

OlarteRaisbeck



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-105792- -00003-0000

Fecha: 2008-11-26 15:56:47 Dep: 2020 NUECREACIONE
Tra: 11 PATENTLIYII Lev: 378 FASENACIONALI
Act: 329 CTOINFORMACION Folios: 10

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2008/000177

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: Estadounidense

Lugar de Constitución: Estados Unidos

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 79.782.747 Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:
08-105.792

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada Se corrige la dependencia
de la Reivindicación 15.

6

Comprobante de pago No. 08-91,024

Fecha Noviembre 21 de 2008

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa y Capitulo reivindicatorio Modificado.

☐

Poderes, si fuere el caso. Documento que soporta la cesión de Derechos

☐

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

8

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA: _____

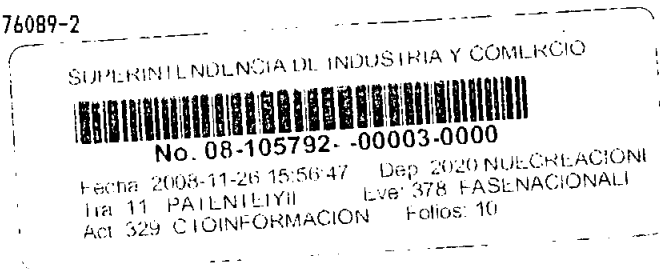
C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

2
95

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 91,024
ECHA : NOVIEMBRE 21 DE 2008



***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	11592416	21/11/2008	4,694,000.00

***** 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 : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

[illegible]

REF: 77-000000000000000000

[illegible]

1944-45 7 7 4 5 3 1 3 5 10 11

07980/00	07980/00	07980/00	07980/00
----------	----------	----------	----------

00-000-760
00-000-760

' RESULTS FROM SEARCH OF RECORDS IN
: LAURET

SEARCHED BY JAMES M. BROWN JR.
JAMES M. BROWN JR.

09-10-2000

2025 JUL 23 AM 11 1952

: 5 '843:0937

ALL INFORMATION CONTAINED HEREIN IS UNCLASSIFIED

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

- (1) Una formulación farmacéutica compuesta de una sal cristalina de monohidrato de hidrocloreto de la (5S,8S)-8-[[[(1R)-1-(3,5-Bis-trifluorometil)fenil]-etoximetil]-8-fenil-1,7-diaza-espiro[4.5]decan-2-ona, lactosa, celulosa microcristalina, sodio croscarmeloso, almidón pregelatinizado y estearato de magnesio.
- (2) La formulación de la reivindicación 1 con el perfil farmacocinético de la Tabla 1

Tabla 1

Dosis (mg)	C _{máx} * (ng/mL)	T _{máx} **	AUC***	T _{1/2} (horas)
5	27,3	2	931	no calc.
10	52,7	2,5	1820	no calc.
25	119	2,5	17200	183
50	276	3	33600	171
100	475	2	74400	181
200	944	4	148000	169

*Máxima concentración promedio en plasma posterior a la administración de dosis sencilla.

**Tiempo promedio de concentración máxima en plasma a partir de la administración.

*** Concentración integrada durante un período de 0 a 72 horas posteriores a la administración

- 3) La formulación de cualquiera de las reivindicaciones 1 ó 2 en las cuales la sal de monohidrato de hidrocloreto posee un patrón de difracción de rayos X de muestras en polvo conteniendo los siguientes picos característicos expresados en términos de ángulo de difracción (en 2θ , todos los valores reflejan una exactitud de $\pm 0,2$) espaciamiento "d" reticular (en ángstroms) e intensidades pico relativas (relative peak intensities, RI):

Ángulo de difracción (2θ , $\pm 0,2$)	RI	Espaciado reticular ($\text{\AA} \pm 0,04$)
16,1	Medias	5,49
18,4	Medias	4,83

21,6	Fuertes	4,11
23,5	Débiles	3,78

- (4) Una cápsula conteniendo una cantidad de la formulación de cualquiera de las reivindicaciones 1 a la 3 proporcionando una dosis de 2,5 mg del monohidrato de hidrocloreuro la cual proporciona un perfil de disolución promedio en 12 muestras en 900 mL de medio de disolución conteniendo 0,25% de solución de sulfato de lauril de sodio amortiguada con 0,05 M de acetato de sodio a un pH de 4,5 determinado utilizando un Agitador de palas USP 2 con plomadas (pesos) funcionando a 75 RPM de lo indicado en la Tabla 2.

Tabla 2

Tiempo (mín.)	Promedio (% de activo inicialmente presente liberado)	Rango de % activo liberado sobre las muestras n
5	69%	64% - 74%
15	88%	83% - 94%
30	94%	90% - 100%
45	97%	93% - 102%
60	98%	94% - 103%

- (5) Una cápsula conteniendo una cantidad de la formulación de cualquiera de las reivindicaciones 1 a la 3 proporcionando una dosis de 10,0 mg del monohidrato de hidrocloreuro la cual proporciona un perfil de disolución promedio en 12 muestras en 900 mL de medio de disolución conteniendo 0,25% de solución de sulfato de lauril de sodio amortiguada con 0,05 M de acetato de sodio a un pH de 4,5 determinado utilizando un Agitador de palas USP 2 con plomadas (pesos) funcionando a 75 RPM de lo indicado en la Tabla 3.

