



No. 06-120230-00003-0000

Fecha 2007-06-22 16 11 54 Dep 2020 NUECREACIONE
Tra 11 PATENTEIYII Eve 379 FASENACIONALII
Act 329 CTOINFORMACION Folios 12

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)Nombre: SCHERING CORPORATION.Dirección: 2000 Galloping Hill Road,
Kenilworth, NJ 07033-0530, E.U.A.Nacionalidad o Domicilio: EstadounidenseLugar de Constitución: Kenilworth

Teléfono: _____ Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADONombre: J. IAN RAISBECKDirección: World Trade Center Torre A
Calle 100 No. 8ª-37 Piso 10. BogotáTeléfono: 601-7700 Fax: 601-7799E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual _____

Número 79.376.996 Bta
TP 135.799

4

Número de expediente:

06.120.230

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada: VER PAGINA ADJUNTA

6

Comprobante de pago No. 07-45.391

Fecha

5 de Junio de 2007

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

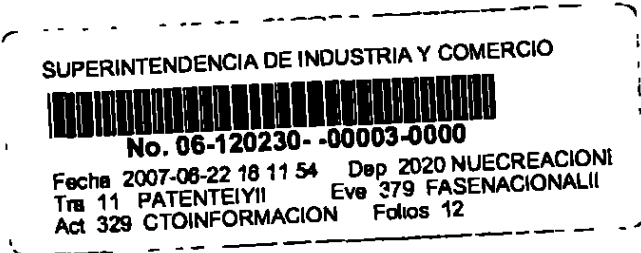
Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

8

NOMBRE: J. IAN RAISBECK

FIRMA:

C.C. 79.376.996 Bta T.P. 135.799



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 45,391
FECHA : JUNIO 5 DE 2007

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
RTE RAISBECK	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	67535363	05/06/2007	6.757.000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LENAS COMERCIALES	99.000.00
		TOTAL :	\$ 99.000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

A handwritten signature in black ink, consisting of a stylized 'S' followed by a loop.

RESPONSABLE : _____

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(modificaciones voluntarias)

1. Una formulación que comprende posaconazol, un fosfolípido, un protector
5 térmico y un sistema tampón.

2. La formulación de la Reivindicación 1 que comprende adicionalmente
agua.

3. La formulación de la Reivindicación 2 donde dicha formulación ha sido
esterilizada por autoclave.

4. La formulación de la Reivindicación 2 donde dicha formulación ha sido
esterilizada por irradiación.

5. La formulación de la Reivindicación 1 donde el sistema tampón contiene
fosfato sódico.

6. La formulación de la Reivindicación 1 donde el sistema tampón contiene un
15 tampón orgánico.

7. La formulación de la Reivindicación 1, donde el sistema tampón contiene
como mínimo uno de los siguientes: histidina, ácido cítrico, glicina, citrato de sodio,
sulfato de amonio o ácido acético.

8. La formulación de la Reivindicación 1 donde dicho sistema tampón
20 mantiene un pH de 3,0 a 9,0 aproximadamente.

9. La formulación de la Reivindicación 1 donde dicho sistema tampón
mantiene un pH de 6,0 a 8,0 aproximadamente.

10. La formulación de la Reivindicación 1 donde dicho sistema tampón
mantiene un pH de 6,4 a 7,6 aproximadamente.

11. La formulación de la Reivindicación 1 donde dicho fosfolípido comprende
25 1-palmitoil-2-oleoil-sn-glicero-3-fosfocolina (POPC).

12. La formulación de la Reivindicación 1 donde el protector térmico
comprende la trehalosa.

13. La formulación de la Reivindicación 2 donde el fosfolípido comprende 1-palmitoil-2-oleoil-sn-glicero-3-fosfocolina (POPC), el protector térmico contiene trehalosa y el sistema tampón contiene fosfato sódico.

5 14. La formulación de la Reivindicación 1 donde el posaconazol tiene una distribución granulométrica cuyo valor de la mediana está entre 1,0 y 8,0 micrones aproximadamente, con no más de unas 3.000 partículas de 10 micrones o de mayor tamaño, ni más de unas 300 partículas de 25 micrones o de mayor tamaño.

15 15. La formulación de la Reivindicación 1 donde el posaconazol tiene una distribución granulométrica cuyo valor de la mediana está entre 1,0 y 5,0 micrones aproximadamente, con no más de unas 3.000 partículas de 10 micrones o de mayor tamaño, ni más de unas 300 partículas de 25 micrones o de mayor tamaño.

