8 días del mes de Octubre de 1997, el suscrito Notario

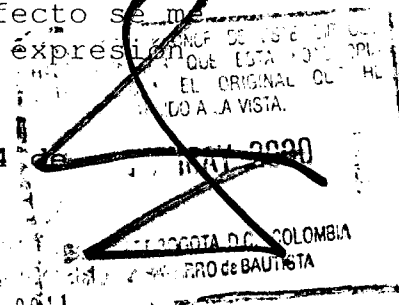
DA FE

1. Que **ALLEN J. SPIEGEL**, mayor y domiciliado en **Nueva York, Estado de New York, Estados Unidos de América**, suscribió de su puño y letra el siguiente documento que antecede
2. Que conozco al otorgante y que éste tiene capacidad legal para el otorgamiento.
3. Que el otorgante ha suscrito el referido documento en su carácter de **Vicepresidente** de la persona jurídica **PFIZER PRODUCTS INC.**
4. Que la persona jurídica **PFIZER PRODUCTS INC.** con sede en **Eastern Point Road, Groton, Connecticut 06340, Estados Unidos de América** está legalmente constituida, que tiene existencia legal actual y que el acto para el cual se ha otorgado el poder está comprendido entre los que constituyen su objeto social.
5. Que el otorgante efectivamente tiene la representación que ostenta y que ésta es legítima.
6. Que he basado las certificaciones 3, 4 y 5 anteriores en los siguientes documentos auténticos que al efecto se me exhibieron y que menciono específicamente con expresión de sus fechas y de su origen o procedencia

Resolución de Pfizer Products Inc. de fecha 24 de febrero de 1997.

[Firma manuscrita]

Minijusticia 1996



Firmado John (ilegible)

JOHN ALPHONSO

El Notario Público

Notario Público, Estado de Nueva York

No. 30-4859888

Calificado en el Condado de Nassau

Certificado Registrado en el Condado de Nueva York

Comisión expira el 19 de mayo de 1998-08-13

Estado de Nueva York)

)b.j.

Condado de Nueva York)

No. 21320

Yo, **NORMAN GOODMAN**, Funcionario del Condado y Funcionario de la Corte Suprema del Estado de Nueva York, en y para el Condado de Nueva York, una Corte de Registro, poseedor, por ley, un sello, CERTIFICO POR EL PRESENTE que

JOHN ALPHONSO

A través de quién se ejecutó el anterior reconocimiento de prueba, y cuyo nombre está suscrito en el mismo, era en el momento de ejecutar dicha prueba, un NOTARIO PUBLICO residente en el Estado de Nueva York, debidamente comisionada juramentada y autorizada por las leyes de dicho Estado, para tomar tales reconocimiento de prueba de escrituras y de otros instrumentos por escrito para ser registrados en dicho estado, y para tomar juramentos o afirmaciones en dicho Condado; que he comparado la firma de dicho NOTARIO PUBLICO con el ejemplar de su firma del archivo de mi oficina y creo firmemente que la firma del anterior certificado original es genuina.

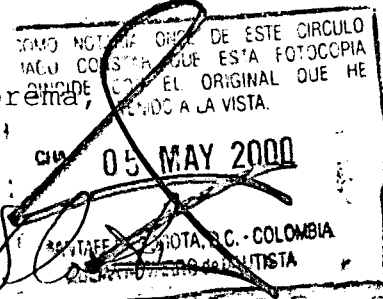
EN TESTIMONIO DE LO CUAL, fijo mi firma y sello este 14 de octubre de 1997.

Firma ilegible

Funcionario del Condado

Funcionario de la Corte Suprema,

Condado de Nueva York



Resolución No. 0041
Minijusticia 1996

Legalización No. **148381** del Consulado de Colombia en Nueva York de la firma de Norman Goodman como Funcionario del Condado de Nueva York. Julio 31 de 1997.

Firma ilegible

Federico Mejía Mejía

Cónsul de Colombia

Legalización No. **065918** del Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia de la firma de Federico Mejía como Cónsul de Colombia en Nueva York, Estados Unidos de América. Santa fe de Bogotá, agosto 13 de 1998.

Firma ilegible

Jefe de Legalizaciones

Traducción Oficial, de un texto del idioma inglés.
Traducción Oficial realizada por **ROBERTO M. OLARTE GARCIA**, Traductor e intérprete oficial juramentado según Resolución 0041 del Ministerio de Justicia 1996. Santa fe de Bogotá, agosto 13, 1998.

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

98 AUG 19 AM 9:53

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTA FE DE BOGOTA D.C.

Roberto M. Olarte Garcia
ROBERTO M. OLARTE GARCIA
Traductor e intérprete oficial
Resolución No. 0041
Minijusticia 1996

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

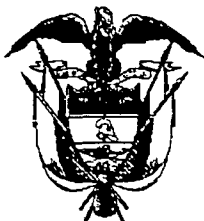
173812

CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

COMO NOTARIA ONCE DE ESTE CIRCULO
HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA
COINCIDE CON EL ORIGINAL DEL NO
TENDO A LA VISTA.

FECHA 05 MAY 2000

SANTA FE DE BOGOTA D.C. COLOMBIA
ZULMA NAVARRO G3 BAUTISTA



CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA

10 EAST 46TH STREET, NUEVA YORK, NY 10017

TEL. (212) 370-0004 FAX (212) 972-1725

EL SUSCRITO CONSUL DE COLOMBIA

VISTOS LOS DOCUMENTOS PRESENTADOS POR LOS INTERESADOS

CERTIFICA:

Que el (la) Sr.(a) NORMAN GOODMAN, Clerk del Condado de New York Estados Unidos de América, certifica que JOHN ALPHONSO es Notario Público del Estado de New York y que ejercía en la fecha las funciones allí expresadas y que la firma y sellos que en el documento aparecen como suyos son los que usa y acostumbra en sus actos oficiales.

Que el notario citado autenticó el documento adjunto firmado por ALLEN J. SPIEGEL en su calidad de VICEPRESIDENTE de la firma PFIZER PRODUCTS INC., compañía legalmente constituida y existente de acuerdo con las leyes de su país y cumple con su objeto social de acuerdo con las mismas.

Que ha tenido a la vista los documentos probatorios de los hechos citados y constatados por el Notario Público y el County Clerk de New York, los cuales forman parte integral del presente documento.

Se expide esta certificación en concordancia con el artículo 259 del Código de Procedimiento Civil y 480 del Código de Comercio a solicitud del interesado a los 31 días del mes de Julio de 1998.

