

# OlarteRaisbeck



## FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2007/000192

### SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

**SOLICITANTE  
(71)**

**Nombre:** NOVARTIS AG

**Dirección:** Lichtstrasse 35, CH-456 Basel

**Nacionalidad o Domicilio:** Suiza

**Lugar de Constitución:** Suiza

**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:** office @olarteraisbeck.com

### IDENTIFICACIÓN

**C.C.** ☒ **NIT** ☐

**C.E.** ☐ **Otro** ☐

**Cual** \_\_\_\_\_

**Número** 79.782.747Bta  
**TP** 74.295

4

**Número de expediente:**

07-134.575

5

**Descripción de la corrección o modificación solicitada** Se adicionan las reivindicaciones 39 a 77 que reclaman específicamente la Forma B del compuesto de Fórmula I de la invención.

El soporte para las anteriores reivindicaciones se encuentra por ejemplo en la Descripción, de la página 12, línea 29, a la página 15, línea 14; página 25, línea 24, a la página 26, línea 9; y página 44, línea 23, a la página 45, línea 6. Valga anotar que las anteriores modificaciones no corresponden a ampliación alguna de la materia originalmente revelada en la presente solicitud, pues las nuevas reivindicaciones encuentran soporte en la solicitud como se describió anteriormente.

6

**Comprobante de pago No.** 08-30,011

**Fecha** Abril 14, 2008

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

246

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-134575- -00003-0000

Fecha: 2008-04-15 16:38:28 Dep. 2020 NUECREACION  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 12

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 30,011  
FECHA : ABRIL 14 DE 2008

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE    | TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO | FECHA PGO  | Vr. PAGO      |
|----------------|--------------|-----------------|-----------|----------|------------|---------------|
| OLARTE RAISBEK | CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 1483385  | 14/04/2008 | 10,690,000.00 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| CANT. | RENTISTICO  | CONCEPTO                       | TOTAL CONCEPTO |
|-------|-------------|--------------------------------|----------------|
| 1     | 50005-01-03 | CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA |                |
| 12    |             | MARCAS Y LEMAS COMERCIALES     | 103,000.00     |
|       |             | TOTAL :                        | \$ 103,000.00  |

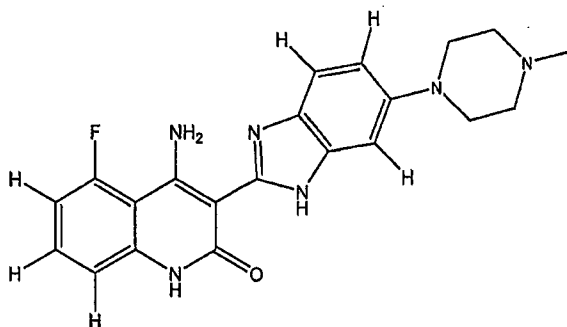
SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : \_\_\_\_\_

## CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(modificaciones voluntarias)

1. Una formulación sólida de una sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I:



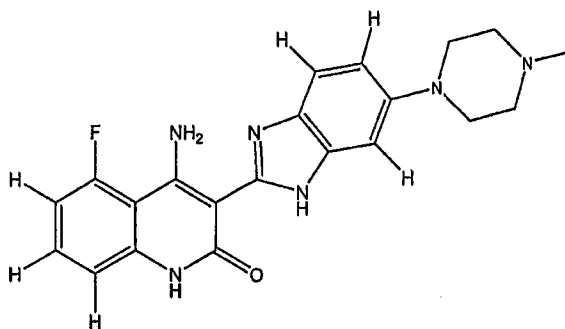
I

para la administración oral donde dicha formulación comprende una forma cristalina no hidratada de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I.

2. La formulación de la reivindicación 1 donde dicha forma cristalina no hidratada es la Forma A.
3. La formulación de la reivindicación 2 donde dicha Forma A es preparada por agitación del compuesto de fórmula I en una solución compuesta de agua, solvente orgánico y ácido láctico.
4. La formulación de la reivindicación 3 donde dicho solvente orgánico es un alcohol.
5. La formulación de la reivindicación 4 donde dicho alcohol es etanol.
6. La formulación de la reivindicación 1 donde dicha sal de ácido láctico de fórmula I es una sal de ácido láctico monomérico.
7. La formulación de la reivindicación 1 en la forma de un polvo.