Tabla 3

Tiempo (mín.)	Promedio (% de activo inicialmente presente liberado)	Rango de % activo liberado sobre las muestras n
5	87%	82% - 91%
15	95%	91% - 98%
30	98%	94% - 100%
45	98%	95% - 101%
60	99%	96% - 100%

- (6) Una cápsula conteniendo una cantidad de la formulación de cualquiera de las reivindicaciones 1 a la 3 proporcionando una dosis de 50,0 mg del monohidrato de hidrocloreuro la cual proporciona un perfil de disolución promedio en 12 muestras en 900 mL de medio de disolución conteniendo 0,25% de solución de sulfato de lauril de sodio amortiguada con 0,05 M de acetato de sodio a un pH de 4,5 determinado utilizando un Agitador de palas USP 2 con plomadas (pesos) funcionando a 75 RPM de lo indicado en la Tabla 4.

Tabla 4

Tiempo (mín.)	Promedio (% de activo inicialmente presente liberado)	Rango de % activo liberado sobre las muestras n
5	88%	74% - 96%
15	97%	91% - 101%
30	99%	94% - 102%
45	100%	95% - 102%
60	100%	96% - 103%

- (7) Un método para proporcionar un tratamiento contra la émesis en un mamífero que lo necesite consistiendo en la administración al mamífero de la formulación de cualquiera de las reivindicaciones 1 a la 6.

6.
ay

- (8) Un método para proporcionar un tratamiento contra la náusea en un mamífero que lo necesite consistiendo en la administración al mamífero de la formulación de cualquiera de las reivindicaciones 1 a la 6.
- (9) La formulación de cualquiera de las reivindicaciones 1 a la 3 en la que dicha lactosa es monohidrato de lactosa.
- (10) Una cápsula llenada con un granulado de la Fórmula I la cual se caracteriza por poseer un Q-45 no inferior a 75% cuando se prueba como un promedio de seis tabletas bajo condiciones S-1.
- (11) Una formulación farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones 1 a la 3 preparada por el proceso que incluye:
- (a) preparar un granulado mediante el proceso que incluye:
 - (i) mezclar en seco la sal clorhidrato monohidrato cristalina de la Fórmula I, monohidrato de lactosa, sodio croscarmelosa y almidón pregelatinizado para proporcionar una mezcla de polvo homogénea;
 - (ii) granular la mezcla de polvo homogénea indicada en el Paso "a" con agua purificada hasta obtener un granulado con un porcentaje menor a aproximadamente 32% de peso en agua;
 - (iii) moler en húmedo el granulado provisto en el Paso "b" por un tamiz de malla N° 8 a N° 10; y
 - (iv) secar el granulado húmedo, molido producido en el Paso "c" en una secadora de cama de fluido,
- en donde la sal cristalina de monohidrato de hidrocloreuro utilizada en el Paso "a" posee un espectro de difracción de rayos X de muestras en polvo que presenta los siguientes picos característicos expresados en términos del ángulo de difracción (en 2θ , todos los valores reflejan una exactitud de $\pm 0,2$) espaciamiento "d" reticular (en angstroms) e intensidades pico relativas (relative peak intensities, RI) mostradas en la Tabla Ia; y

Tabla Ia

<u>Ángulo de difracción ($2\theta \pm 0.2$)</u>	<u>RI</u>	<u>Espaciamiento reticular ($\text{\AA} \pm 0.04$)</u>
--	-----------	---

16,1	Medias	5,49
18,4	Medias	4,83
21,6	Fuertes	4,11
23,5	Débiles	3,78

(b) mezclar en seco el granulado preparado en el Paso "a" con celulosa microcristalina, sodio croscarmeloso y estearato de magnesio para formar una formulación en polvo homogénea.

- (12) Una cápsula conteniendo una cantidad de la formulación de la reivindicación 11 proporcionando una dosis de 2,5 mg del monohidrato de hidrocloreuro la cual proporciona un perfil de disolución promedio en 12 muestras en 900 mL de medio de disolución conteniendo 0,25% de solución de sulfato de lauril de sodio amortiguada con 0,05 M de acetato de sodio a un pH de 4,5 determinado utilizando un Agitador de palas USP 2 con plomadas (pesos) funcionando a 75 RPM de lo indicado en la Tabla 2.

Tabla 2

Tiempo (mín.)	Promedio (% de activo inicialmente presente liberado)	Rango de % activo liberado sobre las muestras n
5	69%	64% - 74%
15	88%	83% - 94%
30	94%	90% - 100%
45	97%	93% - 102%
60	98%	94% - 103%

- (13) Una cápsula conteniendo una cantidad de la formulación de la reivindicación 11 proporcionando una dosis de 10,0 mg del monohidrato de hidrocloreuro la cual proporciona un perfil de disolución promedio en 12 muestras en 900 mL de medio de disolución conteniendo 0,25% de solución de sulfato de lauril de sodio amortiguada con 0,05 M de acetato

8
101

de sodio a un pH de 4,5 determinado utilizando un Agitador de palas USP 2 con plomadas (pesos) funcionando a 75 RPM de lo indicado en la Tabla 3.

Tabla 3

Tiempo (mín.)	Promedio (% de activo inicialmente presente liberado)	Rango de % activo liberado sobre las muestras n
5	87%	82% - 91%
15	95%	91% - 98%
30	98%	94% - 100%
45	98%	95% - 101%
60	99%	96% - 100%

- (14) Una cápsula conteniendo una cantidad de la formulación de la reivindicación 11 proporcionando una dosis de 50,0 mg del monohidrato de hidrocloreuro la cual proporciona un perfil de disolución promedio en 12 muestras en 900 mL de medio de disolución conteniendo 0,25% de solución de sulfato de lauril de sodio amortiguada con 0,05 M de acetato de sodio a un pH de 4,5 determinado utilizando un Agitador de palas USP 2 con plomadas (pesos) funcionando a 75 RPM de lo indicado en la Tabla 4.

Tabla 4

Tiempo (mín.)	Promedio (% de activo inicialmente presente liberado)	Rango de % activo liberado sobre las muestras n
5	88%	74% - 96%
15	97%	91% - 101%
30	99%	94% - 102%
45	100%	95% - 102%
60	100%	96% - 103%

- (15) Un método para proporcionar un tratamiento contra la émesis y/o contra la náusea en un mamífero que lo necesite que comprende la

administración al mamífero de uno ó más cápsulas de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 12 a 14.

- (16) La formulación de la reivindicación 11 con el perfil farmacocinético de la Tabla 1

Tabla 1

Dosis (mg)	C _{máx} * (ng/mL)	T _{máx} **	AUC***	T1/2 (horas)
5	27,3	2	931	no calc.
10	52,7	2,5	1820	no calc.
25	119	2,5	17200	183
50	276	3	33600	171
100	475	2	74400	181
200	944	4	148000	169

*Máxima concentración promedio en plasma posterior a la administración de dosis sencilla.

**Tiempo promedio de máxima concentración en plasma a partir de la administración.

*** Concentración integrada durante un período de 0 a 72 horas posteriores a la administración

- (17) La formulación de la reivindicación 1 consta además de un agente quimioterapéutico.
- (18) La formulación de la reivindicación 17 en donde el agente terapéutico es temozolomida.
- (19) Un método para proporcionar la terapia para la émesis iniciada retardada y/o náusea iniciada retardada junto con quimioterapia mediante la administración de la formulación de cualquiera de las reivindicaciones 17 y 18 a un paciente que necesita quimioterapia.
- (20) El método de tratamiento de la reivindicación 16 consta además de la administración contemporánea de un agente quimioterapéutico.

- (21) El método de tratamiento de la reivindicación 20 en donde el agente quimioterapéutico es temozolomida.
- (22) Un método para tratar y/o prevenir náuseas o emesis en un mamífero que comprende la administrar al mamífero la formulación de la Reivindicación 4.
- (23) Un método para tratar y/o prevenir náuseas o emesis en un mamífero que comprende la administrar al mamífero la formulación de la Reivindicación 5.
- (24) Un método para tratar y/o prevenir náuseas o emesis en un mamífero que comprende la administrar al mamífero la formulación de la Reivindicación 6.
- (25) El proceso de la Reivindicación 11, donde sal clorhidrato monohidrato cristalina usada en el paso (a) presenta un espectro de difracción de rayos X que presenta los siguientes picos característicos expresados en términos del ángulo de difracción (en valores 2θ , todos los valores presentan una exactitud de ± 0.2) espaciamiento reticular (en angstroms) e intensidad de pico relativo que se muestran en la Tabla Ia;

Tabla Ia

<u>Ángulo de difracción ($2\theta \pm 0.2$)</u>	<u>RI</u>	<u>Espaciamiento reticular ($\text{\AA} \pm 0.04$)</u>
16,1	Medias	5,49
18,4	Medias	4,83
21,6	Fuertes	4,11
23,5	Débiles	3,78 y

- (26) La combinación de la Formulación de la reivindicación 1 y otro agente terapéutico.

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 104

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
OLARTE GARCIA CARLOS REYNALDO
Apoderado(a) y/o Representante de
SCHERING CORPORATION

REFERENCIA	Radicación No.	8 105792
	Solicitud internacional	PCT/US2007/008345
	Fecha inicio fase nacional	05/11/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	9523
	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,

09 DIC. 2009

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

jfernand