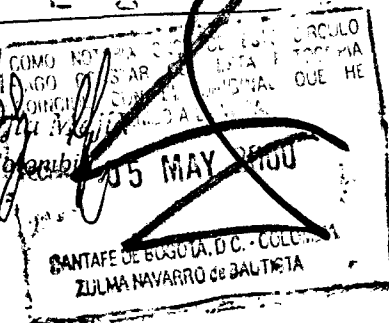
NO SE ASUME RESPONSABILIDAD POR EL CONTENIDO DE LOS DOCUMENTOS ADJUNTOS.

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE Y DERECHOS CONSULARES

VALOR CINCUENTA Y SEIS DOLARES US\$56.00 RECIBO No. 14881



Federico Mejia
Cónsul de Colombia





MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

Feber. Co
065418

CUYA FIRMA APARECE EN:
DOCUMENTO DESEMPEÑANDO
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

98 AUG 13 AM 9:15

MAJ
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.



16
17

State of New York
County of New York, } ss.:

NEW YORK

21320

Form 1

I, NORMAN GOODMAN, County Clerk of the Supreme Court of the State of New York, in and for the County of New York, a Court of Record, having by law a seal, DO HEREBY CERTIFY pursuant to the Executive Law of the State of New York, that

John Alphonso

name is subscribed to the annexed affidavit, deposition, certificate of acknowledgment or proof, was at the time of taking the same a NOTARY PUBLIC in and for the State of New York duly commissioned, sworn and qualified to act as such; that pursuant to law, a commission or a certificate of his official character, with his autograph signature has been filed in my office; that at the time of taking such proof, acknowledgment or oath, he was duly authorized to take the same; that I am well acquainted with the handwriting of such NOTARY PUBLIC or have compared the signature on the annexed instrument with his autograph signature deposited in my office, and I believe that such signature is genuine.

IN WITNESS WHEREOF, I have hereunto set my hand affixed my official seal this

OCT 1 1997

FEE PAID \$3.00

Norman Goodman

County Clerk and Clerk of the Supreme Court, New York County

COMO AL DIA DE ESTE CIRCULO
HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA
COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE
TENIDO A LA VISTA
05 MAY 2000
SANTAFE DE BOGOTA, D.C. - COLOMBIA
ZULMA NAVARRO BAUTISTA

RAISBECK, LARA, RODRIGUEZ & RUEDA

Members of the Firm

BAKER & MCKENZIE

ATTORNEYS AT LAW

APARTADO AEREO 3746

TELEFONO: 285-1400

SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

COLOMBIA

POWER OF ATTORNEY

The undersigned, PFIZER PRODUCTS INC., a corporation organized under the laws of the State of Connecticut, United States of America, located in Eastern Point Road, Groton Connecticut 06340, United States of America, declares that it hereby grants to

ALVARO CORREA ORDOÑEZ and/or
JAMES W.F. RAISBECK and/or
LUZ HELENA VILLAMIL and/or
CARLOS R. OLARTE

a full and sufficient power of attorney to apply to the proper national officers and authorities for the issue of:

Trademark registrations, renewals, mergers, changes of name, assignments, filing and prosecution of oppositions, deposit of commercial names, changes of address.

Letters Patent, mergers, changes of name, assignments, filing and prosecution of oppositions, changes of address,

to which end it empowers them to take all steps necessary before said authorities for the objects stated, to file petitions, prepare descriptions, make protests, declarations, appeals and objections, pay imposts, apply for certifications, receive documents and securities, abandon applications and collect refunds. To the said mandatories sufficient power is granted hereby to receive notifications for and on behalf of the Company, to confer powers on those who are to represent the company judicially and extrajudicially, to answer in court in the matter of all claims and demands that may be presented in connection with the marks, and to do everything that may be required, before administrative or judicial officers of any class, giving them likewise power to substitute these presents and revoke such substitutions if necessary.

Done and subscribed in New York, New York, USA

Dated 08 October 1997

PFIZER PRODUCTS INC.

Allen J. Spiegel
ALLEN J. SPIEGEL
VICE PRESIDENT

PODER

La abajo firmada

PFIZER PRODUCTS INC.

domicilada en
Eastern Point Road, Groton
Connecticut 06340,
Estados Unidos de América.

declara por el presente otorgar a
ALVARO CORREA ORDOÑEZ y/o
JAMES W. F. RAISBECK y/o
LUZ HELENA VILLAMIL y/o
CARLOS R. OLARTE

poder especial amplio y bastante para recabar de las oficinas y autoridades nacionales que correspondan, la obtención de: Registro de marcas renovaciones, fusiones, cambios de nombre, trasposos, presentación y tramitación de oposiciones, depositos de nombres comercia-
les, cambios de direccion. continua atras a
a cuyo efecto los faculta para dar ante dichas autoridades, todos los pasos necesarios al objeto indicado, elevar solicitudes, formular descripciones, protestas, declaraciones, apelaciones y reclamos, oblar impuestos, solicitar testimonios, recibir documentos y valores, desistir y percibir. Se concede a los expresados mandatarios poder bastante para recibir notificaciones a nombre de la compañía, otorgar poderes a quienes vayan a representar a la compañía judicial y extrajudicialmente, responder en juicio a todas las reclamaciones o demandas que por motivo de las marcas se presentaren y hacer cuanto fuere necesario, ante las autoridades administrativas o judiciales de cualquier orden, dándoles asimismo facultad para sustituir el presente y en caso necesario revocar dichas sustituciones.

Dado y firmado en New York, Estados Unidos de América.
New York, Estados Unidos de América.

a los 8 días del mes de Octubre/1997

State of New York)
County of New York)

SUBSCRIBED AND SWORN to before me this
8th day of October 1997.

John Alphonso
JOHN ALPHONSO
Notary Public, State of New York
No. 30-4859888
Qualified in Nassau County
Certificate filed in New York County
Commission Expires May 19, 1998



* Continuación...

Registro de Patentes de Invención,
fusiones, cambios de nombre,
traspasos, presentación y
tramitación de oposiciones,
cambios de dirección.