15 16. La formulación de la Reivindicación 1 donde el posaconazol tiene una distribución granulométrica cuyo valor de la mediana está entre 1,2 y 4,5 micrones aproximadamente, con no más de unas 3.000 partículas de 10 micrones o de mayor tamaño, ni más de unas 300 partículas de 25 micrones o de mayor tamaño.

17. La formulación de la Reivindicación 13 cuyos ingredientes incluyen:

<u>Ingrediente</u>			<u>Intervalo de concentraciones</u>
Posaconazol			50 mg/ml aproximadamente
POPC			40 mg/ml aproximadamente
Fosfato	sódico	monobásico	0,345 mg/ml aproximadamente
monohidrato, USP			
Fosfato	sódico	dibásico anhidro,	1,065
USP			
Trehalosa			250 mg/ml
Agua para inyección, USP q.s. ad			1 ml

18. La formulación de la Reivindicación 13 cuyos ingredientes incluyen:

<u>Ingrediente</u>	<u>Intervalo de concentraciones</u>
Posaconazol	de 1 a 100 mg/ml aproximadamente
POPC	de 10 a 60 mg/ml aproximadamente
Fosfato sódico monobásico monohidrato, USP	de 0,01 a 0,6 mg/ml aproximadamente
Fosfato sódico dibásico anhidro, USP	de 0,04 a 1,5 mg/ml aproximadamente
Trehalosa	de 10 a 300 mg/ml aproximadamente
Agua para inyección, USP q.s. ad	1 ml aproximadamente

19. La formulación de la Reivindicación 13 cuyos ingredientes incluyen:

<u>Ingrediente</u>	<u>Intervalo de concentraciones</u>
Posaconazol	de 40 a 60 mg/ml aproximadamente
POPC	de 20 a 50 mg/ml aproximadamente
Trehalosa	de 100 a 250 mg/ml aproximadamente
Agua para inyección, USP q.s. ad	1 ml aproximadamente

20. La formulación de la Reivindicación 1 que además comprende un antioxidante.

21. La formulación de la Reivindicación 20 donde el antioxidante comprende galato de propilo a una concentración de 0,02 a 0,005 mg/ml aproximadamente y hidroxitolueno butilado a una concentración de 0,1 a 0,02 mg/ml aproximadamente, o D-alfa-tocoferol a una concentración de 0,5 a 0,01 mg/ml aproximadamente.

5 22. La formulación de la Reivindicación 1 donde la proporción de peso de fosfolípido a posaconazol es de entre 60:1 y 1:10 aproximadamente.

23. La formulación de la Reivindicación 1 donde la proporción de peso de fosfolípido a posaconazol es de entre 1:1 y 1:5 aproximadamente.

24. La formulación de la Reivindicación 1 donde la proporción de peso de fosfolípido a posaconazol es de entre 1:1 y 4:5 aproximadamente.

25. La formulación de la Reivindicación 1 donde la proporción de peso de protector térmico a posaconazol es de entre 300:1 y 1:10 aproximadamente.

26. La formulación de la Reivindicación 1 donde la proporción de peso de protector térmico a posaconazol es de entre 1:1 y 6:1 aproximadamente.

15 27. La formulación de la Reivindicación 1 donde la proporción de peso de protector térmico a fosfolípido es de entre 30:1 y 1:6 aproximadamente.

28. La formulación de la Reivindicación 1 donde la proporción de peso de protector térmico a fosfolípido es de entre 5:4 y 30:4 aproximadamente.

20 29. La formulación de cualquiera de las Reivindicaciones 1, 11, 12, 13, 17, 18 y 19, que además contiene un segundo ingrediente activo seleccionado del grupo que incluye: antifúngicos; anfotericina B; anfotericina B desoxicolato; flucitosina; terbinafina; antibacterianos; antivirales; esteroides; fármacos antiinflamatorios no esteroides (nonsteroidal anti-inflammatory drugs, "NSAID"); quimioterapéuticos y antieméticos.

25 30. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por proporcionar una concentración en plasma máxima media ($C_{máx}$) de posaconazol de como mínimo 467 ng/ml en estado estacionario, y un valor medio del área bajo la curva de posaconazol en plasma durante 24 horas (AUC) de como mínimo 9.840 ng·h/ml en estado

estacionario, cuando dicha formulación es suministrada por infusión durante alrededor de 1 hora para administrar 100 mg de posaconazol, y se repite en un intervalo de 24 horas.

31. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por proporcionar una concentración en plasma máxima media ($C_{m\acute{a}x}$) de posaconazol de como mínimo 852 ng/ml en estado estacionario, y un valor medio del área bajo la curva de posaconazol en plasma durante 24 horas (AUC) de como mínimo 24.600 ng·h/ml en estado estacionario, cuando dicha formulación es suministrada por infusión durante alrededor de 1 hora para administrar 200 mg de posaconazol, y se repite en un intervalo de 24 horas.

32. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por proporcionar una concentración en plasma máxima media ($C_{m\acute{a}x}$) de posaconazol de como mínimo 1.480 ng/ml en estado estacionario, y un valor medio del área bajo la curva de posaconazol en plasma durante 24 horas (AUC) de como mínimo 24.600 ng·h/ml en estado estacionario, cuando dicha formulación es suministrada por infusión durante alrededor de 1 hora para administrar como mínimo 200 mg de posaconazol, y se repite en un intervalo de 24 horas.

33. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por proporcionar, después de la administración de una dosis de aproximadamente 100 mg de posaconazol, como mínimo una vida media plasmática media de 14,9 a 38,4 horas aproximadamente, o un volumen medio de distribución plasmática en estado estacionario de 200 a 500 L aproximadamente.

34. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por proporcionar, después de la administración de una dosis de aproximadamente 200 mg de posaconazol, como mínimo una vida media plasmática media de 18,7 a 35,5 horas aproximadamente, o un volumen medio de distribución plasmática en estado estacionario de 200 a 500 L aproximadamente.

35. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por proporcionar, después de la administración de una dosis de aproximadamente 400 mg de

posaconazol, como mínimo una vida media plasmática media de 18,5 a 51.4 horas aproximadamente, o un volumen medio de distribución plasmática en estado estacionario de 200 a 500 L aproximadamente

36. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por proporcionar, después de la administración de una dosis de aproximadamente 600 mg de posaconazol, como mínimo una vida media plasmática media de 27,2 a 50,6 horas aproximadamente, o un volumen medio de distribución plasmática en estado estacionario de 200 a 500 L aproximadamente

37. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por proporcionar un perfil medio de concentración de posaconazol en sangre sustancialmente similar al perfil representado en el gráfico 1 cuando dicha formulación es suministrada mediante infusión, durante 1 hora aproximadamente, para administrar entre 25 y 600 mg de posaconazol.

38. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por proporcionar un perfil medio de concentración de posaconazol en plasma sustancialmente similar al perfil representado en el gráfico 2 cuando dicha formulación es suministrada mediante infusión, durante 1 hora aproximadamente, para administrar entre 25 y 600 mg de posaconazol.

39. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por brindar una proporción de $C_{máx}$ media sanguínea a $C_{máx}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,5 y 3,8 aproximadamente, cuando se suministra una dosis individual de dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente para administrar entre 25 y 600 mg de posaconazol.

40. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por brindar una proporción de $C_{máx}$ media sanguínea a $C_{máx}$ media plasmática de posaconazol de entre 2,1 y 3,3 aproximadamente, cuando se suministra una dosis individual de dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente para administrar 25 mg de posaconazol.

41. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por brindar una proporción de $C_{\text{máx}}$ media sanguínea a $C_{\text{máx}}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,9 y 3,8 aproximadamente, cuando se suministra una dosis individual de dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente para administrar 50 mg de posaconazol.

42. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por brindar una proporción de $C_{\text{máx}}$ media sanguínea a $C_{\text{máx}}$ media plasmática de posaconazol de entre 2,2 y 3,3 aproximadamente, cuando se suministra una dosis individual de dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente para administrar 100 mg de posaconazol.

43. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por brindar una proporción de $C_{\text{máx}}$ media sanguínea a $C_{\text{máx}}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,5 y 3,2 aproximadamente, cuando se suministra una dosis individual de dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente para administrar 200 mg de posaconazol.

44. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por brindar una proporción de $C_{\text{máx}}$ media sanguínea a $C_{\text{máx}}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,7 y 3,3 aproximadamente, cuando se suministra una dosis individual de dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente para administrar 400 mg de posaconazol.

45. La formulación de la Reivindicación 2, que se caracteriza además por brindar una proporción de $C_{\text{máx}}$ media sanguínea a $C_{\text{máx}}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,9 y 3,1 aproximadamente, cuando se suministra una dosis individual de dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente para administrar 600 mg de posaconazol.

46. La formulación de la Reivindicación 2, que además se caracteriza por brindar una proporción de $C_{\text{máx}}$ media sanguínea a $C_{\text{máx}}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,2 y 2,5 aproximadamente, en estado estacionario, cuando se suministra dicha

formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente, y se repite cada 24 horas, para administrar 25-600 mg de posaconazol.

