

OLARTE RAISBECK


Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

03/18
254
Folios: 21
Radicación: 03067904 DE 2004
Fecha (MC): 2004-12-15 09:50:26
Trámite: 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLETEN
Dependencia: 2023 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

**S LICITANTE
(71)**

Nombre: LABORATOIRE GLAXOSMITHKLINE S.A.S,
SMITHKLINE BEECHAM CORPORATION y GLAXO GROUP LIMITED

Dirección: 100 Route de Versailles, 78163 Marly-le-Roi, Cedex France,
One Franklin Plaza, P.O. BOX 7929, Philadelphia, PA 19101, E.U.A. Glaxo
Wellcome House, Berkeley Avenue, Greenford, Middlesex UB6 0NN, GB

Nacionalidad o Domicilio: Francesa; Estadounidense;
Británica.

Lugar de Constitución: Francia; Estados
Unidos e Inglaterra.

Teléfono: _____ **Fax:** _____
E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A
Calle 100 No. 8ª-37 Piso 10. Bogotá

Teléfono: 601-7700 **Fax:** 601-7799

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 79.782.747Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:
03.009.984

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Me permito **REEMPLAZAR**
las actuales Relvindicaciones 1 a 48 por las nuevas Relvindicaciones 1 a 118. Le aclaro al
Despacho que estas nuevas reivindicaciones están plenamente soportadas en el Capítulo
Descriptivo, por lo tanto lo anterior no constituye una ampliación del concepto Inventivo.

6

Comprobante de pago No. 93,916 **Fecha** Diciembre 3, 2004.

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando
sean personas jurídicas.

8

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA: 

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

255
9

NIT : 800176089-2

SUPERINDUSTRIA Y CIGERNCIO

Radicacion : 83889984 88888883

Folios: 21

Fecha (ATD): 2004-12-15 09:58:36

Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE INCI 329 CUMPLESEN

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 93,916
FECHA : DICIEMBRE 3 DE 2004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
JOSE SANTOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	33493624	02/12/2004	5,212,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	DESCRIPTIVO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	87,000.00
		TOTAL :	87,000.00

SON: OCHENTA Y SIETE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

256
A

Reivindicaciones:

1. El uso de la N-[(1-"butil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma en la fabricación de un medicamento para la profilaxis o tratamiento de la arritmia auricular en un mamífero, mediante la administración de SB 207266 o la sal del mismo el primer día a una dosis de carga entre 1.2 y 2.0 veces aproximadamente la dosis diaria de mantenimiento, seguido por la administración de SB 207266 o la sal del mismo a la dosis diaria de mantenimiento en los días siguientes.

2. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 1, en donde la dosis de carga oscila entre 1.25 y 2.0 veces aproximadamente la dosis diaria de mantenimiento.

3. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 1, en donde la dosis de carga oscila entre 1.25 y 1.75 veces aproximadamente la dosis diaria de mantenimiento.

4. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 1, en donde la dosis de carga oscila entre 1.5 y 20 veces aproximadamente la dosis diaria de mantenimiento.

5. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 1, en donde la dosis de carga es aproximadamente 1.5 veces la dosis diaria de mantenimiento.

6. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 1, en donde la dosis de carga es aproximadamente 2.0 veces la dosis diaria de mantenimiento.

7. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral entre 0.2 mg y 1.5 mg de SB 207266 o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo por kilogramo de peso corporal total (medido como la base libre).

257
H

8. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral entre 0.2 mg y 1.0 mg aproximadamente de SB 207266 o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo por kilogramo de peso total corporal (medido como la base libre).

5

9. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral entre 0.2 mg y 0.5 mg aproximadamente de SB 207266 o la sal del mismo por kilogramo del peso total corporal (medido como la base libre).

10

10. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral entre 0.2 mg y 0.3 mg aproximadamente de SB 207266 o la sal del mismo por kilogramo del peso total corporal (medido como la base libre).

15

11. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral entre 0.5 mg y 1.0 mg aproximadamente de SB 207266 o la sal del mismo por kilogramo del peso total corporal (medido como la base libre).

20

12. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la administración es realizada en un humano y en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral de 20 mg de SB 207266 o la sal del mismo (medido como la base libre).

25

13. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la administración es realizada en un humano y en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral de 50 mg de SB 207266 o la sal del mismo (medido como la base libre).

30

14. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral que oscila entre 1.0 mg y 1.5 mg aproximadamente de SB 207266 o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo por kilogramo del peso total corporal (medido como la base libre).