RAISBECK, LARA, RODRIGUEZ & RUEDA

Members of the Firm

BAKER & MCKENZIE

ATTORNEYS AT LAW

APARTADO AEREO 3746

TELEFONO: 285-1400

SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

COLOMBIA

NOTARIAL CERTIFICATION

On this 8th day of October

1997, the undersigned Notary

CERTIFICACION NOTARIAL

A los 8 dias del mes de Octubre

de 19 97, el suscrito Notario

CERTIFIES

1. ALLEN J. SPIEGEL

of legal age and domiciled in New York, New York,
United States of America,

set his hand on the foregoing document

2. That the grantor is to me personally know and that he/she has
legal capacity to execute the instrument

3. That the grantor has executed the foregoing docuemnt
as

VICE PRESIDENT

of the juridical person

PFIZER PRODUCTS INC.

4. That the juridical person
PFIZER PRODUCTS INC.

having its home office in Eastern Point Road, Groton,
Connecticut 06340, United States of America,

is duly organized, has present existence and that the purposes for
which the power of attorney is within the scope of its corporate
purposes.

5. That the grantor ha in fact the referred to authority and that his/her
representation is legal.

6. That I have based certifications 3, 4 and 5 above on the following authentic
documents for such purpose exhibited to me and which I mention
specifically, giving their dates and their origin or source:

Resolution of Pfizer Products Inc. dated
24 February 1997.

JOHN ALPHONSO

Notary Public, State of New York

Notary No. 501859888

Qualified in Nassau County

Certificate filed in New York County

Commission Expires May 19, 1998

DA FE

1. Que ALLEN J. SPIEGEL

mayor y domiciliado en
New York, Estado de New York,
Estados Unidos de América.
suscribio de su puño y letra el documento que antecede

2. Que conozco al otorgante y que éste tiene capacidad legal
para el otorgamiento

3. Que el otorgante ha suscrito el referido documento en su
carácte de:

Vice-presidente

de la persona juridica

PFIZER PRODUCTS INC.

4. Que la persona juridica

PFIZER PRODUCTS INC.

con sede en
Eastern Point Road, Groton,
Connecticut 06340, Estados Unidos de América
está legalmente constituida, que tiene existencia legal y que el
acto para el cual se ha otorgado el poder está comprendido entre los
que constituyen su objeto social

5. Que el otorgante efectivamente tiene la representación que ostenta
y que esta es legitima

6. Que he basado las certificaciones 3, 4 y 5 anteriores en los
siguientes documentos auténticos que al efecto se me exhibieron y
que menciono específicamente con expresión de sus fechas y de su
origen o procedencia:

Resolución de Pfizer Products Inc, de
fecha 24 de febrero de 1997.

El Notario Público

12/12

13
f

Esta es una traducción parcial al idioma español de un documento escrito originalmente en el idioma inglés.

5

LOS ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

A TODOS AQUELLOS A QUIEN ESTE DOCUMENTO SE LES PRESENTE:

DEPARTAMENTO DE COMERCIO DE LOS ESTADOS UNIDOS

10

Oficina de Patentes y Marcas de los Estados Unidos

Febre^ro 15, 2000

15

ESTO ES PARA CERTIFICAR QUE LO ANEXADO A LA PRESENTE ES UNA FIEL COPIA DE LOS EXPEDIENTES DE LA OFICINA DE PATENTES Y MARCAS DE LOS ESTADOS UNIDOS DE AQUELLOS DOCUMENTOS DE LA SOLICITUD DE PATENTE IDENTIFICADA A CONTINUACION QUE REUNIERON LOS REQUERIMIENTOS PARA QUE SE LE CONCEDA UNA FECHA DE PRESENTACION BAJO 35 USC (Código de los Estados Unidos)

20

111.

NO. DE SOLICITUD: 60/136,992

FECHA DE PRESENTACION: 1 de Junio de 1999

25

SELLO DE LA
OFICINA DE MARCAS Y PATENTES
DE LOS ESTADOS UNIDOS DE

Por la Autoridad del
COMISIONADO DE PATENTES Y MARCAS

[firma ilegible]

30

T. WALLACE
Oficial de Certificación

-7-

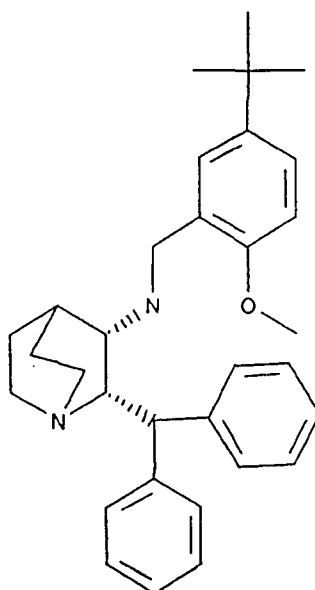
Habiendo descrito la invención como antecede, se declara como propiedad lo contenido en las siguientes

Reivindicaciones

- 5 1. Una forma cristalina del citrato de (2S, 3S)-N-(metoxi-5-t-butilfenilmetil-2-difenilmetil-1-azobiciclo[2,2,2] octan-3-amina de fórmula:

10

15



en la que dicha forma cristalina es la forma polimorfa A estable que presenta el patrón de difracción de rayos X
20 siguiente

N° pico	1	2	3	4	5	6	7
espacios d	13,28	7,70	7,45	6,34	5,33	5,06	4,40

-8-

2. La forma polimorfa del citrato monohidrato de acuerdo con la reivindicación 1 en la que su hábito cristalino predominante son placas.

3. La forma polimorfa del citrato monohidrato de
5 acuerdo con la reivindicación 1 en la que el citrato monohidrato no es higroscópico.

4. La forma polimorfa del citrato monohidrato de acuerdo con la reivindicación 1 en la que la volatilización tiene lugar a aproximadamente 116°C.

10 5. El polimorfo del citrato monohidrato de acuerdo con la reivindicación 1 en el que la temperatura de comienzo de la fusión es de aproximadamente 152,7°C.

6. Una composición farmacéutica que presenta actividad antagonista del receptor NK-1 activo del SNC que comprende
15 la forma polimorfa de acuerdo con la reivindicación 1, en una cantidad eficaz para el tratamiento de la emesis, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

7. Un procedimiento de tratamiento de la emesis que comprende la administración a un paciente en necesidad de
20 tratamiento de una cantidad antieméticamente eficaz de la forma polimorfa A del compuesto de la reivindicación 1.