29<sup>8</sup>

8. Un método de tratamiento de un paciente con una formulación sólida de una sal de ácido láctico de un compuesto de fórmula I:



I

que comprende la administración oral de dicha formulación, donde dicha formulación comprende una forma cristalina no hidratada de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I.

9. El método de la reivindicación 8 donde dicha forma cristalina no hidratada es la Forma A.

10. El método de la reivindicación 8 donde dicho paciente es un paciente con cáncer.

11. El método de la reivindicación 10 donde dicho paciente ha sido diagnosticado con mieloma múltiple (MM), leucemia mielógena aguda (AML), cáncer de próstata, cáncer de mama, cáncer de colon, o melanoma.

12. El método de la reivindicación 10 donde dicho paciente es un paciente refractario.

13. El método de reivindicación 8, donde dicha formulación comprende dicha forma cristalina no hidratada de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I en una cantidad suficiente para proporcionar a dicho paciente entre alrededor de 0.25 y alrededor de 30 mg de fórmula I en base libre por kg de peso corporal.

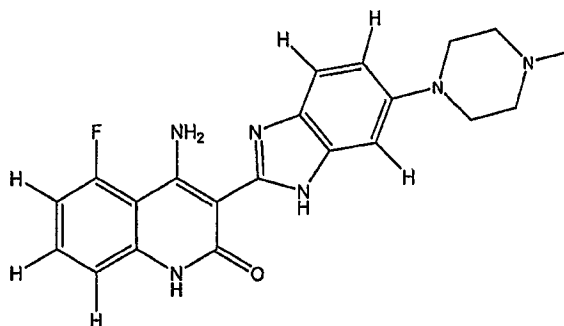
14. El método de la reivindicación 8 donde dicha formulación está en forma sólida en el momento de la administración.

249

5

15. La formulación de la reivindicación 1 donde dicha formulación se prepara en forma de una píldora, tableta, cápsula, o un comprimido.

16. Una forma cristalina (Forma A) de una sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I:



I

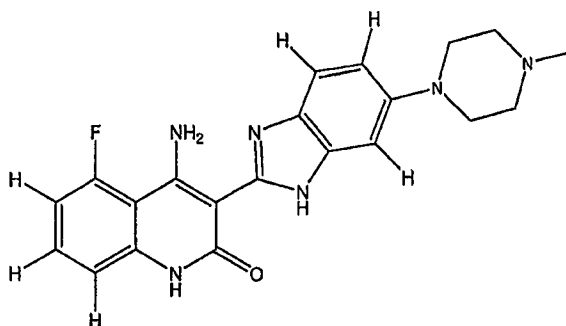
donde dicha forma cristalina tiene un patrón de difracción de rayos x de muestras en polvo que comprende picos característicos, en términos de  $2\theta$ , a alrededor de  $5.7^\circ$  y alrededor de  $25.9^\circ$ .

17. La forma cristalina de la reivindicación 16 que tiene además un pico característico, en términos de  $2\theta$ , a alrededor de  $15.9^\circ$ .

18. La forma cristalina de la reivindicación 17 que tiene además un pico característico, en términos de  $2\theta$ , a alrededor de  $12.4^\circ$ .

19. La forma cristalina de la reivindicación 18 que tiene además un pico característico, en términos de  $2\theta$ , a alrededor de  $17.0^\circ$ .

20. Una forma cristalina (Forma A) de una sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I:



I

donde dicha forma cristalina, tiene un patrón de difracción de rayos x de muestras en polvo compuesto por al menos 3 picos característicos, en términos de  $2\theta$ , seleccionados a partir de alrededor de 5.7, alrededor de 11.3, alrededor de 12.4, alrededor de 15.3, alrededor de 15.9, alrededor de 17.0, alrededor de 19.1, alrededor de 19.7, alrededor de 20.5, alrededor de 20.9, alrededor de 22.8, alrededor de 23.4, alrededor de 23.7, alrededor de 24.7, alrededor de 25.0, alrededor de 25.9, alrededor de 26.9, y alrededor de 31.2 grados.