5

15. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral que oscila entre 1.0 mg y 1.3 mg aproximadamente de SB 207266 o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo por kilogramo del peso total corporal (medido como la base libre).

10

16. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la administración es realizada en un humano y en donde la dosis diaria de mantenimiento comprende un régimen de dosificación diario oral o parenteral de 80 mg de SB 207266 o la sal del mismo (medido como la base libre).

15

17. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 5 o cualquiera de las reivindicaciones 7 a 16 como dependientes de la reivindicación 5, en donde: el mamífero es un humano; la dosis de carga es 30 mg, 75 mg ó 120 mg; y la dosis de mantenimiento es 20mg, 50mg ó 80mg respectivamente.

20

18. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17, en donde la administración, dosificación y/o régimen de dosificación de SB 207266 o la sal del mismo es oral.

25

19. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18, en donde el medicamento sirve para la administración de la dosis diaria de mantenimiento desde la primera semana hasta el resto de la vida del mamífero.

30

20. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, en donde la arritmia auricular comprende una fibrilación auricular.

21. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 20, en donde el mamífero padece o es susceptible a una fibrilación auricular persistente.

5 22. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde el medicamento es para utilizarse en la inhibición de recurrencias sintomáticas de fibrilación auricular en un mamífero con fibrilación auricular persistente o paroxismal.

23. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde el mamífero es un humano.

10 24. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 23, en donde el medicamento sirve para la administración de la dosis de carga durante un episodio arrítmico en el mamífero, y en donde el medicamento sirve para la administración de la dosis de mantenimiento después de una cardioversión del mamífero de regreso al ritmo normal del seno, la cardioversión
15 hecha en el evento que el mamífero no esté en el ritmo normal del seno después de un período suficiente para que las dosis de carga tenga efecto.

25. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde el medicamento es para tratar el mamífero que experimenta un episodio arrítmico, y en donde el
20 tratamiento comprende:

(a) administración de la N-[(1-ⁿbutil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o la sal farmacéuticamente aceptable de la misma a la dosis de carga.

25 (b) esperar durante un tiempo suficiente para que la dosis del paso (a) surta efecto al menos de manera parcial.

(c) opcionalmente medir si el mamífero ha revertido al ritmo normal del seno.

30

260
X

(d) cardiovertir el mamífero de regreso al ritmo normal del seno en el evento que el mamífero no esté en el ritmo normal del seno después del período en el paso (b), y luego

5 (e) administrar según sea necesario SB 207266 o la sal del mismo a dosis de mantenimiento en los días siguientes.

26. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 25, en donde el período de tiempo en el paso (b) oscila entre 1 y 4 horas aproximadamente.

10 27. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 25 o 26, en donde en el paso (d), se utilizó cardioversión con corriente directa (DC).

28. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 24 a 27, en donde el episodio arrítmico es un episodio fibrilatorio auricular.

15

29. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de los anteriores reivindicaciones, en donde SB 207266 o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo es la sal clorhídrica de SB 207266.

20 30. El uso de N-[(1-ⁿbutil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo en la fabricación de un medicamento para el tratamiento o profilaxis de la fibrilación auricular en un mamífero, mediante la administración al mamífero de un régimen de dosificación diario oral o parenteral que oscila entre 0.2 mg y 1.0 mg de SB 207266 o sal del mismo por kilogramo del peso corporal total (medido como la base libre).

25

31. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 30, en donde el régimen de dosificación diario oral o parenteral oscila entre 0.2 mg y 0.5 mg aproximadamente de SB 207266 o sal del mismo por kilogramo del peso total corporal (medido como la base libre).

32. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 30, en donde el régimen diario de dosificación oral o parenteral oscila entre 0.5 y 1.0 mg de SB 207266 o la sal del mismo por kilogramo del peso total corporal (medido como la base libre).

5 33. El uso según la reivindicación 30, en donde el régimen de dosificación diario comprende la administración oral a un humano de 20 mg de SB 207266 o la sal del mismo (medido como base libre).

10 34. El uso según la reivindicación 30, en donde el régimen de dosificación diario comprende la administración oral o parenteral a un humano de 50 mg de SB 207266 o la sal del mismo (medido como la base libre).

15 35. El uso de N-[(1-"butil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo en la fabricación de un medicamento para el tratamiento o profilaxis de la fibrilación auricular en un mamífero, mediante la administración al mamífero de un régimen de dosificación diario oral o parenteral que oscila entre 1.0 mg a 1.5 mg de SB 207266 o sal del mismo por kilogramo del peso corporal total (medido como la base libre).