8. Un procedimiento de producción de la forma polimorfa cristalina de la sal citrato monohidrato de (2S, 3S) -N-(metoxi-5-t-butilfenilmetil-2-difenilmetil-1-
25 azobiciclo[2,2,2]octan-3-amino que comprende:

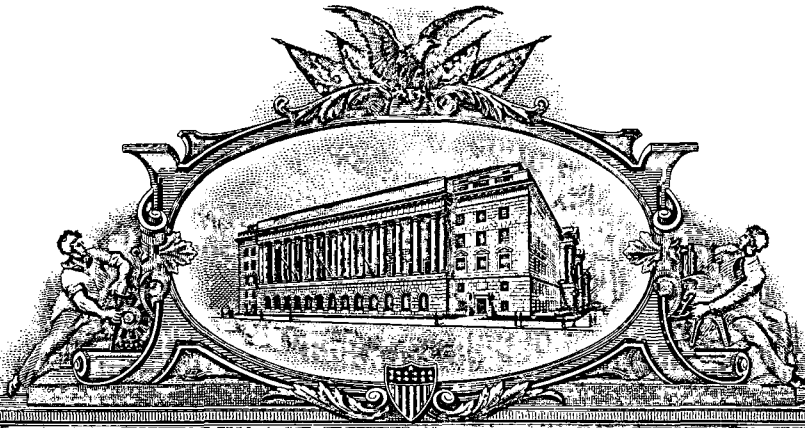
-9-

la adición de ácido cítrico a una disolución de la base libre en acetona; la disolución del sólido durante aproximadamente 2 horas; la filtración y agitación de la solución transparente durante la noche; la adición de
5 isopropil éter filtrado seguido de la adición de agua filtrada; la agitación de la mezcla resultante a temperatura ambiente hasta el comienzo de la cristalización, granulación durante aproximadamente 16 horas; y la recogida de la sal blanca cristalina formada por filtración y su secado a
10 aproximadamente 45°C en vacío con purga con nitrógeno durante aproximadamente 24 horas.

9. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 8 en el que la suspensión se lleva a cabo en condiciones ambientales durante aproximadamente 1,5 a 72 horas de
15 granulación en isopropil éter, alcohol isopropílico y agua.

10. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 8 en el que el ácido cítrico es anhidro en más del 99,5%.

PA 205715



THE UNITED STATES OF AMERICA

TO ALL TO WHOM THESE PRESENTS SHALL COME:

UNITED STATES DEPARTMENT OF COMMERCE

United States Patent and Trademark Office

February 15, 2000

THIS IS TO CERTIFY THAT ANNEXED HERETO IS A TRUE COPY FROM THE RECORDS OF THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE OF THOSE PAPERS OF THE BELOW IDENTIFIED PATENT APPLICATION THAT MET THE REQUIREMENTS TO BE GRANTED A FILING DATE UNDER 35 USC 111.

APPLICATION NUMBER: 60/136,992

FILING DATE: *June 01, 1999*



By Authority of the
COMMISSIONER OF PATENTS AND TRADEMARKS

T. Wallace
T. WALLACE

Certifying Officer

PROVISIONAL APPLICATION COVER SHEET

A/P ROV

18
17

06/01/99

is a request for filing a PROVISIONAL APPLICATION under 37 CFR 1.53 (b)(2).

Docket Number		PC10216	Type a plus sign (+) inside this box	+
INVENTOR(s)/APPLICANT(s)				
LAST NAME	FIRST NAME	MIDDLE INITIAL	RESIDENCE (CITY AND EITHER STATE OR FOREIGN COUNTRY)	
Quallich	George	J.	North Stonington, CT	
Wint	Lewin	T.	Old Saybrook, CT	
Castaldi	Michael	J.	Pawcatuck, CT	
TITLE OF THE INVENTION (280 characters max)				
POLYMORPHS OF A CRYSTALLINE AZOBICYCLO (2.2.2) OCTAN-3-AMINE CITRATE AND THEIR PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS				
CORRESPONDENCE ADDRESS				
Paul H. Ginsburg Pfizer Inc 235 East 42nd Street New York, NY 10017-5755				
ENCLOSED APPLICATION PARTS (check all that apply)				
☒ Specification	Number of Pages 3	☒ Claim(s)	Number of Pages 2	pages
☐ Drawing(s)	Number of Sheets	☒ Other (specify)	Abstract 1 page	
METHOD OF PAYMENT (check one)				
☐ A check or money order is enclosed to cover the Provisional filing fees ☒ The Commissioner is hereby authorized to charge all required filing fees to, and credit any overpayment to Deposit Account Number: 16-1445. Two copies of this page are enclosed.			PROVISIONAL FILING FEE AMOUNT(\$)	\$150.00

The invention was made by an agency of the United States Government or under a contract with an agency of the United States Government.

☒ No.

☐ Yes, the name of the U.S. Government agency and the Government contract number are: _____

Respectfully submitted,

SIGNATURE

Jolene W. Appleman

DATE: 6/1/99

TYPED or PRINTED NAME Jolene w. Appleman

REGISTRATION NO: 35,428

(if appropriate)

☐ Additional inventors are being named on separately numbered sheets attached hereto.

PROVISIONAL APPLICATION FILING ONLY

USERS\DOCS\LA21952LPJWA\2\BP01\ DOC / 133909 / PROV COVER SHEET - PC10216 - 6/1/99

PROVISIONAL APP COVER SHEET, 3/99

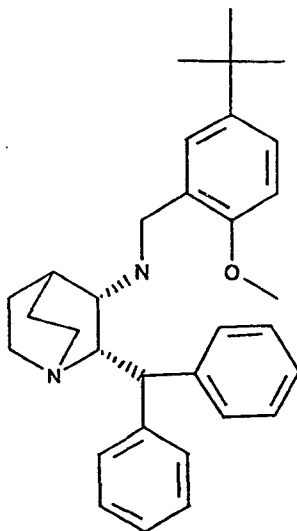
Express Mail No. EM4848528 POU5

19
2

POLYMORPHS OF A CRYSTALLINE AZOBICYCLO (2,2,2) OCTAN-3-AMINE CITRATE
AND THEIR PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS

Background of the Invention

This invention is directed to an anhydrous (2S, 3S)-N-(methoxy-5-t-butylphenylmethyl-2-diphenylmethyl-1-azobicyclo (2,2,2) octan-3-amine citrate monohydrate salt, its single crystalline polymorphic Form A, and pharmaceutical composition containing them. The invention is also directed to a CNS active NK-1 receptor antagonist for treating emesis in a mammal including humans. Treating is defined here as preventing and treating.



