

LLOREDA & CIA. S. A.

ABOGADOS

BOGOTA - COLOMBIA
OFICINA FUNDADA EN 1941
CARTADO AEREO 12304

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-058653- -00003-0000

Fecha: 2009-08-28 16:55:02 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 14

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y CO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: PI.-F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "POLIMORFOS DE UN ANTAGONISTA DEL RECEPTOR MGLUR5".-Clase CO7D 401/06.-Expediente número 09-058.653.-

1. Me refiero al Oficio No. **9641** dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista de 21 de Agosto de 2009.
2. En respuesta a su comunicación arriba referida y estando dentro del término establecido para ello, atentamente me permito allegar el recibo de pago de la tasa establecida para las reivindicaciones adicionales de la solicitud arriba mencionada.

Me permito aclarar que dicho pago corresponde a las reivindicaciones 16 a 27, las cuales deberán ser estudiadas junto con la presente solicitud.

3. Anexo me permito presentar:

- (a) Recibos números 09-55.391, 09-55.392, 09-55.393, 09-55.394, 09-55.381, 09-60.885 y 09-54.670 que acredita el pago de la tasa mencionada; y
- (b) Copia del capítulo reivindicatorio que debe tenerse en cuenta para estudio compuesto por 27 reivindicaciones.

4. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,

ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 55,391
FECHA : JULIO 28 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-058653- -00003-0000

Fecha: 2009-08-28 16:55:02 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 14

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLORERA Y CIA S. A	DEVOLUCION TASA			836	28/07/2009	501,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	1,000.00
		TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 55,392
FECHA : JULIO 28 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-058653- -00003-0000

Fecha: 2009-08-28 16:55:02 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 14

**** CONSIGNACION ****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	DEVOLUCION TASA			836	28/07/2009	501,000.00

**** CONCEPTO ****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVCIOS ADMINISTRATIVOS
			1,000.00
		TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 55,393
FECHA : JULIO 28 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-058653- -00003-0000

Fecha: 2009-08-28 16:55:02 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 14

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	DEVOLUCION TASA			836	28/07/2009	501,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVCIOS ADMINISTRATIVOS
			1,000.00
		TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

120

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 55,394
FECHA : JULIO 28 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-058653- -00003-0000

Fecha: 2009-08-28 16:55:02 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 14

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLORERA Y CIA S. A	DEVOLUCION TASA			836	28/07/2009	501,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	1,000.00
		TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

123



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 55,381
FECHA : JULIO 28 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-058653- -00003-0000

Fecha: 2009-08-28 16:55:02 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 14

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLORERA Y CIA S. A	DEVOLUCION TASA			836	28/07/2009	501,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS
			5,000.00
		TOTAL :	\$ 5,000.00

SON: CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

122



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 60,885
FECHA : AGOSTO 18 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-058653- -00003-0000

Fecha: 2009-08-28 16:55:02

Dep. 2020 NUECREACIONE

Tra. 11 PATENTEIYII

Eve: 379 FASENACIONALII

Act. 444 RESPUESTAREQUE

Folios: 14

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOBOTA	062754387	79464103	18/08/2009	23,445,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		B2 INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EN NU	151,000.00
		TOTAL :	\$ 151,000.00

SON: CIENTO CINCUENTA Y UNO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

123

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 54,670
FECHA : JULIO 27 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-058653- -00003-0000

Fecha: 2009-08-28 16:55:02 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 14

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
LLÓREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTÁ	062754387	98913430	27/07/2009	15,611,040.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	998 VALOR COMPLEMENTO TARIFA A#0 ANTR
		TOTAL :	\$ 140,000.00

SON: CIENTO CUARENTA MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

12h

REIVINDICACIONES

1. Una sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina.

2. Una sal hemi-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina.

3. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina caracterizada por lo menos por tres picos elegidos entre los siguientes picos de difracción de rayos X obtenidos con una radiación $\text{Cu}_{K\alpha}$ a 2θ (2-theta (grados)) = 9,8, 13,4, 14,2, 18,1, 18,9, 19,6, 22,6, 22,9, 25,7, 27,1 y 29,9 ($\pm 0,2^\circ$ 2-theta).

4. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina caracterizada por los siguientes picos de difracción de rayos X obtenidos con una radiación $\text{Cu}_{K\alpha}$ a 2θ (2-theta (grados)) = 9,8, 13,4, 14,2, 18,1, 18,9, 19,6, 22,6, 22,9, 25,7, 27,1 y 29,9 ($\pm 0,2^\circ$ 2-theta).

5. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina caracterizada por el modelo de difracción de rayos X del material en polvo representado en la figura 1.

6. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina según una cualquiera de las reivindicaciones 1 o de 3 a 5 caracterizada por un espectro infrarrojo que tiene bandas acusadas a 3068, 2730, 2618, 2236, 2213, 1628, 1587,

1569, 1518, 1384, 1374, 1295, 1236, 1168, 1157, 1116, 1064, 1019, 902, 855, 786 y 674 cm^{-1} ($\pm 3\text{ cm}^{-1}$).

7. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina según una cualquiera de las reivindicaciones 1 o de 3 a 6 caracterizada por un espectro infrarrojo representado en la figura 2.

8. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina caracterizada por lo menos por tres picos elegidos entre los siguientes picos de difracción de rayos X obtenidos con una radiación $\text{Cu}_{K\alpha}$ a 2θ (2-theta (grados)) = 8,9, 10,2, 14,3, 14,7, 15,4, 17,1, 18,8, 19,5, 20,9, 22,5 y 23,8 ($\pm 0,2^\circ$ theta).

9. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina caracterizada por los siguientes picos de difracción de rayos X obtenidos con una radiación $\text{Cu}_{K\alpha}$ a 2θ (2-theta (grados)) = 8,9, 10,2, 14,3, 14,7, 15,4, 17,1, 18,8, 19,5, 20,9, 22,5 y 23,8 ($\pm 0,2^\circ$ 2-theta).

10. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-caracterizada por un modelo de difracción de rayos X del material en polvo representado en la figura 4.

11. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina según una cualquiera de las reivindicaciones 1 o de 8 a 10 caracterizada por un espectro infrarrojo que

tiene bandas acusadas a 3122, 3039, 3003, 2923, 2853, 2719, 2608, 2231, 1622, 1585, 1565, 1515, 1439, 1373, 1346, 1224, 1158, 1116, 1082, 1047, 1015, 987, 901, 787 y 673 ($\pm 3 \text{ cm}^{-1}$).

12. Una forma cristalina de la sal mono-sulfato de la
5 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina según una cualquiera de las reivindicaciones 1 o de 8 a 11 caracterizada por un espectro infrarrojo representado en la figura 5.

13. Una forma cristalina de la sal hemi-sulfato de la
10 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina caracterizada por lo menos por tres picos elegidos entre los siguientes picos de difracción de rayos X obtenidos con una radiación $\text{Cu}_{K\alpha}$ a 2θ (2-theta (grados)) = 7,4, 8,9, 11,0, 11,8, 12,8, 15,8, 17,3, 18,1, 19,8, 25,0 y
15 26,2 ($\pm 0,2^\circ$ 2-theta).

14. Una forma cristalina de la sal hemi-sulfato de la
2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina caracterizada por los siguientes picos de difracción de rayos X obtenidos con una radiación $\text{Cu}_{K\alpha}$ a 2θ (2-
20 theta (grados)) = 7,4, 8,9, 11,0, 11,8, 12,8, 15,8, 17,3, 18,1, 19,8, 25,0 y 26,2 ($\pm 0,2^\circ$ 2-theta).

15. Una forma cristalina de la sal hemi-sulfato de la
2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-caracterizada por un modelo de difracción de rayos X del
25 material en polvo representado en la figura 7.