20 36. El uso de N-[(1-"butil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo en la fabricación de un medicamento para el tratamiento o profilaxis de la fibrilación auricular en un mamífero, mediante la administración al mamífero de un régimen de dosificación diario oral o parenteral de 80 mg de SB 207266 o la sal del mismo (medido como la base libre).

25 37. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 30 a 36, en donde el régimen de dosificación diario es oral.

30 38. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 30 a 37, en donde el mamífero padece o es susceptible de una fibrilación auricular persistente.

39. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 30 a 38, en donde el medicamento sirve para utilizarse en la inhibición de recurrencias sintomáticas de fibrilación auricular en un mamífero con fibrilación auricular persistente o paroxismal.

5 40. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 30 a 39, en donde el mamífero es un humano o un cerdo.

41. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 30 a 40, en donde el medicamento sirve para tratar el mamífero que experimenta un episodio arrítmico, y en donde el
10 tratamiento comprende:

(a) administración de una N-[(1-"butil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o la sal farmacéuticamente aceptable de la misma a un régimen de dosificación según cualquiera de las reivindicaciones 30 a 40,

15 (b) esperar durante un tiempo suficiente para que la dosis del paso (a) surta efecto al menos de manera parcial.

(c) opcionalmente medir si el mamífero ha revertido al ritmo normal del seno.

20 (d) cardiovertir el mamífero de regreso al ritmo normal del seno en el evento que el mamífero no esté en el ritmo normal del seno después del período en el paso (b), y luego

25 (e) opcionalmente administrar según sea necesario una dosis adicional de SB 207266 o la sal del mismo.

42. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 41, en donde el período de tiempo en el paso (b) oscila entre 1 y 4 horas aproximadamente.

30 43. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 41 o 42, en donde en el paso (d), se utilizó cardioversión de corriente directa (DC).

44. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 41, 42 o 43, en donde el paso (e) comprende la administración según sea necesario de SB 207266 o la sal del mismo a un régimen de dosificación según cualquiera de las reivindicaciones 30 a 40.

5

45. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 41 a 44, en donde el episodio arrítmico es un episodio fibrilatorio auricular.

10

46. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 30 a 45, en donde el medicamento es empleado para la co-administración de SB 207266 o la sal del mismo a un mamífero y para terapia de anticoagulación en un mamífero.

47. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 30 a 46, en donde SB 207266 o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo es la sal clorhídrica de SB 207266.

15

48. El uso de un antagonista del receptor 5-HT₄ en la fabricación de un medicamento para la profilaxis o tratamiento de remodelación auricular en un mamífero, en donde el antagonista del receptor 5HT₄ comprende:

20

(i) N-[(1-"butil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266);

(iii) éster (1-(2-((metilsulfonil)amino)etil)-4-piperidinil)metílico del ácido 1-metil-1H-indol-3-carboxílico (GR 113808);

(v) (1-butil-4-piperidil)metil-8-amino-7-cloro-1,4-benzodioxan-5-carboxilato (SB 204070);

25

(vi) (1-butil-4-piperidil)metil-8-amino-7-yodo-1,4-benzodioxan-5-carboxilato (SB 207710);

(vii) N-(1-butil-4-piperidil)metil-8-amino-7-cloro-1,4-benzodioxan-5-carboxamida (SB 205800);

(viii) [1-[2-[(metilsulfonil)amino]etil]-4-piperidinil]metil[2-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)fenil]carbamato (GR 138897); o

30

(ix) [1-[2-[metilsulfonil)amino]etil]-4-piperidinil]metil-5-fluoro-2-metoxi-1H-indol-3-carboxilato (GR 125787);

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

49. El uso tal como se reivindica en la reivindicación 48, en donde el antagonista del receptor 5-HT₄ comprende: (i) SB 207266, (v) SB 204070, (vi) SB 207710, (vii) SB 205800, ó (viii) GR 138897; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

5

50. El uso tal como se reivindica en la reivindicación 48 en donde el antagonista del receptor 5-HT₄ es N-[(1-ⁿbutil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10 51. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 50, en donde SB 207266 o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo es la sal de hidrocloreuro de SB 207266.

15 52. El uso tal como se reivindicó en la reivindicación 50 ó 51, en donde el medicamento es para una administración de un régimen de dosificación oral o parenteral diario tal como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 30 a 40.

53. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 48 a 52, en donde el medicamento sirve para la profilaxis o tratamiento de remodelación auricular eléctrica (electrofisiológica) en un mamífero.