United States Patent Number 5,393,762 and U.S. Serial Number 08/816,016, both incorporated by reference, describe pharmaceutical compositions and treatment of emesis using NK-1 receptor antagonists. The citrate monohydrate has significantly enhanced stability over other salt forms such as the benzoate which was unstable even at 5°C. The mesylate form is deliquescent.

Summary of the Invention

The present invention relates to the citrate monohydrate of (2S, 3S)-N-(methoxy-5-t-butylphenylmethyl-2-diphenylmethyl-1-azobicyclo (2,2,2) octan-3-amine. In one embodiment of the invention, the citrate monohydrate is a crystalline stable nonhygroscopic single form. The crystalline habits are plates and are characterized by the x-ray powder defraction pattern given below:

USERS\DOCS\LA21952\LPJWA\2V8V01\ DOC / 133807

Express Mail No. EM464852880 US

70
72

Citrate Monohydrate

Peak No.	1	2	3	4	5	6	7
d space	13.28	7.70	7.45	6.34	5.33	5.06	4.40

The crystalline citrate monohydrate salt is nonhygroscopic, and is characterized by loss of water (volatilization) at about 116°C and a melt onset of at about 152.7 °C. The anhydrous citrate was converted to the monohydrate in water.

A pharmaceutical composition having CNS active NK-1 receptor antagonist activity comprises the polymorphic Form A in an amount effective in the treatment of emesis, and a pharmaceutically acceptable carrier. A method of treating emesis comprises administering to a subject in need of treatment an emetic effective amount of the polymorphic form of the compound.

A method of making the polymorphic Form A of (2S,3S)-N-(methoxy-5-t-butylphenylmethyl-2-diphenylmethyl-1-azobicyclo 2,2,2 octan-3-amine citrate monohydrate salt comprises adding citric acid to a solution of the free base in acetone. The solid was dissolved for about two hours. The clear solution was filtered and stirred overnight. Filtered isopropyl ether was added followed by the addition of filtered water. The resulting mixture was stirred at ambient temperature until crystallization started and granulated for about 16 hours. The white crystalline form was collected by filtration and dried at about 45°C under vacuum with a nitrogen purge for about 24 hours.

Detailed Description of the Invention

A method of making crystalline citrate monohydrate, polymorphic Form A comprises the addition of 353.9 gm, 1.1 equivalents of citric acid (anhydrous, 99.5+%) to a solution of the free base, 785 gm in acetone, 7.85 liters. After dissolution of the solid for about 2 hours, clear solution was filtered, stirred overnight and filtered isopropyl ether, 7.85 liters was added followed by the addition of filtered water, 334 mls. The resulting mixture was stirred at ambient temperature until crystallization started and granulated for an additional 16 hours. The white crystalline salt formed was collected by filtration and dried at 45°C under vacuum with a nitrogen purge for 24 hours to provide 992 gm, (89.9 % yield). The resulting citrate monohydrate salt, polymorphic form was characterized via PLM, X-ray powder diffraction, proton NMR, Karl Fisher, DSC and elemental analysis. X-ray powder diffraction and PLM revealed it to be crystalline. The crystalline habit encountered were plates. The most intense reflections, d spacings, observed by X-ray

powder diffraction were 13.280, 7.702, 7.446, 6.337, 5.332, 5.057, and 4.398Å. The crystals exhibited a loss of water (volatilization) at 116°C and a melt onset of 152.7 °C with decomposition. Hygroscopicity measurements demonstrated that 2.52% wt./wt. water was absorbed at 90 % RH. Karl Fisher analysis showed the presence of 2.7 % water (2.66 % theoretical) verifying that the monohydrate was synthesized. Elemental analysis validated the purity of the salt synthesized.

Slurrying the anhydrous citrate in water yields the crystalline monohydrate that does not lose its water under drying conditions, e.g., at 45°C *in vacuo*.

The effective dosage for the pharmaceutical composition of the citrate monohydrate depends on the intended route of administration, the indicator, the indication to be treated, and other factors such as age and weight of the subject. In the following dosage ranges, the terms "mg A" refers to milligrams of the monohydrate. A recommended range for oral dosing is 5-300 mgA/day, preferably 40-200 mgA/day more preferably 40-80 mgA/day, in single or divided doses. A recommended range for oral administration in oral forms such as pills or tablets is 2.5 mgA/day to 160 mgA/day and preferably 5-80 mgA/day. It can also be given by intravenous.

The following examples illustrate the methods and compounds of the present invention. It will be understood, however, that the invention is not limited to the specific Examples.

Example I

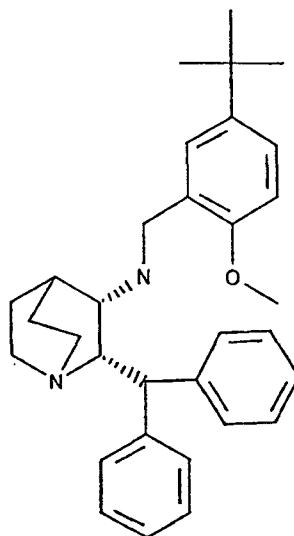
Preparation of the Crystalline Citrate Monohydrate.

A 47 gram portion of the free base was suspended in 470 milliliters of isopropyl ether under ambient conditions. To the resulting thin white slurry, 21.42 grams of anhydrous citric acid was added at room the temperature. This slurry was then used for the conversion to the monohydrate by suspending in 150 mls water for 18 hours. The slurry was filtered to give a white crystalline solid. An x-ray configuration was obtained confirming that the compound is citrate monohydrate.

22
h

We Claim

1. A crystalline forms of (2S, 3S)-N-(methoxy-5-t-butylphenylmethyl-2-diphenylmethyl-1-azobicyclo (2,2,2) octan-3-amine citrate having the formula



5 wherein said crystalline form is a stable polymorphic Form A exhibiting the X-ray powder diffraction pattern

Peak No.	1	2	3	4	5	6	7
d space	13.28	7.70	7.45	6.34	5.33	5.06	4.40

2. The citrate monohydrate polymorphic form according to claim 1 wherein its crystalline habits are plates.

10 3. The citrate monohydrate polymorphic form according to Claim 1 wherein the citrate monohydrate is nonhygroscopic.

4. The citrate monohydrate polymorphic form according to Claim 1 wherein volatilization occurs at about 116°C.

15 5. The citrate monohydrate polymorph according to Claim 1 wherein melt onset occurs at about 152.7°C.

6. A pharmaceutical composition having CNS active NK-1 receptor antagonist activity comprising the polymorphic Form according to Claim 1, in an amount effective in the treatment of emesis, and a pharmaceutically acceptable carrier.

