



CSA220728

Organización y
Digitalización CSA Ltda

OF

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDE



Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD

PCT

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

08-117760

54. TÍTULO

USO DE FLIBANSERINA PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS

POSMENOPAUSICOS DEL DESEO SEXUAL

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH

DOMICILIO

INGELHEIM AM RHEIN, ALEMANIA

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C.,

6/3

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

Español

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 08-117760- -00000-0000

Fecha: 2008-11-05 11:23:17
Tra. 11 PATENTE IYI
Act. 411 PRESENTACIONDep. 2020 NUECREACION
Eve: 378 FASE NACIONAL
Folios: 41**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL****SOLICITUD DE:**

1

☒ Patente de Invención.☐ Patente de Modelo de Utilidad.☒ Capítulo I.☐ Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**Nombre: **BOEHRINGER INGELHEIM
INTERNATIONAL GMBH**sociedad constituida y existente bajo las
leyes de Alemania.Dirección: Binger Strasse 173,
55216 Ingelheim am Rhein
AlemaniaDomicilio: Ingelheim am Rhein
Alemania**IDENTIFICACIÓN**

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**Nombre: **EMILIO FERRERO**

Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35

Teléfono: 347 36 11

Fax: 211 86 50

E-mail: clientes@cavelier.com

Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número 438.019 T.P 31.929

4

**INVENTOR (ES)
(72)**1. **Stephane POLLENTIER**Boschmansweg 17,
1871 AW Schoorl,
Países Bajos2. **Robert PYKE**900 Ridgebury Road,
P.O. Box 368,
Ridgefield,
Connecticut 06877,
Estados Unidos de América

5

PCT (86)Solicitud Internacional No. PCT/EP2007/054380Fecha: 7 de mayo de 2007Publicación Internacional No. WO 2007/128802 A3Fecha: 15 de noviembre de 2007

6

Título (54)**USO DE FLIBANSERINA PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS
POSMENOPÁUSICOS DEL DESEO SEXUAL**

7

Clasificación Internacional (51) A61K 031/496

8

PrioridadSI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

USUS

(32) Fecha

9 de mayo de 200614 de julio de 2006

(31) Número de Solicitud

60/746,81760/830,987

9

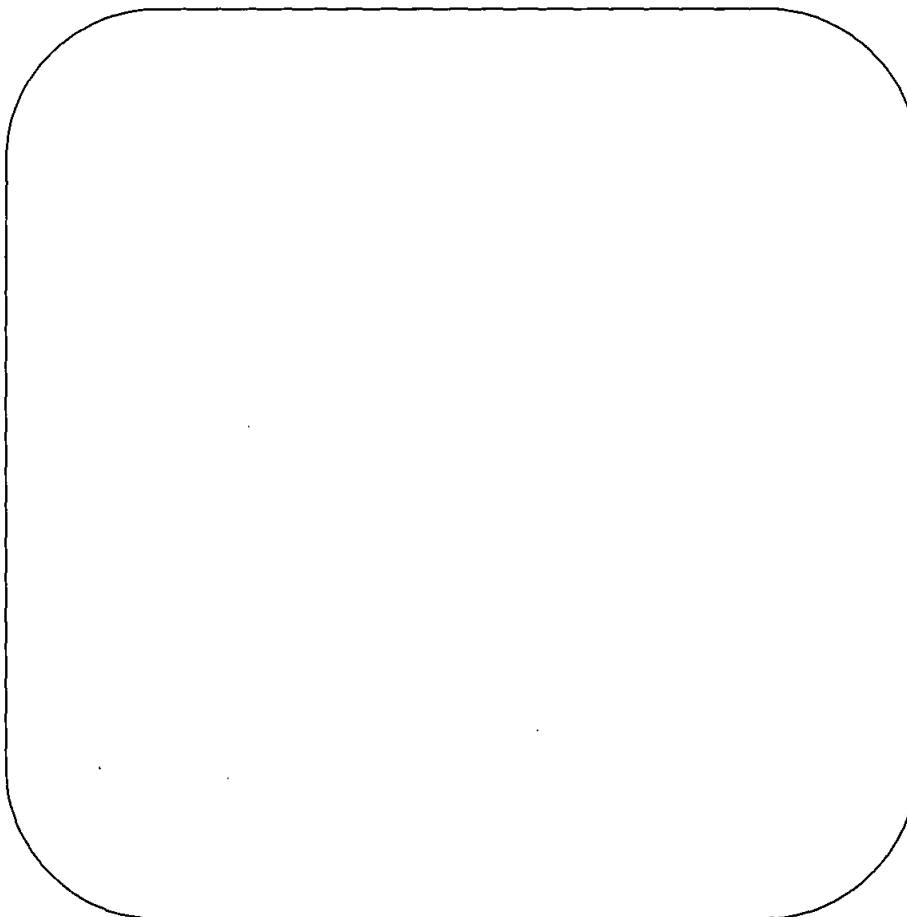
Comprobante de pago No.: 08-85,033**Fecha: 28 de octubre de 2008**

10

Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 501.000.00.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☐ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

11

FIGURA CARACTERÍSTICA

12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA:

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

JGG

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2007/128802 A3

Descripción:

Páginas 8 en el idioma original

Páginas 9 en español

Reivindicaciones: Número (s) 16

Figuras: Número (s)

2. ☒ **Forma PCT/ISA/210.** Informe de Búsqueda Internacional.
3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA FASE
INTERNACIONAL**



CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA

MUNICH

Nr. 169

El Cónsul General de Colombia

CERTIFICA

Que el Dr. Hanns Paul Tüttenberg -----, quién autentica la firma del signatario en el presente documento, ejercía en la fecha allí indicada las funciones de Presidente del Tribunal Regional -en Mainz.

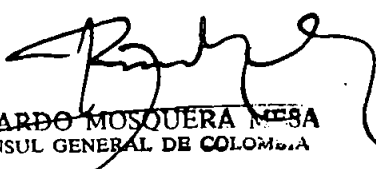
Que la firma BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GmbH, domiciliada en 55216 Ingelheim am Rhein, Registro Mercantil Nr. HR B 1063 del Juzgado Municipal de Bingen está constituida y ejerce su objeto social de conformidad con las leyes de la República Federal de Alemania.

Que los señores Dr. DIETER LAUDIN Y Dr. GERHARD HUBER

quien(es) firman el presente documento tiene (n) facultad legal suficiente para representar a la mencionada firma y otorgar poderes en su nombre.

Que ha tenido a la vista la documentación que prueba lo anterior.

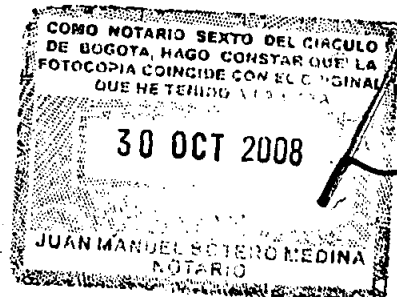
Munich, 18 de Diciembre de 1995


RICARDO MOSQUERA MESA
CONSUL GENERAL DE COLOMBIA

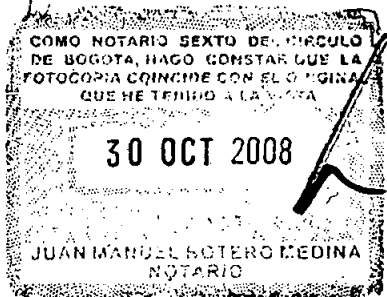


Derechos para la Nación	US \$ 6.-
Fondo Rotatorio	US \$ 100.-
Tasa consular	US \$ 1 x DM 1,60 = DM 169.60

PAGADO



BOGOTÁ 21/10/2008



MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES
BOGOTÁ

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
BOGOTÁ 21/10/2008
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.

CUZ ARRIBA A LA VISTA
BOGOTÁ 21/10/2008
1-204-5133-4007
Resolución No. 57 y Modificación

For patents, utility models, industrial designs
trademarks, commercial names, trade emblems
slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños
industriales, marcas de fábrica, nombres
comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND
POWER OF ATTORNEY

9255
0569

I (we), the undersigned /Yo (nosotros), abajo firmado (s)
BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH

of/domiciliado (s) en D-55216 Ingelheim am Rhein,
GERMANY

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

In due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans; commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

Given and signed this/Dado y firmado hoy

BOEHRINGER INGELHEIM

In/en

INTERNATIONAL GMBH

ppq.

ppq.