16. Una forma cristalina de la sal hemi-sulfato de la
2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina según una cualquiera de las reivindicaciones 2

o de 13 a 15 caracterizada por un espectro infrarrojo que tiene bandas acusadas a 3364, 3075, 2717, 2577, 2234, 2208, 1568, 1632, 1585, 1567, 1514, 1468, 1413, 1372, 1222, 1159, 1084, 1038, 986, 902, 846, 788 712, 668 y 620 ($\pm 3 \text{ cm}^{-1}$).

5 17. Una forma cristalina de la sal hemi-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina según una cualquiera de las reivindicaciones 1 o de 13 a 16 caracterizada por un espectro infrarrojo representado en la figura 8.

10 18. Una forma amorfa de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina caracterizada por la ausencia de picos agudos de rayos X en su modelo XRPD y/o en su espectro infrarrojo, que tiene bandas acusadas en 2730, 2592, 2219, 1633, 1586,
15 1570, 1513, 1375, 1226, 1157, 1130, 1115, 1084, 1040, 986, 903, 848, 788, 712 y 670 cm^{-1} ($\pm 3 \text{ cm}^{-1}$).

 19. Una forma amorfa de la sal mono-sulfato de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina caracterizada por un espectro infrarrojo representado en la figura 11.

20 20. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que por lo menos un 70% es de un polimorfo cristalino según una cualquiera de las reivindicaciones de 1 a 12.

 21. Un compuesto según la reivindicación 2, en el que
25 por lo menos un 70% es de un polimorfo cristalino según una cualquiera de las reivindicaciones de 13 a 17.

 22. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que por lo menos un 70% es de un material amorfo según la reivin-

dicación 18 ó 19.

23. Una composición farmacéutica que contiene una sal según la reivindicación 1 ó 2 o una forma cristalina según una cualquiera de las reivindicaciones de 3 a 17 o una forma amorfa según la reivindicación 18 ó 19 y uno o más vehículos farmacéuticamente aceptables.

24. Un proceso para la obtención de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 3 a 7, que consiste en los pasos de:

10 (a) formación de la sal de la 2-cloro-4-[1-(4-fluor-fenil)-2,5-dimetil-1H-imidazol-4-iletinil]-piridina con ácido sulfúrico en 2-propanol y posterior precipitación espontánea o

(b) recristalización del producto del paso (a) en ACN, 15 ACN/agua, metanol, etanol, IPA, ácido acético, 1-octanol, o IPA/ácido sulfúrico del 49 % (10:1, v/v).

25. Un proceso para la obtención de un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones de 8 a 12, que consiste en:

20 (a) equilibrado en disolvente del compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones de 3 a 7 en IPA/agua (3:1 v/v), o

(b) recristalización del compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones de 3 a 7 en IPA/agua (p.ej. 3:1 v/v), o

25 (c) digestión del compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones de 3 a 7 en ácido sulfúrico acuoso.

26. Un proceso para la obtención de un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones de 13 a 17, que consiste

124

en:

(a) equilibrado en disolvente del compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones de 3 a 7 en agua, o

(b) recristalización o digestión del compuesto de una
5 cualquiera de las reivindicaciones de 3 a 7 en agua, agua/metanol (p.ej. 4:1, v/v), agua/etanol (p.ej. 4:1, v/v), o agua/2-propanol (p.ej. 3:1, v/v).

27. Un proceso para la obtención de un compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 18 ó 19, que consiste en
10 disolver el compuesto de la reivindicación 1 en metanol y evaporar rápidamente el disolvente en torno a 65°C con vacío.

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 131

2020

Bogotá D.C.,

Doctor(a)

LLOREDA RICAURTE ALICIA

Apoderado(a) y/o Representante de

F.HOFFMANN-LA ROCHE AG

REFERENCIA	Radicación No.	9 58653
	Solicitud internacional	PCT/EP2007/063721
	Fecha inicio fase nacional	21/07/2009
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	10857
	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,

26 JUL. 2010

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

Jefe de la división de Nuevas Creaciones

jfernand