23
12

7. A method of treating emesis which comprises administering to a subject in need of treatment an antiemetic effective amount of the polymorphic Form A of the compound of Claim 1.

8. A method of making the crystalline polymorphic Form of (2S, 3S)-N-(methoxy-5-t-butylphenylmethyl-2-diphenylmethyl-1-azobicyclo 2,2,2 octan-3-amine citrate monohydrate salt comprising:

Adding citric acid to a solution of the free base, in acetone; dissolving the solid for about 2 hours; filtering and stirring the clear solution overnight; Adding filtered isopropyl ether followed by the addition of filtered water; Stirring the resulting mixture at ambient temperature until crystallization starts and granulating for an about 16 hours; and collecting the white crystalline salt formed by filtration and drying at about 45°C under vacuum with a nitrogen purge for about 24 hours.

9. The method of claim 8 wherein the slurring is carried out under ambient conditions for about 1.5 to 72 hours granulation in isopropyl ether, isopropyl alcohol and water.

10. The method of claim 8 wherein the citric acid is greater than 99.5% anhydrous.

2025-09-26 16:00:00

Abstract

10

SECRET

FORMAS POLIMORFAS DE UN CITRATO DE AZOBICICLO[2,2,2]

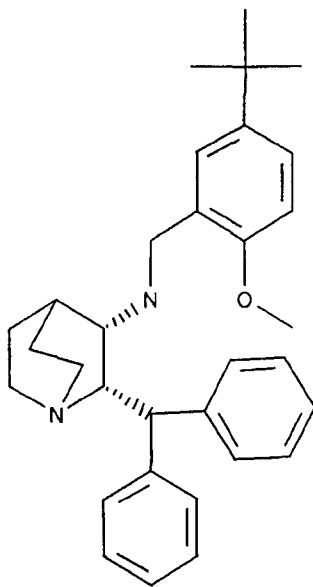
OCTAN-3-AMINA Y SUS COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS

Antecedentes de la invención

La presente invención se refiere a una sal citrato
5 monohidrato de (2S, 3S)-N-(metoxi-5-t-butilfenilmetil-2-
difenilmetil-1-azobiciclo[2,2,2] octan-3-amina anhidra, a su
forma cristalina polimorfa A individual, y a composiciones
farmacéuticas que las contienen. La invención se refiere
también a un antagonista del receptor NK-1 activo del SNC
10 para el tratamiento de la emesis en un mamífero, incluyendo
el ser humano. El término tratamiento se define en el
presente documento como prevención y tratamiento.

15

20



La Patente de Estados Unidos Número 5.393.762 y Número
de Serie de Estados Unidos 08/816.016, incorporadas ambas
25 como referencias en el presente documento, describen

composiciones farmacéuticas y el tratamientos de la emesis utilizando los antagonistas del receptor NK-1. El citrato monohidrato presenta una estabilidad significativamente mejor que otras formas de la sal tales como el benzoato, el cual es inestable a 5°C. La forma de mesilato es por su parte delicuescente.

Sumario de la invención

La presente invención se refiere al citrato monohidrato de (2S, 3S)-N-(metoxi-5-t-butilfenilmetil-2-difenilmetil-1-azobiciclo[2,2,2] octan-3-amina. En una realización de la invención, el citrato monohidrato es una forma cristalina individual, estable y no higroscópica. El hábito cristalino predominante son placas, que se caracteriza por el patrón de difracción de rayos X que se da a continuación:

Citrato monohidrato

N° pico	1	2	3	4	5	6	7
espacio d	13,28	7,70	7,45	6,34	5,33	5,06	4,40

La sal citrato monohidrato cristalina no es higroscópica, y se caracteriza por la pérdida de agua (volatilización) a aproximadamente 116°C y por un punto de comienzo de la fusión de aproximadamente 152,7°C. El citrato anhidro se convirtió

en el monohidrato en medio acuoso.

Una composición farmacéutica que presenta actividad antagonista del receptor NK-1 activo del SNC comprende la forma polimorfa A en una cantidad eficaz en el tratamiento de la emesis, y un vehículo farmacéuticamente aceptable. Un procedimiento de tratamiento de la emesis comprende la administración a un sujeto en necesidad de tratamiento de una cantidad eméticamente eficaz de la forma polimorfa del compuesto.

10 Un procedimiento de producción de la forma polimorfa A de la sal citrato monohidrato de (2S, 3S)-N-(metoxi-5-t-butilfenilmetil-2-difenilmetil-1-azobiciclo[2,2,2] octan-3-amina comprende la adición de ácido cítrico a una disolución de la base libre en acetona. El sólido se disolvió durante
15 aproximadamente dos horas. La disolución transparente se filtró y se agitó durante toda la noche. Se añadió isopropil éter filtrado seguido de la adición de agua filtrada. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente hasta que comenzó la cristalización y se granuló durante
20 aproximadamente 16 horas. La forma cristalina blanca se recogió por filtración y se secó a aproximadamente 45°C a vacío con purga con nitrógeno durante aproximadamente 24 horas.

Descripción detallada de la invención

25 Un procedimiento de producción de la forma polimorfa A

78
28

cristalina citrato monohidrato que comprende la adición de 353,9 g, 1,1 equivalentes de ácido cítrico (anhidro, 99,5+%) a una disolución de la base libre, 785 g en acetona, 7,85 litros. Después de la disolución del sólido durante 5 aproximadamente 2 horas, la disolución transparente se filtró, se agitó durante toda la noche y se añadieron 7,85 litros de isopropil éter seguidos de la adición de agua filtrada, 334 ml. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente hasta que comenzó la cristalización y se granuló 10 durante 16 horas más. La sal blanca cristalina formada se recogió por filtración y se secó a 45°C a vacío con purga con nitrógeno durante 24 horas para obtener 992 g, (89,9% de rendimiento). La forma polimorfa de la sal citrato monohidrato resultante se caracterizó por PLM, difracción de 15 rayos X, RMN (resonancia magnética nuclear) de protones, análisis de Karl Fisher, DSC (calorimetría diferencial de barrido) y análisis elemental. La difracción de rayos X y el PLM revelaron que era cristalina. El hábito cristalino predominante encontrado eran placas. Las reflexiones más 20 intensas y espaciados d que se observaron por difracción de rayos X fueron 13,280, 7,702, 7,446, 6,337, 5,332, 5,057, y 4,398 amstrongs. Los cristales mostraban una menor pérdida de agua (volatilización) a 116°C y una temperatura de comienzo de la fusión de 152,7°C con descomposición. Las 25 medidas de higroscopicidad demostraron que un 2,52% en

-5-

peso/peso de agua se absorbía al 90% de RH (humedad relativa). El análisis de Karl Fisher mostró la presencia en un 2,7% de agua (2,66% teórico) verificando que se sintetizó el monohidrato. El análisis elemental demostró la pureza de la sal sintetizada.