20

54. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 48 a 53, en donde el medicamento sirve para la profilaxis o tratamiento de la remodelación auricular eléctrica (electrofisiológica) en un mamífero mediante el aumento del periodo refractario efectivo auricular (AERP) y/o mediante la protección al menos parcial de, o la reversión de una reducción en el AERP.

25

55. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 48 a 54, en donde el mamífero padece o es susceptible de una fibrilación auricular persistente.

265
72

56. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 48 a 55, en donde el medicamento es para utilizarse en la inhibición de recurrencias sintomáticas de fibrilación auricular en un mamífero con fibrilación auricular persistente o paroxismal.

5 57. El uso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 48 a 56, en donde el mamífero es un humano o un cerdo.

58. El uso de un antagonista del receptor 5-HT₄, tal como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 48 a 51, en la fabricación de un medicamento para la profilaxis o tratamiento de
10 una enfermedad o condición en un mamífero, diferente a la fibrilación auricular, asociado con una reducción en el periodo refractario efectivo auricular (AERP) y/o una modificación indeseable de la capacidad refractaria auricular.

59. El uso de un antagonista del receptor 5-HT₄, tal como se definió en cualquiera de las
15 reivindicaciones 48 a 51, en la fabricación de un medicamento para aumentar el periodo refractario efectivo auricular (AERP) y/o benéficamente modificar la capacidad refractaria auricular en un mamífero que padece o es susceptible de una enfermedad o condición, diferente a la fibrilación auricular, en la cual dicho aumento o modificación es deseable.

20 60. Una composición farmacéutica, bien sea en una tableta, o que se haya colocado en una cápsula de gelatina dura en polvo o en forma de pellet, en donde la composición comprende N-[(1-"butil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo en una cantidad de 20, 25, 40, 50 o 80 mg (medido como base libre), en combinación con un vehículo sólido farmacéuticamente
25 aceptable.

61. Una composición farmacéutica, bien sea en una tableta, o que se haya colocado en una cápsula de gelatina dura en polvo o en forma de pellet, en donde la composición comprende la sal de hidrocloreuro de N-[(1-"butil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-
30 carboxamida (SB 207266) en una cantidad de 20, 25, 40, 50 o 80 mg (como la sal de

266 B

hidrocloruro, pero la dosis dada medida como la base libre), en combinación con un vehículo sólido farmacéuticamente aceptable.

5 62. Una composición tal como se reivindica en la reivindicación 60 ó 61, en donde SB 207266 o la sal del mismo está presente en una cantidad de 25 mg (medida como la base libre).

63. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 60 ó 61, en donde SB 207266 o la sal del mismo está presente en una cantidad de 40 mg (medida como la base libre).

10 64. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 60 ó 61, en donde SB 207266 o la sal del mismo está presente en una cantidad de 50 mg (medida como la base libre).

65. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 60 ó 61, en donde SB 207266 o la sal del mismo está presente en una cantidad de 80 mg (medida como la base libre).

15 66. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 60 a 65, y que existe como una tableta.

20 67. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 60 a 66, en donde el vehículo sólido está presente en una cantidad entre 25 mg y 1 g aproximadamente.

68. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 60 a 67, para utilizarse en la profilaxis o tratamiento de la arritmia auricular en un mamífero.

25 69. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 60 a 68, apropiada para la administración oral en un mamífero.

70. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 68 ó 69, en donde el mamífero es un humano.

30

267 H

71. Una composición farmacéutica, como lo es una tableta que comprende N-[(1-ⁿbutil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en combinación con un vehículo sólido farmacéuticamente aceptable,

5 en donde SB 207266 o la sal del mismo está presente en la tableta en al menos 5.0 mg por 250 mg del peso de la tableta (medida como la base libre),

y en donde la tableta es producida utilizando un proceso que comprende:

(i) la utilización de un proceso de granulación en húmedo en el cual SB 207266 o la sal del mismo, un excipiente principal insoluble (el cual es el diluyente principal), una ayuda de
10 compresión y granulación, y un agente aglomerante son granulados utilizando un solvente de granulación en un mezclador-granulador, en donde la ayuda de compresión y granulación dispersa el solvente de granulación y asiste en la compresibilidad total;

(ii) secado y tamizado de la mezcla de gránulos resultante, y mezclado de la mezcla de gránulos resultante con un desintegrante y un lubricante para formar una mezcla de compresión;

15 y

(iii) compresión de la mezcla de compresión en tabletas en una prensa de tabletas apropiada.