21. La forma cristalina de la reivindicación 16 que tiene un patrón de difracción de rayos x de muestras en polvo sustancialmente, como se muestra en la Figura 1.

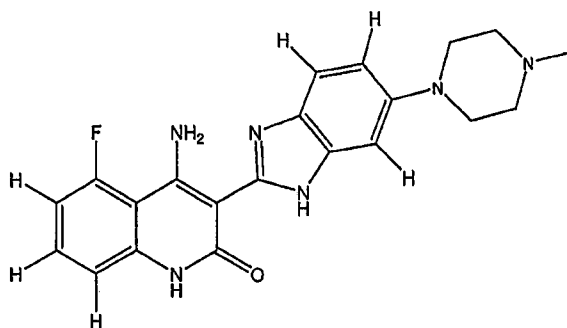
22. La forma cristalina de la reivindicación 16 que tiene un termograma de calorimetría de exploración diferencial que muestra una endoterma a alrededor de 210 °C.

23. La forma cristalina de la reivindicación 16 que tiene un termograma de calorimetría de exploración diferencial sustancialmente como se muestra en la Figura 2.

24. Una composición que comprende la forma cristalina de la reivindicación 16.

25. La composición de la reivindicación 24 donde al menos alrededor del 50% en peso de la sal de ácido láctico total del compuesto de fórmula I en dicha composición está presente como dicha forma de cristal.

26. La composición de la reivindicación 24 donde al menos alrededor del 70% en peso de la sal de ácido láctico total del compuesto de fórmula I en dicha composición está presente como dicha forma de cristal.
27. La composición de la reivindicación 24 donde al menos alrededor del 80% en peso de la sal de ácido láctico total del compuesto de fórmula I en dicha composición está presente como dicha forma de cristal.
28. La composición de la reivindicación 24 donde al menos alrededor del 90% en peso de la sal de ácido láctico total del compuesto de fórmula I en dicha composición está presente como dicha forma de cristal.
29. La composición de la reivindicación 24 donde al menos alrededor del 95% en peso de la sal de ácido láctico total del compuesto de fórmula I en dicha composición está presente como dicha forma de cristal.
30. La composición de la reivindicación 24 donde al menos alrededor del 97% en peso de la sal de ácido láctico total del compuesto de fórmula I en dicha composición está presente como dicha forma de cristal.
31. La composición de la reivindicación 24 donde al menos alrededor del 98% en peso de la sal de ácido láctico total del compuesto de fórmula I en dicha composición está presente como dicha forma de cristal.
32. La composición de la reivindicación 24 donde al menos alrededor del 99% en peso de la sal de ácido láctico total del compuesto de fórmula I en dicha composición está presente como dicha forma de cristal.
33. La composición de la reivindicación 24 que además comprende un portador farmacéuticamente aceptable.
34. Una composición que consiste esencialmente de la sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I:



I

donde al menos el 95% en peso de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I está presente en dicha composición como dicha forma de cristal de la reivindicación 16.

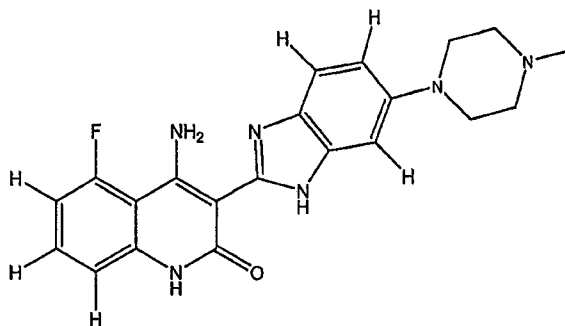
35. Una composición que consiste esencialmente de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I donde al menos el 97% en peso de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I está presente en dicha composición como dicha forma de cristal de la reivindicación 16.

36. Una composición que consiste esencialmente de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I donde al menos el 98% en peso de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I está presente en dicha composición como dicha forma de cristal de la reivindicación 16.