47. La formulación de la Reivindicación 2, que además se caracteriza por brindar una proporción de $C_{m\acute{a}x}$ media sanguínea a $C_{m\acute{a}x}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,5 y 2,3 aproximadamente, en estado estacionario, cuando se suministra dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente, y se repite cada 24 horas, para administrar 25 mg de posaconazol.

48. La formulación de la Reivindicación 2, que además se caracteriza por brindar una proporción de $C_{m\acute{a}x}$ media sanguínea a $C_{m\acute{a}x}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,5 y 2,4 aproximadamente, en estado estacionario, cuando se suministra dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente, y se repite cada 24 horas, para administrar 50 mg de posaconazol.

49. La formulación de la Reivindicación 2, que además se caracteriza por brindar una proporción de $C_{m\acute{a}x}$ media sanguínea a $C_{m\acute{a}x}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,7 y 2,5 aproximadamente, en estado estacionario, cuando se suministra dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente, y se repite cada 24 horas, para administrar 100 mg de posaconazol.

50. La formulación de la Reivindicación 2, que además se caracteriza por brindar una proporción de $C_{m\acute{a}x}$ media sanguínea a $C_{m\acute{a}x}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,2 y 2,0 aproximadamente, en estado estacionario, cuando se suministra dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente, y se repite cada 24 horas, para administrar 200 mg de posaconazol.

51. La formulación de la Reivindicación 2, que además se caracteriza por brindar una proporción de $C_{m\acute{a}x}$ media sanguínea a $C_{m\acute{a}x}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,2 y 2,2 aproximadamente, en estado estacionario, cuando se suministra dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente, y se repite cada 24 horas, para administrar 400 mg de posaconazol.

249
H

52. La formulación de la Reivindicación 2, que además se caracteriza por brindar una proporción de $C_{\text{máx}}$ media sanguínea a $C_{\text{máx}}$ media plasmática de posaconazol de entre 1,3 y 1,7 aproximadamente, en estado estacionario, cuando se suministra dicha formulación por infusión durante 1 hora aproximadamente, y se repite cada 24 horas, para administrar 600 mg de posaconazol.

53. Una formulación que es bioequivalente a la formulación de cualquiera de las Reivindicaciones 1, 11, 12, 13, 17, 18 y 19.

54. La formulación de la reivindicación 1 donde dicha formulación ha sido sometida a liofilización.

55. El uso de la formulación de cualquiera de las Reivindicaciones 1, 11, 12, 13, 17, 18 y 19. para el tratamiento o prevención de una infección en un animal que lo necesite.

56. El uso de la reivindicación 55 donde dicha infección es causada por un hongo o parásito.

57. El uso de la reivindicación 55 donde dicha infección se selecciona del grupo que incluye: candidiasis orofaríngea o esofágica; candidiasis orofaríngea y esofágica refractaria; aspergilosis invasiva, candidiasis, fusariosis, scedosporiosis, infecciones causadas por hongos dimórficos, zigomicosis e infecciones invasivas debidas a mohos y levaduras poco frecuentes; micosis invasivas en pacientes que son refractarios a otras terapias o no las toleran; Candidiasis, infecciones invasivas por mohos en pacientes que han recibido quimioterapia y/o radioterapia intensivas por cánceres hematológicos, regímenes acondicionadores para trasplante de médula ósea o de células madre periféricas, y pacientes que reciben una terapia combinada de inmunosupresión para el tratamiento del rechazo inverso agudo o crónico o de prevención para el trasplante de un órgano sólido; enfermedad de Chagas; y leishmaniasis.

58. El uso de la reivindicación 55, que además comprende administrar un segundo ingrediente activo seleccionado del grupo que incluye: antifúngicos; anfotericina B, anfotericina B desoxicolato; flucitosina; terbinafina; antibacterianos; antivirales;

esteroides, fármacos antiinflamatorios no esteroides (nonsteroidal anti-inflammatory drugs, "NSAID"); quimioterapéuticos y antieméticos.

5 59. El uso de una formulación para el tratamiento o de prevención de una infección en un animal que lo necesite, que comprende la administración a dicho animal de una cantidad efectiva de posaconazol para una concentración en plasma máxima media (C_{max}) de posaconazol de como mínimo 467 ng/ml aproximadamente, en estado estacionario, y un valor medio del área bajo la curva de posaconazol en plasma durante 24 horas (AUC) de como mínimo 9.840 ng·h/ml en estado estacionario, cuando dicha formulación se suministra por infusión durante 1 hora aproximadamente, para administrar 100 mg de posaconazol, y se repite en un intervalo de 24 horas aproximadamente.