72. Una composición farmacéutica tal como se reivindicó en la reivindicación 71, en donde la
20 tableta tiene una forma ovoide o redonda.

73. Una composición farmacéutica tal como se reivindicó en la reivindicación 71 ó 72, en donde la prensa de tabletas apropiada es una prensa de tabletas rotatoria apropiada.

25 74. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 71, 72 ó 73, en donde SB 207266 o la sal del mismo es la sal de hidrocloreuro de SB 207266.

75. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 74, en
donde SB207266 o la sal del mismo está presente en la tableta en al menos 10 mg por cada
30 256.25 mg de peso de la tableta (medido como la base libre).

76. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 75, en donde SB 207266 o la sal del mismo está presente en la tableta en hasta 80 mg por cada 256.25 mg de peso de la tableta (medido como la base libre).

- 5 77. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 74, en donde SB 207266 o la sal del mismo está presente en la tableta en al menos 20 mg por cada 250 mg del peso de la tableta (medido como la base libre).

- 10 78. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 77, en donde SB 207266 o la sal del mismo está presente en la tableta en hasta 80 mg por cada 250 mg de peso de la tableta (medido como la base libre).

79. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 78, en donde el diluyente principal es el fosfato de dicalcio (fosfato de calcio dibásico).

15

80. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 78, en donde el diluyente principal es el fosfato de calcio dibásico dihidrato (fosfato de hidrógeno de calcio dihidrato).

- 20 81. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 80, en donde el diluyente principal está presente en una cantidad de hasta 167.5 mg por cada 250 mg del peso de la tableta.

25

82. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 81, en donde el diluyente principal está presente en una cantidad de al menos 92.5 mg por cada 250 mg del peso de la tableta.

- 30 83. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 80, en donde el diluyente principal está presente en una cantidad de hasta 161.5 mg por cada 256.25 mg del peso de la tableta.

769
16

84. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 83, en donde el diluyente principal está presente en una cantidad de al menos 84.5 mg por cada 256.25 mg del peso de la tableta.

5 85. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 84, en donde la ayuda de compresión y granulación es la celulosa microcristalina.

86. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 85, en donde la ayuda de compresión y granulación está presente en una cantidad aproximada de:

10 50.0 mg por cada 256.25 mg del peso de la tableta, o
50.0 mg por cada 250 mg del peso de la tableta.

87. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 86, en donde el agente aglomerante es la hidroxipropilmetilcelulosa.

15

88. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 87, en donde el agente aglomerante está presente en una cantidad aproximada de:

12.5 mg por cada 256.25 mg del peso de la tableta, o
12.5 mg por cada 250 mg del peso de la tableta.

20

89. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 88, en donde el desintegrante es el glicolato de almidón de sodio.

90. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 89, en donde el desintegrante está presente en una cantidad aproximada de:

25

12.5 mg por cada 256.25 mg del peso de la tableta, o
12.5 mg por cada 250 mg del peso de la tableta.

91. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 90, en donde el lubricante es el estearato de magnesio o el ácido esteárico.

30

2702

92. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 90, en donde el lubricante es el estearato de magnesio.

93. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 92, en donde el lubricante está presente en una cantidad aproximada de:

2.5 mg por cada 256.25 mg del peso de la tableta, o

2.5 mg por cada 250 mg del peso de la tableta.

94. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 93, en donde SB 207266 o la sal del mismo se encuentra en la tableta en una cantidad de 20, 25, 40, 50 o 80 mg (medido como la base libre).

95. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 94, en donde SB 207266 o la sal del mismo se encuentra en la tableta en una cantidad de 50 mg (medido como la base libre).

96. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 94, en donde SB 207266 o la sal del mismo se encuentra en la tableta en una cantidad de 80 mg (medido como la base libre).

97. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 96, en donde el vehículo sólido está presente en una cantidad entre 25 mg y 1 g aproximadamente.

98. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 97, para utilizarse en la profilaxis o tratamiento de la arritmia auricular en un mamífero.

99. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 98, apropiada para la administración oral en un mamífero.

100. Una composición tal como se reivindicó en la reivindicación 98 ó 99, en donde el mamífero es un humano.

271/18

101. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 100, en donde el solvente de granulación es el agua.

5 102. Una composición tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 101, en donde la tableta es recubierta por película.

103. Una composición farmacéutica como lo es una tableta para la administración oral humana, la cual es el resultado de un proceso de granulación, y en donde la composición es sustancialmente según se expone a continuación, siempre y cuando la dosis de SB-207266 en la
10 composición pueda ser aumentada desde 5 mg hasta 80 mg (medida como la base libre) y la cantidad de fosfato de dicalcio pueda se disminuida consecuentemente mientras se mantiene constante el peso de la tableta en 250 mg:

	SB 207266	5.0 mg
15	celulosa microcristalina	50.0 mg
	hidroxipropilmetilcelulosa (HPMC)	12.5 mg
	glicolato de almidón de sodio	12.5 mg
	fosfato de dicalcio	167.5 mg
	estearato de magnesio	2.5 mg
20		
	Peso de la Tableta	250 mg.

104. Una composición farmacéutica como lo es una tableta para la administración oral humana, la cual es el resultado de un proceso de granulación,
25 y en donde la composición es sustancialmente según se expone a continuación, siempre y cuando la dosis de SB-207266 en la composición pueda ser aumentada hasta 20 mg:

	SB 207266	5.0 mg
	celulosa microcristalina	50.0 mg
30	hidroxipropilmetilcelulosa (HPMC)	12.5 mg
	glicolato de almidón de sodio	12.5 mg

272/1

fosfato de dicalcio	167.5 mg
estearato de magnesio	2.5 mg

Peso de la Tableta 250 mg.

5

105. Una composición farmacéutica la cual es una tableta sustancialmente tal como se describió en el ejemplo 7.

10

106. Una composición farmacéutica la cual es una tableta sustancialmente tal como se describió en el ejemplo 8.

15

107. Un proceso para producir una composición farmacéutica como una tableta que comprende N-[(1-ⁿbutil-4-piperidinil)metil]-3,4-dihidro-2H-[1,3]oxazino[3,2-a]indol-10-carboxamida (SB 207266) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo junto con un vehículo sólido farmacéuticamente aceptable, en donde el SB 207266 o la sal del mismo está presente en la tableta en al menos 5.0 mg por cada 250 mg de peso de la tableta (medida como la base libre); el proceso comprende:

20

(i) la utilización de un proceso de granulación en húmedo en el cual SB 207266 o la sal del mismo, un excipiente principal insoluble (el cual es el diluyente principal), una ayuda de comprensión y granulación, y un agente aglomerante son granulados utilizando un solvente de granulación en un granulador, en donde la ayuda de comprensión y granulación dispersa el solvente de granulación y ayuda en la compresibilidad total;

25

(ii) secado y tamizado de la mezcla de gránulos resultante, y mezclado de la mezcla de gránulos resultante con un desintegrante y un lubricante para formar una mezcla de compresión; y

(iii) la compresión de la mezcla de compresión en forma de tabletas en una prensa de tabletas apropiada.

30

108. Un proceso tal como se reivindicó en el reivindicación 107, en donde el solvente de granulación es el agua.

9823

109. Un proceso tal como se reivindicó en la reivindicación 107 ó 108, en donde en el paso (i), SB 207266 o la sal del mismo, la ayuda de compresión y granulación, el diluyente principal y el agente aglomerante son mezclados entre sí, y el solvente de granulación es agregado a los polvos mezclados.

5

110. Un proceso tal como se reivindicó en la reivindicación 109, en donde en el paso (i), el solvente de granulación es agregado a los polvos mezclados mientras se mezcla en un granulador-mezclador de esfuerzo de corte.

10 111. Un proceso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 107 a 110, en donde en el paso (ii), los gránulos son secados en un secador de lecho fluidizado.

15 112. Un proceso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 107 a 111, en donde en el paso de tamizado en el paso (ii), los gránulos secos son pasados a través de un tamiz de acero inoxidable utilizando un molino apropiado.

113. Un proceso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 107 a 112, en donde la prensa de tabletas adecuada es una prensa de tabletas rotatoria adecuada.

20 114. Un proceso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 107 a 113, en donde después del paso (iii), los núcleos de tableta resultantes son recubiertos con película utilizando una dispersión acuosa de una cubierta de película.

25 115. Un proceso tal como se reivindicó en la reivindicación 114, en donde la cubierta de película es el Opadry White YS-1-7003.

116. Un proceso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 107 a 115, en donde SB 207266 o la sal del mismo es la sal de hidrocloreuro de SB 207266.

30 117. Un proceso tal como se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 107 a 116, en donde la composición es tal como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 72 a 106.

274
9x

118. Una composición farmacéutica en forma de una tableta según se reivindicó en cualquiera de las reivindicaciones 71 a 106, producida mediante un proceso tal como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 108 a 115.