37. Una composición que consiste esencialmente de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I donde al menos el 99% en peso de dicha sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I está presente en dicha composición como dicha forma de cristal de la reivindicación 16.

38. Un método de preparación de la forma cristalina de la reivindicación 16 que comprende agitar el compuesto de fórmula I en una solución que comprende agua, solvente orgánico y ácido láctico.

39. Un hidrato cristalino de una sal de ácido láctico de un compuesto de Fórmula I



I

40. El hidrato de la reivindicación 39 donde la relación molar del agua del hidrato para la sal de ácido láctico del compuesto de Fórmula I es de alrededor de 1 o de alrededor de 6.

41. El hidrato de la reivindicación 39 el cual es un monohidrato o un hexahidrato.

42. El hidrato de la reivindicación 41 el cual es una sal de ácido láctico monomérico.

43. El hidrato de la reivindicación 39 (Forma B) que tiene un patrón de difracción de rayos x de muestras en polvo que comprende picos característicos, en términos de  $2\theta$ , a alrededor de  $17.6^\circ$ , alrededor de  $19.3^\circ$  y alrededor de  $26.0^\circ$ .

44. El hidrato de la reivindicación 43, donde dicho patrón de difracción de rayos x de muestras en polvo de dicho hidrato comprende además picos característicos, en términos de  $2\theta$ , a alrededor de  $23.3^\circ$ , alrededor de  $23.5^\circ$  y alrededor de  $28.2^\circ$ .

45. El hidrato de la reivindicación 44, donde dicho patrón de difracción de rayos x de muestras en polvo de dicho hidrato comprende además picos característicos, en términos de  $2\theta$ , a alrededor de  $11.9^\circ$ , alrededor de  $15.3^\circ$ , alrededor de  $16.1^\circ$  y alrededor de  $18.5^\circ$ .

46. El hidrato de la reivindicación 45, donde dicho patrón de difracción de rayos x de muestras en polvo de dicho hidrato comprende además picos característicos, en términos de  $2\theta$ , a alrededor de  $10.2^\circ$  y alrededor de  $12.9^\circ$ .

47. El hidrato de la reivindicación 43, donde dicha forma cristalina tiene un patrón de difracción de rayos X en muestras en polvo que comprende al menos 3 picos característicos, en términos de  $2\theta$ , seleccionados a partir de: a alrededor de 10.2, alrededor de 11.3, alrededor de 11.6, alrededor de 11.9, alrededor de 12.9, alrededor de 15.3, alrededor de 15.6, a alrededor de 16.1, alrededor de 17.6, a alrededor de 18.5, alrededor de 19.3, alrededor de 22.3, alrededor de 23.3, alrededor de 23.5, alrededor de 23.9, alrededor de 26.0, alrededor de 28.2, alrededor de 29.3, alrededor de 29.8, alrededor de 30.7, alrededor de 32.2, alrededor de 32.6, alrededor de 33.1 y alrededor de 34.3°.

48. El hidrato de la reivindicación 43, donde dicho patrón de difracción de rayos X en muestras en polvo de dicho hidrato es sustancialmente como se muestra en la Figura 6.

49. El hidrato de la reivindicación 43, que tiene un termograma de calorimetría de barrido diferencial mostrando una endoterma a alrededor de 155 °C.

50. Una composición que comprende un hidrato de acuerdo con las reivindicaciones 39, 40, 41, 42 ó 43.

51. La composición de la reivindicación 50, donde al menos cerca del 50% en peso del hidrato presente en dicha composición está presente como forma B.

52. La composición de la reivindicación 50, donde al menos cerca del 70% en peso del hidrato presente en dicha composición está presente como forma B.

53. La composición de la reivindicación 50, donde al menos cerca del 80% en peso del hidrato presente en dicha composición está presente como forma B.

54. La composición de la reivindicación 50, donde al menos cerca del 90% en peso del hidrato presente en dicha composición está presente como forma B.

55. La composición de la reivindicación 50, donde al menos cerca del 95% en peso del hidrato presente en dicha composición está presente como forma B.