Suspendiendo el citrato anhidro en agua se obtiene al monohidrato cristalino que no pierde su agua en condiciones de secado, por ejemplo a 45°C a vacío.

La dosificación eficaz para la composición farmacéutica del citrato monohidrato depende de la vía de administración que se desee, del facultativo, y de la indicación a tratar, así como de otros factores tales como la edad y el peso del paciente. En los siguientes intervalos de dosificación, los términos "mg A" se refieren a los miligramos de monohidrato.

Un intervalo recomendado para la dosificación oral es de 5 a 300 mgA/día, preferiblemente de 40 a 200 mgA/día, más preferiblemente de 40 a 80 mgA/día en dosis únicas o divididas. Un intervalo recomendado para la administración oral de formas orales como píldoras o comprimidos es de 2,5 mgA/día a 160 mgA/día, preferiblemente de 5 a 80 mgA/día. Esto también es válido para la administración intravenosa.

Los siguientes ejemplos ilustran los procedimientos y compuestos de la presente invención. Se podrá entender, no obstante, que la invención no se limita a los ejemplos específicos.

Ejemplo 1Preparación de citrato monohidrato cristalino

Una cantidad de 47 gramos de base libre se suspendió en 470 mililitros de isopropil éter en condiciones ambientales.

5 A la suspensión blanca poco densa resultante se le añadieron 21,42 gramos de ácido cítrico anhidro a temperatura ambiente. Esta suspensión se utilizó luego para su conversión al monohidrato mediante suspensión en 150 ml de agua durante 18 horas. Se filtró la suspensión para dar un sólido cristalino

10 blanco. Se obtuvo la configuración mediante rayos X confirmando que el compuesto era el citrato monohidrato.

31
↑

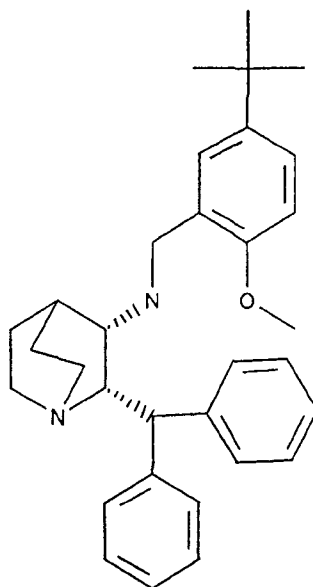
Habiendo descrito la invención como antecede, se declara como propiedad lo contenido en las siguientes

Reivindicaciones

- 5 1. Una forma cristalina del citrato de (2S, 3S)-N-(metoxi-5-t-butilfenilmetil-2-difenilmetil-1-azobiciclo[2,2,2] octan-3-amina de fórmula:

10

15



en la que dicha forma cristalina es la forma polimorfa A estable que presenta el patrón de difracción de rayos X siguiente

N° pico	1	2	3	4	5	6	7
espacios d	13,28	7,70	7,45	6,34	5,33	5,06	4,40

32
37

-8-

2. La forma polimorfa del citrato monohidrato de acuerdo con la reivindicación 1 en la que su hábito cristalino predominante son placas.

3. La forma polimorfa del citrato monohidrato de
5 acuerdo con la reivindicación 1 en la que el citrato monohidrato no es higroscópico.

4. La forma polimorfa del citrato monohidrato de acuerdo con la reivindicación 1 en la que la volatilización tiene lugar a aproximadamente 116°C.

10 5. El polimorfo del citrato monohidrato de acuerdo con la reivindicación 1 en el que la temperatura de comienzo de la fusión es de aproximadamente 152,7°C.

6. Una composición farmacéutica que presenta actividad antagonista del receptor NK-1 activo del SNC que comprende
15 la forma polimorfa de acuerdo con la reivindicación 1, en una cantidad eficaz para el tratamiento de la emesis, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

7. Un procedimiento de tratamiento de la emesis que comprende la administración a un paciente en necesidad de
20 tratamiento de una cantidad antieméticamente eficaz de la forma polimorfa A del compuesto de la reivindicación 1.

8. Un procedimiento de producción de la forma polimorfa cristalina de la sal citrato monohidrato de (2S, 3S)-N-(metoxi-5-t-butilfenilmetil-2-difenilmetil-1-
25 azobiciclo[2,2,2]octan-3-amino que comprende:

la adición de ácido cítrico a una disolución de la base libre en acetona; la disolución del sólido durante aproximadamente 2 horas; la filtración y agitación de la solución transparente durante la noche; la adición de isopropil éter filtrado seguido de la adición de agua filtrada; la agitación de la mezcla resultante a temperatura ambiente hasta el comienzo de la cristalización, granulación durante aproximadamente 16 horas; y la recogida de la sal blanca cristalina formada por filtración y su secado a 10 aproximadamente 45°C en vacío con purga con nitrógeno durante aproximadamente 24 horas.

9. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 8 en el que la suspensión se lleva a cabo en condiciones ambientales durante aproximadamente 1,5 a 72 horas de 15 granulación en isopropil éter, alcohol isopropílico y agua.

10. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 8 en el que el ácido cítrico es anhidro en más del 99,5%.

Resumen

Una forma polimorfa cristalina individual del citrato de (2S, 3S)-N-(metoxi-5-t-butilfenilmetil-2-difenilmetil-1-azobiciclo[2,2,2] octan-3-amina (citrato monohidrato) y su
5 composición farmacéutica. La composición farmacéutica de la forma polimorfa si el citrato monohidrato tiene la estabilidad necesaria para una formulación para tratar la emesis. La administración de esta composición farmacéutica es una forma de dosificación oral de liberación inmediata,
10 preferiblemente en forma de comprimido o cápsula, o intravenosa.

Se retiraron los folios 37 y 38
correspondientes a la tarjeta para el
archivo temático y a la tarjeta para el
archivo de propietario.

cad 202010

Junio 27/00

35
\$
15

EXTRACTO PARA PUBLICACION
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL

(21) No. SOLICITUD: 00-39195 (51) INT. CL. A61K 31/13 // 31/395
(22) FECHA DE PRESENTACION: 00-05-26 (71) SOLICITANTE: PFIZER PRODUCTS INC.
(30) PRIORIDAD: si
(31) No. DE SOLICITUD: 60/136,992 (72) INVENTOR/ES: MICHAEL JAMES CASTALDI,
GEORGE JOSEPH QUALLICH, LEWIN
(32) FECHA DE PRESENTACION: 01-06-99 THEOPHILUS WINT.
(33) PAIS: US (74) APODERADO: CARLOS R. OLARTE

(54) TITULO: FORMAS POLIMORFAS DE UN CITRATO DE AZOBICICLO [2,2,2]OCTAN-3-AMINA Y SUS COMPOSICIONES FARMACEUTICAS.

(57) RESUMEN:

Una forma polimorfa cristalina individual del citrato de (2S, 3S)-N-(metoxi-5-t-butilfenilmetil-2-difenilmetil-1-azobiciclo[2,2,2]octan-3-amina (citrato monohidrato) y su composición farmacéutica. La composición farmacéutica de la forma polimorfa si el citrato monohidrato tiene la estabilidad necesaria para una formulación para tratar de émesis. La administración farmacéutica es una forma de dosificación oral de liberación inmediata, preferiblemente en forma de comprimido o cápsula, o intravenosa.

40
36

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMIS

Radicacion : 00039195 00000000 Folios: 39
Fecha (AMD): 2000-05-26 17:10:29
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PATENTE DE INVENCION [✓]

MODELO DE UTILIDAD []

- Nombre e identificación del Solicitante 1 []
- Nombre e identificación del Inventor 1 []
- Título o nombre de la Invención 1 []
- Descripción 27-29 []
- Reivindicaciones 33 []
- Resumen 36 []
- Comprobante de Pago 3 []

COMPLETA [✓]

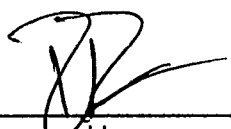
INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Nombre e identificación del peticionario []
- Nombre e identificación del inventor o diseñador []
- Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse []
- Representación gráfica []
- Comprobante de pago []

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha: _____

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador: 334 12 21-2-3-4
Fax: 261 31 25 e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

1000-05-29
430

EXPEDIENTE 00-39195

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- | | | |
|----------|--------|--|
| SI [x] | NO [] | NO APLICABLE [] Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a). |
| SI [x] | NO [] | NO APLICABLE [] Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94). |
| SI [x] | NO [] | NO APLICABLE [] Presentó, en forma correcta, el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 002 del 4 de enero del 2000). |
| SI [x] | NO [] | EXTEMPORANEAMENTE [] Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de Paris. |
| SI [X] | NO [] | NO APLICABLE [] Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional. |
| SI [X] | NO [] | NO APLICABLE [] Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.). |
| SI [X] | NO [] | CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS |

OBSERVACIONES

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

SI [X] NO [] Se ajusta a los aspectos **FORMALES** indicados en la Decisión 344 y por tanto,

SI [X] NO [] Se recomienda **PUBLICAR** el extracto correspondiente.

Santafé de Bogotá, D.C., 29 de Mayo del 2000

EXAMINADOR JURIDICO.
202022

Radicación no 00-39195Concepto Técnico no 989 Clasificación Internacional de Patentes A61K 31/13 // 31/395

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- | | |
|--|--|
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e). |
| * SI ☐ NO ☒ | Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13-b). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene los dibujos correctos (Art.14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto. 117 del 94). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art.14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene una o más reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d). |
| * SI ☒ NO ☐ | Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94. |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto. 117 /94. |
| * SI ☒ NO ☐ | Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P-104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| * SI ☒ NO ☐ | Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P-105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| SI ☐ NO ☒ | CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS |

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)Santa Fe de Bogotá, D.C., Sept 27/00EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202010

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
1º EXAMEN DE FORMA

CONCEPTO TÉCNICO Nº 989

EXPEDIENTE Nº 0-39195

IPC A61K 31/13 // 31/395

Debe tenerse en cuenta que el término "aproximadamente" resulta ambiguo y se presta para confusión; ya que no permite precisar y una cantidad determinada. Por ejemplo, cuando en la reivindicación 4 se establece: "aproximadamente 116 °C", puede entenderse que sea 113, 115, 117, etc. Por este motivo, es necesario suprimir dicho término. Principalmente del capítulo reivindicatorio.

* Debido a que la invención esta dirigida a la forma polimórfica de una sal específica, en el título debe precisarse el citrato de azobicyclo [2,2,2]octan-3-amina. Por este motivo debe modificarse el título de la invención.

* Al corregir el título se debe anexar nuevo extracto para publicación, nueva tarjeta para el archivo temático y nueva tarjeta para el archivo de propietario.

Al corregir las reivindicaciones se debe anexar nuevo capítulo reivindicatorio.

Adjuntar el arte final de la figura característica (fórmula de la sal) en tamaño 6 cm X 6 cm y 12 cm

Santa Fe de Bogotá D.C., 27 de junio de 2000

Examinador Técnico de Patentes
Q.F. Cód. 202010

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

2000-07-27
430

EXPEDIENTE 00-39195

AUTO 1895

LA JEFE DE DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DISPONE:

ARTICULO PRIMERO: Reconocer personería al doctor CARLOS R. OLARTE como apoderado de la Sociedad solicitante, en los términos y para los efectos del poder conferido.

ARTICULO SEGUNDO: Conforme lo establece el artículo 22 de la Decisión 344 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena, requiérsele al solicitante, para que dentro del plazo de treinta (30) días hábiles siguientes a la fecha de notificación del auto, presente respuesta a las observaciones o complemente los antecedentes señalados en el examen de forma.

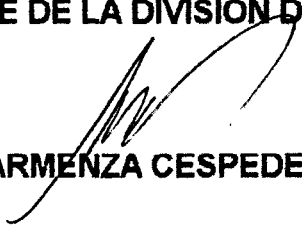
ARTICULO TERCERO: Notificar por estado el presente auto, advirtiéndole que contra el no procede recurso alguno en la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dado en Santafé de Bogotá D.C., a los

25 JUL 2000

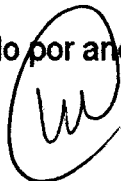
LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C., notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

27 JUL 2000



VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI___ NO___

**VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA
202022**