Dr. Dieter Laudien

Signature

Dr. Gerhard Huber

Firma NOTARIO

Ingelheim am Rhein 12.12.1995

DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA
PROTECCIÓN COINCIDE CON EL GENERAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

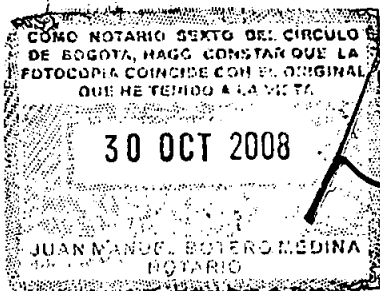
30 OCT 2008

LEGALIZACION

El Señor Cónsul de Colombia debe expedir un *certificado consular* sobre (1) la existencia legal de la compañía que otorga el poder, (2) que ésta ejerce su objeto social, y (3) que las personas que otorgan el poder están autorizadas para darlo. A este efecto les solicitamos que muestren al Señor Cónsul las pruebas que acreditan esos hechos (1), (2) y (3).

LEGALIZATION

The Colombia Consul must issue a *consular certificate*, on (1) the legal existence of the company which grants Power-of-Attorney, (2) that it is in actual exercise of company purposes, and (3) that the persons who execute the Power of Attorney is authorized to do so. To this effect, please show the Consul the evidence to prove the above facts (1), (2) and (3).



NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL DE COLOMBIA: Según los artículos 65 del C. de P.C. y 480 del C. de Co., si el poderdante es una sociedad, el Señor Cónsul debe certificar que tuvo a la vista las pruebas de su existencia, que ejerce su objeto social y que quien confiere el poder es su representante.

UR.Nr. 2659 / 95 V

Vorseitige, vor mir gefertigte Namensunterschriften der Herren:

1. Dr. Dieter L a u d i e n, Dipl.-Chemiker, wohnhaft in 55127 Mainz,.
2. Dr. Gerhard H u b e r, Rechtsanwalt, wohnhaft in 55411 Bingen,.

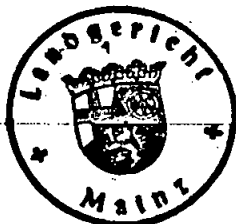
- mir bekannt -

beglaubige ich hiermit.

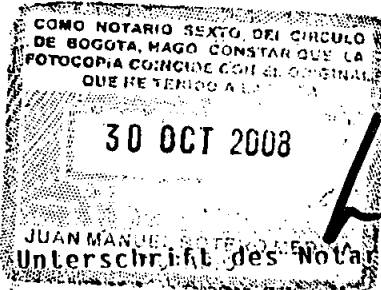
Gleichzeitig bescheinige ich aufgrund heutiger Einsichtnahme in das Handelsregister des Amtsgerichts Bingen, daß die Firma Boehringer Ingelheim International GmbH mit Sitz in Ingelheim am Rhein im Handelsregister des Amtsgerichts Bingen unter HR B 1063 eingetragen ist und daß die Herren Dr. Laudien und Dr. Huber als Prokuristen gemeinschaftlich zur Vertretung der Gesellschaft berechtigt sind.

Ingelheim am Rhein, den 12. Dezember 1995/hün

Notariatsverweser
anstelle des Notars
Prof. Dr. Weirich in Ingelheim



- 910 E 1 -



Die Echtheit vorstehender Unterschrift des Notarassessors Dr. Peter Wirth - Notariatsverweser anstelle des Notars Prof. Dr. Weirich in Ingelheim und die Echtheit des beigedruckten Dienst - ~~scheines~~ - siegels werden hierdurch bestätigt. Zugleich wird bescheinigt, daß der Vorgenannte zur Vornahme der Amtshandlung gesetzlich befugt war.

Kostenberechnung:

Gebühr für Legalisation
(Wert: DM 500,-)
JV Kost O. v. 26.7.1957
BGBl. I S. 861
DM 20,-

Mainz, den 13. DEZ. 1995

Amtsinspektor



Mainz, den dreizehnen Dezember neunzehnhundertfünfundneunzig
Der Präsident des Landgerichts

Dr. Hanns Paul Tüttenberg

TRADUCCION OFICIAL No. 5133

de un documento escrito en Alemán, el cual para su identificación se sella con el sello de la traductora, lo mismo que la presente.-

(A continuación del poder conferido a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO tpa, 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555; domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia, por la BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH, domiciliada en D-55216 Ingelheim am Rhein, RFA, a través de sus representantes los Srs. Dr. Dieter Laudien y Dr. Gerhard Huber:)

LUZ ANAYA DE HERRERA
TRADUCTORA
Fotocopia
Resolución No. 599 Minutario

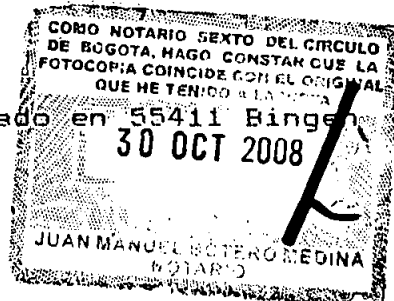
Legalización

Protocolo notarial No. 2659/95 V

Certifico la autenticidad de las firmas antecedentes puestas ante mí por los señores:

1. Dr. Dieter Laudien, Dipl. Chim., domiciliado en 55127 Mainz,
2. Dr. Gerhard Huber, abogado, domiciliado en 55411 Bingen

a quienes conozco en persona.



Iguualmente certifico, por haber examinado en la fecha el Registro de Comercio del Juzgado Municipal de Bingen, HR B 1063, que la firma Boehringer Ingelheim International GmbH, domiciliada en Ingelheim am Rhein, está inscrita bajo el No. HR B 1063 en el Registro de Comercio del Juzgado Municipal de Bingen y que los señores Dr. Laudien y Dr. Huber, en su calidad de apoderados, están facultados para representar conjuntamente a la sociedad.

Ingelheim am Rhein, 12 de diciembre de 1995/hün

Fdo.: firma ilegible

(Hilo y oblea roja en relieve:)

El notario suplente

El notario suplente - Ingelheim

del notario de Ingelheim

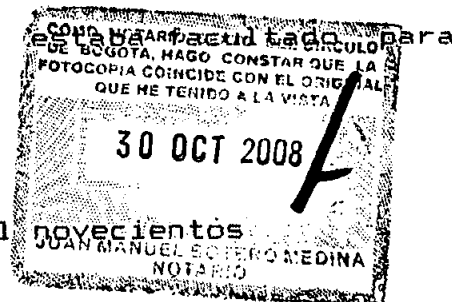
Prof. Dr. Weirich

(dos sellos redondos en tinta del Tribunal Regional de Mainz)

910 E 1

Se certifica la autenticidad de la firma antecedente del Dr. Peter Wirth, como notario suplente del Prof. Dr. Weirich, notario de Ingelheim, y la del sello oficial que la acompaña. Igualmente se certifica que el mencionado notario realizar ese acto oficial.

Mainz, trece de diciembre de mil novecientos
noventa y cinco



LUZ ARRIAGA DE HERRERA
TRADUCTORA INTERPRETE JURIDICA
Resolución No. 599 Ministros

COMO NOTARIO SEXTO ENCARGADO DE SANTAFE DE BOGOTA HAGO CONSTAR QUE LA FIRMA DE
El Presidente del Tribunal Regional

(E) Fdo.: firma ilegible

(Dr. Hanns Paul Tüttenberg)

Costas

Derechos de legalización
(Valor:DM 5.000,-)
JVKostO del 26 de julio 1957
Gacetas Oficial I Pag. 861
DM 20,--
Mainz, 13 de diciembre de 1995
Fdo.: firma ilegible
Inspector

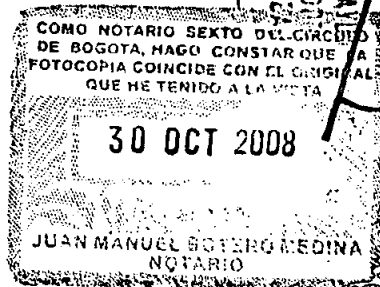
EN ESPAÑOL: La legalización de las firmas antecedentes por el
Consulado de Colombia en Munich bajo el No. 1 de 1 de
diciembre de 1995, y por el Ministerio de Relaciones Exteriores
de Colombia bajo el No. 051606 del 4 de enero de 1996.
Pagados derechos y Fondo Rotatorio US\$ 106,--

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja copia en los
archivos de estas oficinas para su confrontación.

Santafé de Bogotá, 6 de enero de 1996.

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL

Ministerio de Justicia



COMO NOTARIO SEXTO ENCARGADO DE SANTAFE
DE BOGOTA HAGO CONSTAR QUE LA FIRMA DE

C. C. _____
CONCIDE CON LA REGISTRADA POR EL (ELLA)
EN ESTA NOTARIA

09 ENE 1996

SANTAFE DE BOGOTA D.C.



NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TERCERO
09 ENE 10 A 11:33
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

COMO NOTARIO SEXTO DE CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
09 OCT 2008
CUYA FIRMA
DOCUMENTO
LAS FUNCIONES

TELEFAX: (57) (1) 3719850
TELEX: 45479 CAVE CO
12317407375 CAVE UC

CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4ª, No. 72-35
BOGOTA 8, COLOMBIA

CORREO ELECTRONICO MUNDIAL: CAVE
TELEFONO (57) (1) 2120100
CABLES: CAVELEYES

Señor Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Poderdante: BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH

Poder conferido el: 12-12-95.

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder que me ha sido conferido en la persona del doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No. 31.929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,



GERMAN CAVELIER

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

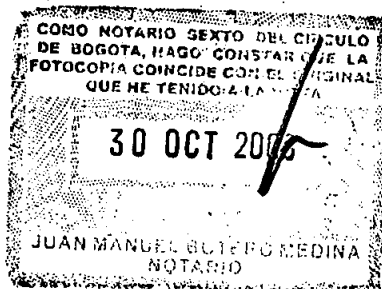
Acepto:



EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén



2e-780-2

NOTARIA SEXTA DE BOGOTA

RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL

Bogotá,,D. C.

11 ENE 1996

Ante M. PABLO MENDEZ BARAJAS S.

NOTARIO SEXTO ENCARGADO DEL CIRCULO DE BOGOTA

Comparació(eron)

quien(es) exhibió(eron) la(s)

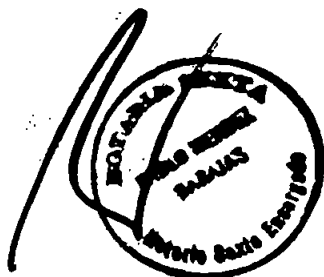
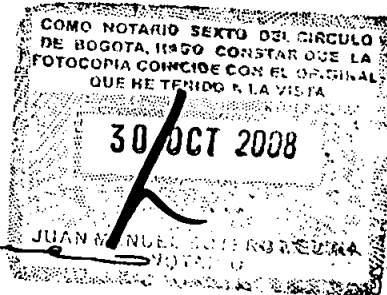
y la(s) Libreta(s) Militares)

domiciliado(s) en Bogotá y declaró(aron) que la(s) firma(s) que aparecen(n) en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y que el contenido del mismo es cierto.

En constancia se firma esta Diligencia.

San Calo

Emilio F...



(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
15 November 2007 (15.11.2007)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2007/128802 A3

(51) International Patent Classification:
A61K 31/496 (2006.01) A61P 15/00 (2006.01)
A61P 15/12 (2006.01)

(74) Agents: HAMMANN, Heinz et al.; Boehringer Ingelheim
International GMBH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim
Am Rhein (DE).

(21) International Application Number:
PCT/EP2007/054380

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN,
IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR,
LS, LT, LU, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY,
MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS,
RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(22) International Filing Date: 7 May 2007 (07.05.2007)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/746,817 9 May 2006 (09.05.2006) US
60/830,987 14 July 2006 (14.07.2006) US

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, PL,
PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Applicant (for all designated States except DE, US):
BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL
GMBH [DE/DE]; Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim
Am Rhein (DE).

(71) Applicant (for DE only): BOEHRINGER INGELHEIM
PHARMA GMBH & CO. KG [DE/DE]; Binger Strasse
173, 55216 Ingelheim Am Rhein (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): POLLENTIER,
Stephane [BE/NL]; Boschmansweg 17, NL-1871 AW
Schoorl (NL). PYKE, Robert [US/US]; 900 Ridgebury
Road, Ridgefield, Connecticut 06877 (US).

Published:

- with international search report
- before the expiration of the time limit for amending the
claims and to be republished in the event of receipt of
amendments

(88) Date of publication of the international search report:
12 June 2008

WO 2007/128802 A3

(54) Title: USE OF FLIBANSERIN FOR THE TREATMENT OF POST-MENOPAUSAL SEXUAL DESIRE DISORDERS

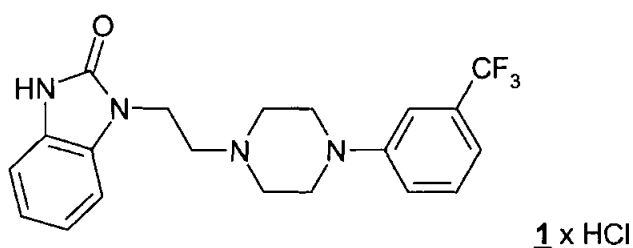
(57) Abstract: The invention relates to the use of flibanserin for the preparation of a medicament for the treatment of
post-menopausal Sexual Desire Disorders.

Use of flibanserin for the treatment of post-menopausal Sexual Desire Disorders

The invention relates to the use of flibanserin for the preparation of a medicament for the treatment of post-menopausal Sexual Desire Disorders.

Description of the invention

The compound 1-[2-(4-(3-trifluoromethyl-phenyl)piperazin-1-yl)ethyl]-2,3-dihydro-1H-benzimidazol-2-one (flibanserin) is disclosed in form of its hydrochloride in European Patent Application EP-A-526434 and has the following chemical structure:



Flibanserin shows affinity for the 5-HT_{1A} and 5-HT₂-receptor. It is therefore a promising therapeutic agent for the treatment of a variety of diseases, for instance depression, schizophrenia, and anxiety.

The generic term "Sexual Disorders" includes Sexual Desire Disorders, Sexual Arousal Disorders, Orgasmic Disorders, Sexual Pain Disorders, Sexual Dysfunction due to a General Medical Condition, Substance-Induced Sexual Dysfunction, and Sexual Dysfunction not otherwise specified (Diagnostic and Statistical Manual of Mental Disorders, 4th edition, Text Revision. Washington DC, American Psychiatric Association, 2000).

The instant invention relates to the use of flibanserin, optionally in form of the free base, the pharmacologically acceptable acid addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof for the preparation of a medicament for the treatment of Sexual Desire Disorders in post-menopausal women.

Within the present invention the terms "treatment of post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder" etc. have the meaning of "treatment of Hypoactive Sexual Desire Disorders in post-menopausal women" etc.

The beneficial effects of flibanserin can be observed regardless of whether the Sexual Desire Disorder existed lifelong or was acquired, is of the „generalized type“

or „situational type“ and independent of etiologic origin (organic - both, physically and drug induced-, psychogen (due to psychological factors), a combination of organic - both, physically and drug induced-, and psychogen (due to psychological factors), or unknown). The term “lifelong” refers to such Sexual Desire Disorders of the
5 present invention, which have been present since the onset of sexual functioning. The term “acquired” refers to such Sexual Desire Disorders of the present invention which developed only after a period of normal sexual functioning. The „generalized type“ refers to such Sexual Disorders of the present invention wherein the disorder is not limited to certain types of stimulation, situations, or partners. The „situational
10 type“ applies to such Sexual Disorders of the present invention wherein the disorder is limited to certain types of stimulation, situations, or partners. The subtype due to “psychological factors” applies when psychological factors are judged to have the major role in the onset, severity, exacerbation, or maintenance of the Sexual Disorder, and general medical conditions and substance play no role in the etiology
15 of the Sexual Disorder. Finally the subtype due to “combined factors” applies when 1) psychological factors are judged to have a role in the onset, severity, exacerbation, or maintenance of the Sexual Disorder, and 2) a general medical condition or substance use is also judged to be contributory but is not sufficient to account for a Sexual Disorder (Diagnostic and Statistical Manual of Mental
20 Disorders, 4th edition, Text Revision. Washington DC, American Psychiatric Association, 2000).

Therefore, e.g. the term “lifelong post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder” refers to Hypoactive Sexual Desire Disorder in post-menopausal women
25 which has been present since the onset of sexual functioning and the term “acquired post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder” refers to Hypoactive Sexual Desire Disorder in post-menopausal women, which developed after a period of normal sexual functioning. Although there may seem to be an apparent contradiction in the wording “lifelong post-menopausal” this should be understood as a disorder
30 diagnosed after the menopause whereby history reveals that the disorder in fact was present since the onset of sexual functioning.

Accordingly, in a preferred embodiment the invention relates to the use of flibanserin, optionally in form of the free base, the pharmacologically acceptable acid
35 addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof for the preparation of a medicament for the treatment of disorders selected from the group consisting of lifelong post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder, lifelong

14

post-menopausal Sexual Aversion Disorder, lifelong post-menopausal loss of sexual desire, lifelong post-menopausal lack of sexual desire, lifelong post-menopausal decreased sexual desire, lifelong post-menopausal inhibited sexual desire, lifelong post-menopausal loss of libido, lifelong post-menopausal libido disturbance, and
5 lifelong post-menopausal frigidity.

Particular preferred according to the invention is the use of flibanserin, optionally in form of the free base, the pharmacologically acceptable acid addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof for the preparation of a
10 medicament for the treatment of disorders selected from the group consisting of lifelong post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder, lifelong post-menopausal Sexual Aversion Disorder, lifelong post-menopausal loss of sexual desire, lifelong post-menopausal lack of sexual desire, lifelong post-menopausal decreased sexual desire, and lifelong post-menopausal inhibited sexual desire.

15 In a particularly preferred embodiment the invention relates to the use of flibanserin, optionally in form of the free base, the pharmacologically acceptable acid addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof for the preparation of a medicament for the treatment of disorders selected from the group
20 of lifelong post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder lifelong post-menopausal loss of sexual desire and lifelong post-menopausal decreased sexual desire.

In a further preferred embodiment the invention relates to the use of flibanserin,
25 optionally in form of the free base, the pharmacologically acceptable acid addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof for the preparation of a medicament for the treatment of disorders selected from the group consisting of acquired post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder, acquired post-menopausal Sexual Aversion Disorder, acquired post-menopausal
30 loss of sexual desire, acquired post-menopausal lack of sexual desire, acquired post-menopausal decreased sexual desire, acquired post-menopausal inhibited sexual desire, acquired post-menopausal loss of libido, acquired post-menopausal libido disturbance, and acquired post-menopausal frigidity.

35 Furthermore preferred according to the invention is the use of flibanserin, optionally in form of the free base, the pharmacologically acceptable acid addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof for the preparation of a

medicament for the treatment of disorders selected from the group consisting of acquired post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder, acquired post-menopausal Sexual Aversion Disorder, acquired post-menopausal loss of sexual desire, acquired post-menopausal lack of sexual desire, acquired post-menopausal decreased sexual desire, acquired post-menopausal inhibited sexual desire.

In a particularly preferred embodiment the invention relates to the use of flibanserin, optionally in form of the free base, the pharmacologically acceptable acid addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof for the preparation of a medicament for the treatment of disorders selected from the group of acquired post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder, acquired post-menopausal loss of sexual desire and acquired post-menopausal decreased sexual desire.

Furthermore the present invention relates to the generalized or situational subtype of any of the above mentioned conditions and/or to such which are due to psychological factors or due to combined factors).

Flibanserin can optionally used in form of the free base, in form of its pharmaceutically acceptable acid addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof. Suitable acid addition salts include for example those of the acids selected from, succinic acid, hydrobromic acid, acetic acid, fumaric acid, maleic acid, methanesulphonic acid, lactic acid, phosphoric acid, hydrochloric acid, sulphuric acid, tartaric acid and citric acid. Mixtures of the abovementioned acid addition salts may also be used. From the aforementioned acid addition salts the hydrochloride and the hydrobromide, particularly the hydrochloride, are preferred. If flibanserin is used in form of the free base, it is preferably used in form of flibanserin polymorph A as disclosed in WO 03/014079.

Flibanserin, optionally used in form of the free base, the pharmacologically acceptable acid addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof, may be incorporated into the conventional pharmaceutical preparation in solid, liquid or spray form. The composition may, for example, be presented in a form suitable for oral, rectal, parenteral administration or for nasal inhalation: preferred forms includes for example, capsules, tablets, coated tablets, ampoules, suppositories and nasal spray.

The active ingredient may be incorporated in excipients or carriers conventionally used in pharmaceutical compositions such as, for example, talc, arabic gum, lactose, gelatine, magnesium stearate, corn starch, aqueous or non aqueous vehicles, polyvinyl pyrrolidone, semisynthetic glycerides of fatty acids, benzalconium chloride, sodium phosphate, EDTA, polysorbate 80. The compositions are advantageously formulated in dosage units, each dosage unit being adapted to supply a single dose of the active ingredient. The dose range applicable per day is between 0.1 to 400, preferably between 1.0 to 300, more preferably between 2 to 200 mg. Each dosage unit may conveniently contain from 0.01 mg to 100 mg, preferably from 0.1 to 50 mg.

The dosage forms are administered to the patient 1, 2, 3, or 4 times daily. It is preferred that the compounds of the invention be administered either three or fewer times, more preferably once or twice daily consecutively over a period of time.

Preferably, the dose is administered to a patient in the morning and the evening, more preferably once in the morning (25 or 50 mg of flibanserin) and once in the evening (25 or 50 mg of flibanserin), most preferably once in the evening only (50 or 100 mg of flibanserin) consecutively over a period of time. In order to improve tolerability for a short period half the target dose can be administered.

As a result side-effects such as sedation are of lesser significance.

Suitable tablets may be obtained, for example, by mixing the active substance(s) with known excipients, for example inert diluents such as calcium carbonate, calcium phosphate or lactose, disintegrants such as corn starch or alginic acid, binders such as starch or gelatine, lubricants such as magnesium stearate or talc and/or agents for delaying release, such as carboxymethyl cellulose, cellulose acetate phthalate, or polyvinyl acetate. The tablets may also comprise several layers.

Coated tablets may be prepared accordingly by coating cores produced analogously to the tablets with substances normally used for tablet coatings, for example collidone or shellac, gum arabic, talc, titanium dioxide or sugar. To achieve delayed release or prevent incompatibilities the core may also consist of a number of layers. Similarly the tablet coating may consist of a number of layers to achieve delayed release, possibly using the excipients mentioned above for the tablets.

17

Syrups or elixirs containing the active substances or combinations thereof according to the invention may additionally contain a sweetener such as saccharine, cyclamate, glycerol or sugar and a flavour enhancer, e.g of. a flavouring such as vanilline or orange extract. They may also contain suspension adjuvants or
5 thickeners such as sodium carboxymethyl cellulose, wetting agents such as, for example, condensation products of fatty alcohols with ethylene oxide, or preservatives such as p-hydroxybenzoates.

Solutions for injection are prepared in the usual way, e.g of. with the addition of
10 preservatives such as p-hydroxybenzoates, or stabilisers such as alkali metal salts of ethylenediamine tetraacetic acid, and transferred into injection vials or ampoules.

Capsules containing one or more active substances or combinations of active substances may for example be prepared by mixing the active substances with inert
15 carriers such as lactose or sorbitol and packing them into gelatine capsules.

Suitable suppositories may be made for example by mixing with carriers provided for this purpose, such as neutral fats or polyethyleneglycol or the derivatives thereof.

20 The Examples which follow illustrate the present invention without restricting its scope:

Examples of pharmaceutical formulations

25	A)	<u>Tablets</u>	<u>per tablet</u>
		flibanserin	100 mg
		lactose	240 mg
		corn starch	340 mg
30		polyvinylpyrrolidone	45 mg
		magnesium stearate	15 mg
			740 mg

35 The finely ground active substance, lactose and some of the corn starch are mixed together. The mixture is screened, then moistened with a solution of polyvinylpyrrolidone in water, kneaded, wet-granulated and dried. The granules, the

remaining corn starch and the magnesium stearate are screened and mixed together. The mixture is compressed to produce tablets of suitable shape and size.

	B)	<u>Tablets</u>	<u>per tablet</u>
5		flibanserin	80 mg
		corn starch	190 mg
		lactose	55 mg
		microcrystalline cellulose	35 mg
10		polyvinylpyrrolidone	15 mg
		sodium-carboxymethyl starch	23 mg
		magnesium stearate	<u>2 mg</u>
			400 mg

15 The finely ground active substance, some of the corn starch, lactose, microcrystalline cellulose and polyvinylpyrrolidone are mixed together, the mixture is screened and worked with the remaining corn starch and water to form a granulate which is dried and screened. The sodium-carboxymethyl starch and the magnesium stearate are added and mixed in and the mixture is compressed to form tablets of a
20 suitable size.

	C)	<u>Coated tablets</u>	<u>per coated tablet</u>
		flibanserin	5 mg
25		corn starch	41.5 mg
		lactose	30 mg
		polyvinylpyrrolidone	3 mg
		magnesium stearate	<u>0.5 mg</u>
			80 mg

30 The active substance, corn starch, lactose and polyvinylpyrrolidone are thoroughly mixed and moistened with water. The moist mass is pushed through a screen with a 1 mm mesh size, dried at about 45°C and the granules are then passed through the same screen. After the magnesium stearate has been mixed in, convex tablet cores
35 with a diameter of 6 mm are compressed in a tablet-making machine . The tablet cores thus produced are coated in known manner with a covering consisting essentially of sugar and talc. The finished coated tablets are polished with wax.

- 5

D)

Capsules

per capsule

flibanserin

1 50 mg

Corn starch

268.5 mg

Magnesium stearate

1.5 mg

420 mg

10

The substance and corn starch are mixed and moistened with water. The moist mass is screened and dried. The dry granules are screened and mixed with magnesium stearate. The finished mixture is packed into size 1 hard gelatine capsules.

15

E)

Ampoule solution

flibanserin

50 mg

sodium chloride

50 mg

water for inj.

5 ml

20

The active substance is dissolved in water at its own pH or optionally at pH 5.5 to 6.5 and sodium chloride is added to make it isotonic. The solution obtained is filtered free from pyrogens and the filtrate is transferred under aseptic conditions into ampoules which are then sterilised and sealed by fusion.

25

F)

Suppositories

flibanserin

50 mg

solid fat

1650 mg

1700 mg

30

The hard fat is melted. At 40°C the ground active substance is homogeneously dispersed. It is cooled to 38°C and poured into slightly chilled suppository moulds.

Patent Claims

- 1) Use of flibanserin, optionally in form of the free base, the pharmacologically acceptable acid addition salts and/or optionally in form of the hydrates and/or solvates thereof for the preparation of a medicament for the treatment of post-menopausal Sexual Desire Disorders (lifelong or acquired) in women.
5
- 2) Use according to claim 1, characterized in that the post-menopausal Sexual Desire Disorder is selected from the group consisting of lifelong post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder, lifelong post-menopausal Sexual Aversion Disorder, lifelong post-menopausal loss of sexual desire, lifelong post-menopausal lack of sexual desire, lifelong post-menopausal decreased sexual desire, lifelong post-menopausal inhibited sexual desire, lifelong post-menopausal loss of libido, lifelong post-menopausal libido disturbance, and lifelong post-menopausal frigidity.
10
15
- 3) Use according to claim 1 or 2, characterized in that the post-menopausal Sexual Desire Disorder is selected from the group consisting of lifelong post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder, lifelong post-menopausal Sexual Aversion Disorder, lifelong post-menopausal loss of sexual desire, lifelong post-menopausal lack of sexual desire, lifelong post-menopausal decreased sexual desire, lifelong post-menopausal inhibited sexual desire.
20
- 4) Use according to claim 1, characterized in that the post-menopausal Sexual Desire Disorder is selected from the group consisting of acquired post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder, acquired post-menopausal Sexual Aversion Disorder, acquired post-menopausal loss of sexual desire, acquired post-menopausal lack of sexual desire, acquired post-menopausal decreased sexual desire, acquired post-menopausal inhibited sexual desire, acquired post-menopausal loss of libido, acquired post-menopausal libido disturbance, and acquired post-menopausal frigidity.
25
30
- 5) Use according to claim 1 or 4, characterized in that the post-menopausal Sexual Desire Disorder is selected from the group consisting of acquired post-menopausal Hypoactive Sexual Desire Disorder, acquired post-menopausal Sexual Aversion Disorder, acquired post-menopausal loss of sexual desire,
35

acquired post-menopausal lack of sexual desire, acquired post-menopausal decreased sexual desire, acquired post-menopausal inhibited sexual desire.

- 5 6) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that the post-menopausal Sexual Desire Disorders are of the generalized subtype.
- 7) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that the post-menopausal Sexual Desire Disorders are of the situational subtype.
- 10 8) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that the post-menopausal Sexual Desire Disorders are due to psychological factors.
- 9) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that the post-menopausal Sexual Desire Disorders are due to combined factors.
- 15 10) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that flibanserin is applied in form of a pharmaceutically acceptable acid addition salt selected from the salts formed by the acids selected from, succinic acid, hydrobromic acid, acetic acid, fumaric acid, maleic acid, methanesulphonic acid, lactic acid, phosphoric acid, hydrochloric acid, sulphuric acid, tartaric acid, citric acid, and mixtures thereof.
- 20 11) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that flibanserin is applied in form of its free base.
- 25 12) Use according to claim 11, characterized in that flibanserin is applied in form of a polymorph A of the free base, having a melting point of about 161 °C as measured using DSC
- 30 13) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that flibanserin is applied in a dosis range between 0.1 to 400 mg per day.
- 35 14) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that flibanserin is applied once or twice daily consecutively over a period of time.

15) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that flibanserin is applied in the morning and the evening, more preferably once in the morning (25 or 50 mg of flibanserin) and once in the evening (25 or 50 mg of flibanserin),

5

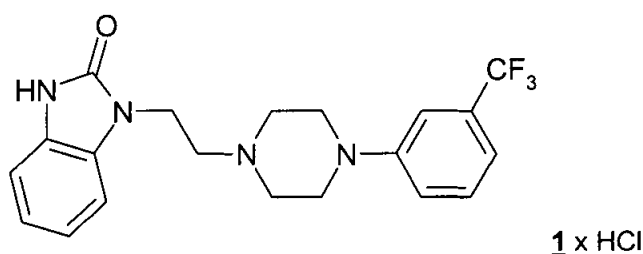
16) Use according to one or more of the preceding claims, characterized in that flibanserin is applied once in the evening only (50 or 100 mg of flibanserin) consecutively over a period of time.

Uso de flibanserina para el tratamiento de trastornos posmenopáusicos del deseo sexual

La invención se refiere al uso de flibanserina para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos posmenopáusicos del deseo sexual.

Descripción de la invención

El compuesto 1-[2-(4-(3-trifluorometil-fenil)piperazin-1-il)etil]-2,3-dihidro-1H-benzimidazol-2-ona (flibanserina) se describe en su forma de hidrocloreto en la solicitud de patente europea EP-A-526434 y tiene la estructura química siguiente:



La flibanserina muestra afinidad por el receptor 5-HT_{1A} y por el receptor 5-HT₂. Por tanto, es un agente terapéutico prometedor para el tratamiento de una variedad de enfermedades, por ejemplo la depresión, la esquizofrenia y la ansiedad.

La expresión genérica "trastornos sexuales" incluye: trastornos del deseo sexual, trastornos de la excitación sexual, trastornos orgásmicos, trastornos sexuales dolorosos, disfunción sexual debida a una enfermedad general, disfunción sexual inducida por sustancias y disfunción sexual no especificada de otro modo (Diagnostic and Statistical Manual of Mental Disorders, 4^a edición, Revisión del texto. Washington DC, American Psychiatric Association, 2.000).

La presente invención se refiere al uso de flibanserina, opcionalmente en forma de base libre, a las sales de adición de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de hidratos y/o de sus solvatos, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos del deseo sexual en mujeres posmenopáusicas.

En la presente invención las expresiones "tratamiento del trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico" etc. tienen el significado de "tratamiento de trastornos del deseo sexual hipoactivo en mujeres posmenopáusicas", etc.

Los efectos beneficiosos de flibanserina pueden observarse independientemente de si el trastorno del deseo sexual existía de por vida o fue adquirido, es de "tipo generalizado" o de "tipo circunstancial" e independiente de origen etiológico (orgánico tanto, físicamente como inducido por fármacos, psicógeno (debido a factores psicológicos), una combinación de origen orgánico tanto, físicamente como inducido por fármacos, y psicógeno (debido a factores psicológicos), o desconocido). La expresión "de por vida" se refiere a dichos trastornos del deseo sexual de la presente invención, que han estado presentes desde el comienzo del funcionamiento sexual. El término "adquirido" se refiere a dichos trastornos del deseo sexual de la presente invención que se desarrollan sólo después de un periodo de funcionamiento sexual normal. El "tipo generalizado" se refiere a dichos trastornos sexuales de la presente invención en los que el trastorno no está limitado a determinados tipos de estimulación, situaciones o parejas. El "tipo circunstancial" se aplica a dichos trastornos sexuales de la presente invención en los que el trastorno está limitado a ciertos tipos de estimulación, situaciones o parejas. El subtipo debido a "factores psicológicos" se aplica cuando se interpreta que los factores psicológicos tienen la función principal en el comienzo, la gravedad, el agravamiento o el mantenimiento del trastorno sexual y las enfermedades generales y la sustancia no desempeñan una función en la etiología del trastorno sexual. Finalmente el subtipo debido a "factores asociados" se aplica cuando: 1) se interpreta que los factores psicológicos desempeñan una función en el comienzo, la gravedad, el agravamiento o el mantenimiento del trastorno sexual y 2) asimismo se interpreta que una enfermedad general o el uso de sustancias farmacéuticas contribuye pero no es suficiente para justificar un trastorno sexual (Diagnostic and Statistical Manual of Mental Disorders, 4ª edición, Revisión del texto. Washington DC, American Psychiatric Association, 2.000).

Por lo tanto, por ej., la expresión "trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico de por vida" se refiere al trastorno del deseo sexual hipoactivo en mujeres posmenopáusicas que ha estado presente desde el comienzo del funcionamiento sexual y la expresión "trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico adquirido" se refiere al trastorno del deseo sexual hipoactivo en mujeres posmenopáusicas, que se desarrolla tras un periodo de funcionamiento sexual normal. Aunque pueda parecer que es una contradicción aparente en la expresión "posmenopáusica de por vida" ésta debe interpretarse como un trastorno diagnosticado después de la menopausia mediante el cual los antecedentes ponen de

manifiesto que el trastorno de hecho estuvo presente desde el comienzo del funcionamiento sexual.

De acuerdo con esto, en una realización preferida la invención se refiere al uso de la flibanserina, opcionalmente en forma de la base libre, a las sales de adición de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de los hidratos y/o a los solvatos de la misma, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos seleccionados del grupo que consiste en: trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico de por vida, trastorno de la aversión sexual posmenopáusico de por vida, pérdida de deseo sexual posmenopáusica de por vida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica de por vida, deseo sexual disminuido posmenopáusico de por vida, deseo sexual inhibido posmenopáusico de por vida, pérdida de la libido posmenopáusica de por vida, trastorno de la libido posmenopáusico de por vida y frigidez posmenopáusica de por vida.

Se prefiere en particular de acuerdo con la invención el uso de flibanserina, opcionalmente en forma de la base libre, las sales de adición de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de los hidratos y/o los solvatos de la misma, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos seleccionados del grupo que consiste en: trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico de por vida, trastorno de la aversión sexual posmenopáusico de por vida, pérdida de deseo sexual posmenopáusica de por vida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica de por vida, disminución del deseo sexual posmenopáusica de por vida y deseo sexual inhibido posmenopáusico de por vida.

En una realización preferida en particular la invención se refiere al uso de flibanserina, opcionalmente en forma de la base libre, a las sales de adición de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de los hidratos y/o los solvatos de la misma, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos seleccionados del grupo de: trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico de por vida, pérdida de deseo sexual posmenopáusica de por vida y disminución del deseo sexual posmenopáusica de por vida.

En una realización preferida adicional la invención se refiere al uso de flibanserina, opcionalmente en forma de la base libre, a las sales de adición de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de los hidratos y/o a los solvatos de la misma, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos seleccionados del grupo que consiste en: trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico adquirido, trastorno de la aversión sexual

posmenopáusico adquirido, pérdida de deseo sexual posmenopáusica adquirida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica adquirida, deseo sexual disminuido posmenopáusico adquirido, deseo sexual inhibido posmenopáusico adquirido, pérdida de la libido posmenopáusica adquirida, trastorno de la libido posmenopáusico adquirido y frigidez posmenopáusica adquirida.

Además se prefiere de acuerdo con la invención el uso de flibanserina, opcionalmente en forma de la base libre, las sales de adición de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de los hidratos y/o los solvatos de la misma, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos seleccionados del grupo que consiste en: trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico adquirido, trastorno de la aversión sexual posmenopáusico adquirido, pérdida de deseo sexual posmenopáusica adquirida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica adquirida, disminución del deseo sexual posmenopáusico adquirida y deseo sexual inhibido posmenopáusico adquirido.

En una realización particularmente preferida la invención se refiere al uso de flibanserina, opcionalmente en forma de la base libre, a las sales de adición de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de hidratos y/o solvatos de la misma, para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos seleccionados del grupo de: trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico adquirida, pérdida de deseo sexual posmenopáusica adquirida y disminución del deseo sexual posmenopáusica adquirida.

Además la presente invención se refiere al subtipo generalizado o circunstancial de cualquiera de las afecciones mencionadas anteriormente y/o a las que son debidas a factores psicológicos o debidas a factores combinados.

La flibanserina se puede usar opcionalmente en forma de la base libre, en forma de sus sales de adición de ácido farmacéuticamente aceptables y/u opcionalmente en forma de los hidratos y/o los solvatos de la misma. Las sales de adición de ácido adecuadas incluyen, por ejemplo, las de los ácidos seleccionados de: ácido succínico, ácido bromhídrico, ácido acético, ácido fumárico, ácido maleico, ácido metansulfónico, ácido láctico, ácido fosfórico, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido tartárico y ácido cítrico. También se pueden usar mezclas de las sales de adición de ácido mencionadas. Entre las sales ácidas de adición mencionadas, son preferidas el hidrocloreuro y el hidrobromuro, particularmente el hidrocloreuro. Si se usa la flibanserina en forma de la base libre, se usa preferiblemente en forma de flibanserina polimórfica A, como se describe en la patente internacional WO 03/014079.

La flibanserina, opcionalmente usada en forma de la base libre, las sales de adición de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de los hidratos y/o los solvatos de la misma, se puede incorporar en la preparación farmacéutica convencional en forma sólida, líquida o en aerosol. La composición se puede presentar por ejemplo, en una forma adecuada para la administración oral, rectal, parenteral o para la inhalación nasal: las formas preferidas incluyen, por ejemplo, cápsulas, comprimidos, comprimidos recubiertos, ampollas, supositorios y aerosol nasal.

El ingrediente activo puede ser incorporado en excipientes o en portadores usados convencionalmente en composiciones farmacéuticas tales como, por ejemplo, talco, goma arábica, lactosa, gelatina, estearato de magnesio, almidón de maíz, vehículos acuosos o no acuosos, polivinilpirrolidona, glicéridos semisintéticos de ácidos grasos, cloruro de benzalconio, fosfato de sodio, AEDT, polisorbato 80. De forma ventajosa, las composiciones se formulan en unidades de administración, adaptándose cada unidad de administración para suministrar una única dosis del ingrediente activo. El intervalo de administración aplicable al día está entre 0,1 y 400, preferiblemente entre 1,0 y 300, más preferiblemente entre 2 y 200 mg. Cada unidad de dosis puede contener de forma conveniente entre 0,01 mg y 100 mg, preferiblemente entre 0,1 y 50 mg. Las formas farmacéuticas se administran al paciente 1, 2, 3 o 4 veces al día. Se prefiere administrar los compuestos de la invención bien tres o pocas veces, más preferiblemente una vez o dos veces al día consecutivamente durante un periodo de tiempo.

Preferiblemente, la dosis se administra a un paciente por la mañana y por la noche, más preferiblemente una vez por la mañana (25 o 50 mg de flibanserina) y una vez por la noche (25 o 50 mg de flibanserina), lo más preferiblemente una vez por la noche sólo (50 o 100 mg de flibanserina) consecutivamente durante un periodo de tiempo. A fin de mejorar la tolerancia durante un corto periodo puede administrarse la mitad de la dosis prescrita.

Como resultado los efectos secundarios tales como la sedación son de menor trascendencia.

Se pueden obtener comprimidos adecuados, por ejemplo, mezclando la(s) sustancia(s) activa(s) con excipientes conocidos, por ejemplo con diluyentes inertes tales como el carbonato cálcico, el fosfato cálcico o la lactosa, con disgregadores tales como el almidón de maíz o el ácido algínico, con aglutinantes tales como el almidón o

la gelatina, con lubricantes tales como el estearato de magnesio o el talco y/o con agentes para retardar la liberación, tales como la carboximetilcelulosa, el acetato-ftalato de celulosa o el poli(acetato de vinilo). Los comprimidos también pueden comprender varias capas.

- 5 Se pueden preparar comprimidos recubiertos de acuerdo con esto, recubriendo núcleos producidos de manera análoga a los comprimidos con sustancias normalmente usadas para recubrimientos de comprimidos, por ejemplo, colidona o goma laca, goma arábiga, talco, dióxido de titanio o azúcar. Para lograr una liberación retardada o para evitar incompatibilidades, el núcleo también puede consistir en una
- 10 serie de capas. De forma similar, el recubrimiento de los comprimidos puede consistir en una serie o capas para lograr una liberación retardada, usando posiblemente los excipientes mencionados anteriormente para los comprimidos.

- Los jarabes o elixires que contienen las sustancias activas o asociaciones de las mismas de acuerdo con la invención pueden contener adicionalmente un
- 15 edulcorante tal como la sacarina, el ciclamato, el glicerol o el azúcar y un potenciador del sabor, por ejemplo un aromatizante tal como la vainillina o el extracto de naranja. También pueden contener adyuvantes de suspensión o espesantes tales como la carboximetilcelulosa sódica, agentes humectantes tales como, por ejemplo, productos de condensación de alcoholes grasos con óxido de etileno o conservantes tales como
- 20 los *p*-hidroxibenzoatos.

Las disoluciones para inyección se preparan del modo habitual, por ej., mediante la adición de conservantes tales como los *p*-hidroxibenzoatos o estabilizantes tales como las sales de metales alcalinos del ácido etilendiamintetraacético y se transfieren al interior de viales de inyección o ampollas.

- 25 Se pueden preparar por ejemplo, cápsulas que contengan una o más sustancias activas o asociaciones de sustancias activas mezclando las sustancias activas con portadores inertes tales como lactosa o sorbitol y envasándolas en cápsulas de gelatina.

- Se pueden preparar supositorios adecuados por ejemplo, por mezcla con
- 30 portadores proporcionados para este propósito, tales como grasas neutras o polietilenglicol o los derivados de los mismos.

Los Ejemplos siguientes ilustran la presente invención sin restringir su alcance:

Ejemplos de formulaciones farmacéuticas

A)	<u>Comprimidos</u>	<u>por comprimido</u>
	flibanserina	100 mg
	lactosa	240 mg
5	almidón de maíz	340 mg
	polivinilpirrolidona	45 mg
	estearato de magnesio	15 mg
		740 mg

10

Se mezclan la sustancia activa, la lactosa y parte del almidón de maíz finamente molidos. La mezcla se tamiza, después se humedece con una solución de polivinilpirrolidona en agua, se amasa, se granula en húmedo y se seca. Los gránulos, el resto del almidón de maíz y el estearato de magnesio se tamizan y se mezclan. La mezcla se comprime para producir comprimidos de forma y tamaño adecuados.

B)	<u>Comprimidos</u>	<u>por comprimido</u>
	flibanserina	80 mg
20	almidón de maíz	190 mg
	lactosa	55 mg
	celulosa microcristalina	35 mg
	polivinilpirrolidona	15 mg
	almidón de carboximetilsodio	23 mg
25	estearato de magnesio	2 mg
		400 mg

Se mezclan la sustancia activa, parte del almidón de maíz, la lactosa, la celulosa microcristalina y la polivinilpirrolidona finamente molidos, la mezcla se tamiza y se trabaja con el resto del almidón de maíz y el agua formando un granulado que se deseca y se tamiza. Se añaden el almidón de carboximetilsodio y el estearato de magnesio y se mezclan y la mezcla se comprime para formar comprimidos de un tamaño adecuado.

35	C)	<u>Comprimidos recubiertos</u>	<u>por comprimido recubierto</u>
----	----	--------------------------------	----------------------------------

	flibanserina	5 mg
	almidón de maíz	41,5 mg
	lactosa	30 mg
5	polivinilpirrolidona	3 mg
	estearato de magnesio	<u>0,5 mg</u>
		80 mg

La sustancia activa, el almidón de maíz, la lactosa y la polivinilpirrolidona se
mezclan cuidadosamente y se humedecen con agua. Se hace pasar la masa húmeda
a través de un tamiz con un tamaño de malla de 1 mm, se seca a aproximadamente
45°C y a continuación se hacen pasar los gránulos a través del mismo tamiz. Una vez
se ha mezclado el estearato de magnesio, se comprimen los núcleos de comprimido
convexos con un diámetro de 6 mm en una máquina de fabricar comprimidos. Los
núcleos de comprimido producidos de este modo se recubren de un modo conocido
con un recubrimiento que consiste esencialmente en azúcar y talco. Los comprimidos
recubiertos acabados se barnizan con cera.

20	D)	<u>Cápsulas</u>	<u>por cápsula</u>
		flibanserina	150 mg
		Almidón de maíz	268,5 mg
		Estearato de magnesio	<u>1,5 mg</u>
			420 mg

La sustancia y el almidón de maíz se mezclan y se humedecen con agua. La
masa húmeda se tamiza y se seca. Los gránulos secos se tamizan y se mezclan con
estearato de magnesio. La mezcla acabada se envasa en cápsulas de gelatina dura
de tamaño 1.

30	E)	<u>Disolución de ampolla</u>	
		flibanserina	50 mg
		cloruro de sodio	50 mg
35		agua para iny.	5 ml

La sustancia activa se disuelve en agua a su propio pH u opcionalmente a pH 5,5 a 6,5 y se añade cloruro de sodio para hacerla isotónica. La solución obtenida se filtra para eliminar las sustancias pirógenas y el filtrado se transfiere en condiciones asépticas a ampollas que, después, se esterilizan y se sellan por fusión.

5

F) Supositorios

flibanserina	50 mg
grasa sólida	<u>1.650 mg</u>
	1700 mg

10

La grasa dura se funde. A 40°C la sustancia activa molida se dispersa homogéneamente. Se enfría a 38°C y se vierte en moldes de supositorio ligeramente enfriados.

15

REIVINDICACIONES

- 1) Uso de flibanserina, opcionalmente en forma de base libre, las sales de adición
de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de
5 hidratos y/o solvatos de la misma para la preparación de un medicamento para
el tratamiento de trastornos posmenopáusicos del deseo sexual (de por vida o
adquiridos) en mujeres.
- 2) Uso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque el trastorno del
10 deseo sexual posmenopáusico se selecciona del grupo que consiste en
trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico de por vida, trastorno
de la aversión sexual posmenopáusico de por vida, pérdida de deseo sexual
posmenopáusica de por vida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica de
por vida, deseo sexual disminuido posmenopáusico de por vida, deseo sexual
15 inhibido posmenopáusico de por vida, pérdida de la libido posmenopáusica de
por vida, trastorno de la libido posmenopáusico de por vida y frigidez
posmenopáusica de por vida.
- 3) Uso de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque el trastorno
20 del deseo sexual posmenopáusico se selecciona del grupo que consiste en
trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico de por vida, trastorno
de la aversión sexual posmenopáusico de por vida, pérdida de deseo sexual
posmenopáusica de por vida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica de
por vida, deseo sexual disminuido posmenopáusico de por vida, deseo sexual
25 inhibido posmenopáusico de por vida.
- 4) Uso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque el trastorno del
deseo sexual posmenopáusico se selecciona del grupo que consiste en
trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico adquirido, trastorno de
30 la aversión sexual posmenopáusico adquirido, pérdida de deseo sexual
posmenopáusica adquirida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica
adquirida, deseo sexual disminuido posmenopáusico adquirido, deseo sexual
inhibido posmenopáusico adquirido, pérdida de la libido posmenopáusica
adquirida, trastorno de la libido posmenopáusico adquirido y frigidez
35 posmenopáusica adquirida.

- 5) Uso de acuerdo con la reivindicación 1 o 4, caracterizado porque el trastorno del deseo sexual posmenopáusico se selecciona del grupo que consiste en trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico adquirido, trastorno de la aversión sexual posmenopáusico adquirido, pérdida de deseo sexual posmenopáusica adquirida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica adquirida, deseo sexual disminuido posmenopáusico adquirido y deseo sexual inhibido posmenopáusico adquirido.
- 5
- 10 6) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los trastornos del deseo sexual posmenopáusicos son del subtipo generalizado.
- 15 7) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los trastornos del deseo sexual posmenopáusicos son del subtipo circunstancial.
- 20 8) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los trastornos del deseo sexual posmenopáusicos son debidos a factores psicológicos.
- 25 9) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los trastornos del deseo sexual posmenopáusicos son debidos a factores combinados.
- 30 10) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la flibanserina se aplica en forma de una sal de adición de ácido farmacéuticamente aceptable seleccionada de las sales formadas por los ácidos seleccionados de ácido succínico, ácido bromhídrico, ácido acético, ácido fumárico, ácido maleico, ácido metansulfónico, ácido láctico, ácido fosfórico, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido tartárico, ácido cítrico y mezclas de los mismos.
- 35 11) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la flibanserina se aplica en forma de su base libre.

- 12) Uso de acuerdo con la reivindicación 11, caracterizado porque la flibanserina se aplica en forma de un polimórfico A de la base libre, con un punto de fusión de aproximadamente 161 °C, medido utilizando DSC.
- 5
- 13) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la flibanserina se aplica en un intervalo de dosis comprendido entre 0,1 y 400 mg al día.
- 10
- 14) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la flibanserina se aplica una vez o dos veces al día consecutivamente durante un periodo de tiempo.
- 15
- 15) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la flibanserina se aplica por la mañana y por la noche, más preferiblemente una vez por la mañana (25 o 50 mg de flibanserina) y una vez por la noche (25 o 50 mg de flibanserina).
- 20
- 16) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la flibanserina se aplica solamente una vez por la noche (50 o 100 mg de flibanserina) consecutivamente durante un periodo de tiempo.

Resumen

USO DE FLIBANSERINA PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS
POSMENOPÁUSICOS DEL DESEO SEXUAL

5

La invención se refiere al uso de flibanserina para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos posmenopáusicos del deseo sexual.

10

15

20

25

30

35 WPCL9255 / ID.137613

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2007/054380

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. A61K31/496 A61P15/12 A61P15/00		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) A61K A61P		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, EMBASE, BIOSIS		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2005/007166 A (PFIZER LTD [GB]; NAYLOR ALASDAIR MARK [GB]; VAN DER GRAAF PIETER HADEW) 27 January 2005 (2005-01-27)	1-16
Y	page 3, line 33 - page 4, line 12 page 7, lines 21-23 claims 1,9,10	1-16
Y	WO 03/035072 A (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA [DE]; EVANS KENNETH ROBERT [CA]; BORSINI F) 1 May 2003 (2003-05-01) claims	1-16
A	WO 2005/102343 A (BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA [US]; BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA [DE]; PY) 3 November 2005 (2005-11-03) claims	1-16
-/-		
☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents : *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art *G* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 3 April 2008		Date of mailing of the international search report 17/04/2008
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Herrera, Suzanne

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2007/054380

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	FOURCROY J L: "Female sexual dysfunction: Potential for pharmacotherapy" DRUGS, ADIS INTERNATIONAL LTD, AT, vol. 63, no. 14, 2003, pages 1445-1457, XP009050771 ISSN: 0012-6667 the whole document	1-16

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2007/054380

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2005007166 A	27-01-2005	BR PI0411985 A	29-08-2006
		CA 2532252 A1	27-01-2005
		EP 1653966 A1	10-05-2006
		JP 2007516949 T	28-06-2007
		MX PA06000623 A	11-04-2006
WO 03035072 A	01-05-2003	AT 327757 T	15-06-2006
		BR 0213358 A	26-10-2004
		CA 2458067 A1	01-05-2003
		CN 1571670 A	26-01-2005
		DE 60211937 T2	28-12-2006
		DK 1446122 T3	03-07-2006
		ES 2266632 T3	01-03-2007
		HR 20040352 A2	28-02-2005
		HU 0401023 A2	30-08-2004
		JP 2005506370 T	03-03-2005
		JP 2007131631 A	31-05-2007
		MX PA04003666 A	22-07-2004
		NO 20041588 A	19-04-2004
		NZ 532079 A	30-03-2007
		PL 367358 A1	21-02-2005
		PT 1446122 T	31-08-2006
		UA 78974 C2	10-05-2007
		YU 30004 A	17-08-2006
		ZA 200401366 A	25-11-2004
WO 2005102343 A	03-11-2005	AR 048833 A1	31-05-2006
		AU 2005235423 A1	03-11-2005
		BR PI0510094 A	16-10-2007
		CA 2563167 A1	03-11-2005
		CN 1946403 A	11-04-2007
		EP 1740180 A1	10-01-2007
		JP 2007533687 T	22-11-2007
		KR 20070014186 A	31-01-2007
		US 2005239798 A1	27-10-2005
		UY 28860 A1	30-11-2005

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT	
(21) N° de solicitud: 22) Fecha de solicitud: (30) Prioridad (31) Prioridad (32) Fecha (33) País 60/746,817 09/05/2006 US 60/830,987 14/07/2006 US		(51) Int Cl: A61K 031/496 (71) Solicitante(s) BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH (72) Inventor(es) STEPHANE POLLENTIER ROBERT PYKE (74) Apoderado: EMILIO FERRERO	
(85) Fecha limite inicio fase nacional: 09/12/2008 (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 07/05/2007 No. de solicitud PCT/EP2007/054380		(87) Publicación internacional Fecha: 15/11/2007 N° publicación: WO 2007/128802 A3	
(54) Título: USO DE FLIBANSERINA PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS POSMENOPÁUSICOS DEL DESEO SEXUAL			

Reivindicación(es):

- 1) Uso de flibanserina, opcionalmente en forma de base libre, las sales de adición de ácido farmacológicamente aceptables y/u opcionalmente en forma de hidratos y/o solvatos de la misma para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trastornos posmenopáusicos del deseo sexual (de por vida o adquiridos) en mujeres.
- 2) Uso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque el trastorno del deseo sexual posmenopáusico se selecciona del grupo que consiste en trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico de por vida, trastorno de la aversión sexual posmenopáusico de por vida, pérdida de deseo sexual posmenopáusica de por vida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica de por vida, deseo sexual disminuido posmenopáusico de por vida, deseo sexual inhibido posmenopáusico de por vida, pérdida de la libido posmenopáusica de por vida, trastorno de la libido posmenopáusico de por vida y frigidez posmenopáusica de por vida.
- 3) Uso de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque el trastorno del deseo sexual posmenopáusico se selecciona del grupo que consiste en trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico de por vida, trastorno de la aversión sexual posmenopáusico de por vida, pérdida de deseo sexual posmenopáusica de por vida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica de por vida, deseo sexual disminuido posmenopáusico de por vida, deseo sexual inhibido posmenopáusico de por vida.
- 4) Uso de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque el trastorno del deseo sexual posmenopáusico se selecciona del grupo que consiste en trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico adquirido, trastorno de la aversión sexual posmenopáusico adquirido, pérdida de deseo sexual posmenopáusica adquirida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica adquirida, deseo sexual disminuido posmenopáusico adquirido, deseo sexual inhibido posmenopáusico adquirido, pérdida de la libido posmenopáusica adquirida, trastorno de la libido posmenopáusico adquirido y frigidez posmenopáusica adquirida.

- 5) Uso de acuerdo con la reivindicación 1 o 4, caracterizado porque el trastorno del deseo sexual posmenopáusico se selecciona del grupo que consiste en trastorno del deseo sexual hipoactivo posmenopáusico adquirido, trastorno de la aversión sexual posmenopáusico adquirido, pérdida de deseo sexual posmenopáusica adquirida, ausencia de deseo sexual posmenopáusica adquirida, deseo sexual disminuido posmenopáusico adquirido y deseo sexual inhibido posmenopáusico adquirido.
- 6) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los trastornos del deseo sexual posmenopáusicos son del subtipo generalizado.
- 7) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los trastornos del deseo sexual posmenopáusicos son del subtipo circunstancial.
- 8) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los trastornos del deseo sexual posmenopáusicos son debidos a factores psicológicos.
- 9) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque los trastornos del deseo sexual posmenopáusicos son debidos a factores combinados.
- 10) Uso de acuerdo con una o más de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque la flibanserina se aplica en forma de una sal de adición de ácido farmacéuticamente aceptable seleccionada de las sales formadas por los ácidos seleccionados de ácido succínico, ácido bromhídrico, ácido acético, ácido fumárico, ácido maleico, ácido metansulfónico, ácido láctico, ácido fosfórico, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido tartárico, ácido cítrico y mezclas de los mismos.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-117760-00000-0000

Fecha: 2008-11-05 11:23:17 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTE IYII Eva: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 41

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 85,033
FECHA : OCTUBRE 28 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	92992200	27/10/2008	38,955,000.00

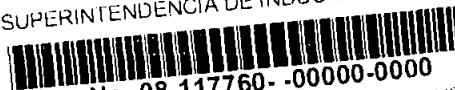
***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	501,000.00
		TOTAL :	\$ 501,000.00

SON: QUINIENTOS UN MIL PESOS

RESPONSABLE :

Cdo 09255-841-013-J.



No. 08-117760-00000-0000

Fecha: 2008-11-05 11:23:17
Tra. 11 PATENTEIYII
Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 NUECREACIONI
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 41

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

**REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT**

PATENTE DE INVENCION []

MODELO DE UTILIDAD []

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de una patente [X]
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [X]
- ◆ Descripción de la invención [X]
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes [X]
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas [X]

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica del esquema trazado []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

Sandra E. Echeverri
Firma Responsable

Fecha 05 NOV 05 08

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax: 350 52 20
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

43

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH

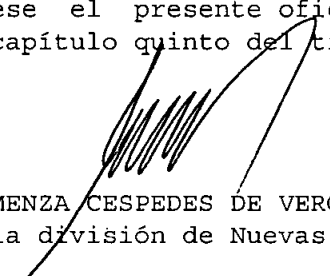
REFERENCIA	Radicación No.	8 117760
	Solicitud internacional	PCT/2007/054380
	Fecha inicio fase nacional	09/12/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	16072

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.


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

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 19 DIC. 2008
adpall