56. La composición de la reivindicación 50, donde al menos cerca del 99% en peso del hidrato presente en dicha composición está presente como forma B.

57. La composición de la reivindicación 50, que además comprende un portador farmacéuticamente aceptable.
58. Un método de preparar el hidrato de la reivindicación 43, que comprende suspender la Forma A en una solución que comprende agua y solvente orgánico, a una temperatura de alrededor de 20 °C a alrededor de 60 °C, donde dicha agua está presente e dicha solución en una cantidad de alrededor del 50% a alrededor del 20% en volumen.
59. El método de la reivindicación 58, donde dicho solvente orgánico comprende un alcohol, una cetona, un nitrilo orgánico, o mezcla de los mismos.
60. El método de la reivindicación 58, donde dicho solvente orgánico comprende uno o más de etanol, acetona, metil etil cetona, y acetonitrilo.
61. Un hidrato de una sal de ácido láctico de un compuesto de Fórmula I preparado por el método de la reivindicación 58.
62. Una formulación sólida para administración oral que comprende un hidrato de acuerdo con las reivindicaciones 39, 40, 41, 42, 43 ó 61.
63. La formulación de la reivindicación 62, donde dicha formulación es en forma de un polvo.
64. La formulación de la reivindicación 62, donde dicho hidrato permanece sustancialmente intacto bajo condiciones ambientales por un período mayor de alrededor de 36 horas.
65. La formulación de la reivindicación 62, donde dicho hidrato permanece sustancialmente intacto bajo condiciones ambientales por un período mayor de alrededor de 1 semana.
66. La formulación de la reivindicación 62, donde dicho hidrato permanece sustancialmente intacto bajo condiciones ambientales por un período mayor de alrededor de 1 mes.

67. La formulación de la reivindicación 62, donde dicho hidrato permanece sustancialmente intacto bajo condiciones ambientales por un período mayor de alrededor de 6 meses.
68. La formulación de la reivindicación 62, donde dicho hidrato permanece sustancialmente intacto bajo condiciones ambientales por un período mayor de alrededor de 1 año.
69. Una forma de dosificación que comprende una formulación de acuerdo con la reivindicación 62.
70. La forma de dosificación de la reivindicación 69, donde dicha forma de dosificación es un polvo, píldora, tableta, cápsula, comprimido o gránulo.
71. Un método de tratar un paciente, dicho método comprende administrar a dicho paciente una formulación farmacéutica que comprende un hidrato de las reivindicaciones 39, 40, 41, 42, 43 ó 61.
72. El método de la reivindicación 71, donde dicho paciente es un paciente de cáncer.
73. El método de la reivindicación 71, donde dicho paciente ha sido diagnosticado con mieloma múltiple (MM), la leucemia mielógena aguda (AML), cáncer de próstata, cáncer de mama, cáncer de colon, o melanoma.
74. El método de la reivindicación 71, donde dicho paciente es un paciente refractario.
75. El método de la reivindicación 71, donde dicho paciente es tratado con una dosis que menor que la dosis máxima tolerada (DMT).
76. El método de la reivindicación 71, donde dicha dosis comprende 0.25 a 30 mg/kg de la sal de ácido láctico del compuesto de fórmula I.
77. El método de la reivindicación 71, donde dicha formulación es en forma sólida en el momento de la administración.

\*\*\*\*\*

375

**REPUBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Folio 360

2020  
Bogotá D.C.,

Doctor(a)  
OLARTE GARCIA CARLOS REYNALDO  
Apoderado(a) y/o Representante de  
NOVARTIS AG

|            |                            |                   |
|------------|----------------------------|-------------------|
| REFERENCIA | Radicación No.             | 7 134575          |
|            | Solicitud internacional    | PCT/US2006/020296 |
|            | Fecha inicio fase nacional | 23/12/2007        |
|            | Trámite                    | 11                |
|            | Evento                     | 378               |
|            | Actuación                  | 416               |
|            | Oficio No.                 | 7157              |
|            | Folios                     | 1                 |

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase  
Dado en Bogotá DC,

27 NOV. 2008

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL  
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpa11