

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
19 février 2004 (19.02.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2004/014360 A3

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
A61K 31/565, A61P 13/00

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/002471

(22) Date de dépôt international : 6 août 2003 (06.08.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02 10058 7 août 2002 (07.08.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : **R & D PHARMA** [MC/MC]; SAM, 7 Boulevard des Moulins, 98000 MONACO (MC).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) :
ROUGAIGNON, Caroline [MC/MC]; 11 boulevard du Jardin Exotique, 98000 MONACO (MC). **LANQUETIN, Michel** [FR/FR]; 180 Chemin Soanes, F-06340 LA TRINITE-LAGHET (FR).

(74) Mandataire : **BURTIN, Jean-François**; GEFIB, 55 rue Aristide Briand, F-92309 CEDEX LEVALLOIS-PERRET (FR).

(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont requises

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 8 avril 2004

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) Title: PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS FOR THE TREATMENT OF URINARY INCONTINENCE

(54) Titre : COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES DESTINEES AU TRAITEMENT DE L'INCONTINENCE URINAIRE

(57) Abstract: The invention relates to the field of therapeutic chemistry and, in particular, the field of pharmaceutical technology. More specifically, the invention relates to novel pharmaceutical compositions for the local treatment of urinary incontinence using a muscrotropic and cholinergic substance which may or may not be associated with a poorly-absorbed oestrogen agent. The invention is characterised in that the muscrotropic and cholinergic substance is oxybutynin or one of the salts thereof and in that the poorly-absorbed oestrogen agent is selected from estriol, 16-epiestriol or estradiol in free, esterified and/or etherified form. The invention is further characterised in that the composition is administered in one of the suitable forms thereof either vaginally or rectally for women and rectally for men, the form administered to men being devoid of oestrogen. The invention also relates to the vaginal or rectal use of said pharmaceutical compositions.

(57) Abrégé : L'invention se rapporte au domaine de la chimie thérapeutique et en particulier au domaine de la pharmacotechnie. Elle concerne de nouvelles compositions pharmaceutiques destinées au traitement de l'incontinence urinaire par substance cholinergique et muscrotrope, associée ou non à un agent estrogène peu résorbé, par voie locale caractérisée en ce que la substance cholinergique et muscrotrope est l'oxybutynine, ou un de ses sels, et que l'agent estrogène peu résorbé est choisi parmi l'estriol, le 16-épiestriol ou l'estradiol sous forme libre, estérifiée et/ou étherifiée. L'invention se caractérise, en outre, par le fait que l'administration s'effectue sous une des formes appropriées pour la voie vaginale ou la voie rectale pour la femme et la voie rectale chez l'homme, la forme administrée à l'homme étant dénuée d'estrogène. Utilisation de ces compositions pharmaceutiques par voie vaginale ou par voie rectale.

WO 2004/014360 A3

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/FR 03/02471A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 A61K31/565 A61P13/00

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)

IPC 7 A61K

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, PAJ, WPI Data, BIOSIS, EMBASE, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 98 11888 A (AMERICAN HOME PROD) 26 March 1998 (1998-03-26) page 3, line 35 -page 4, line 4; example 2 ---	1,2,5,21
X	US 6 262 115 B1 (G.V.GUITTARD E.A.) 17 July 2001 (2001-07-17) cited in the application claims 1,2,8,9,13,26,27,29 column 7, line 31 -column 8, line 25 example 21 ----- -/--	1

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in 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.

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

22 January 2004

Date of mailing of the international search report

30/01/2004

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

Stienon, P

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/FR 03/02471

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	Y.OZGOK E.A.: "The effect of combination of estradiol benzoate and oxybutynin in rat isolated detrusor muscle" EUROPEAN UROLOGY, vol. 38, no. 4, 2000, pages 526-527, XP008015611 page 526, column 2 page 526, column 1 ---	1
X	M.M.KARRAM, N.N.BHATIA: "management of coexistent stress and urge urinary incontinence" OBSTETRICS AND GYNECOLOGY, vol. 73, no. 1, 1989, pages 4-7, XP008015777 page 4, column 1 page 5, column 1 ---	1
X	WO 01 70154 A (FEI TECHNOLOGIES INC) 27 September 2001 (2001-09-27) claim 1 -----	1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/FR 03/02471

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9811888	A	26-03-1998	AU 4421697 A	14-04-1998
			CA 2266070 A1	26-03-1998
			EP 0927034 A1	07-07-1999
			JP 2001502302 T	20-02-2001
			WO 9811888 A1	26-03-1998
			ZA 9708427 A	18-06-1999
US 6262115	B1	17-07-2001	US 5912268 A	15-06-1999
			US 5840754 A	24-11-1998
			US 5674895 A	07-10-1997
			US 2001005728 A1	28-06-2001
			ES 2141044 A1	01-03-2000
			US 6124355 A	26-09-2000
			AU 695194 B2	06-08-1998
			AU 5639296 A	11-12-1996
			AU 718849 B2	20-04-2000
			AU 9052298 A	14-01-1999
			BE 1009462 A3	01-04-1997
			CA 2218714 A1	28-11-1996
			CH 690955 A5	15-03-2001
			DE 19681389 T0	23-04-1998
			FR 2734483 A1	29-11-1996
			GB 2318055 A ,B	15-04-1998
			IT T0960427 A1	21-11-1997
			JP 11505264 T	18-05-1999
			NL 1003185 C2	03-12-1996
			NL 1003185 A1	25-11-1996
			NZ 307116 A	29-03-1999
			WO 9637202 A1	28-11-1996
WO 0170154	A	27-09-2001	US 6436428 B1	20-08-2002
			AU 4590101 A	03-10-2001
			BR 0109691 A	10-06-2003
			CA 2403475 A1	27-09-2001
			EP 1278494 A1	29-01-2003
			JP 2003527404 T	16-09-2003
			WO 0170154 A1	27-09-2001
			US 2002090390 A1	11-07-2002

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande Internationale No

PCT/FR 03/02471

A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE
CIB 7 A61K31/565 A61P13/00

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement)

CIB 7 A61K

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si réalisable, termes de recherche utilisés)

EPO-Internal, PAJ, WPI Data, BIOSIS, EMBASE, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie *	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
X	WO 98 11888 A (AMERICAN HOME PROD) 26 mars 1998 (1998-03-26) page 3, ligne 35 -page 4, ligne 4; exemple 2 ---	1,2,5,21
X	US 6 262 115 B1 (G.V.GUITTARD E.A.) 17 juillet 2001 (2001-07-17) cité dans la demande revendications 1,2,8,9,13,26,27,29 colonne 7, ligne 31 -colonne 8, ligne 25 exemple 21 --- -/--	1



Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents



Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe

* Catégories spéciales de documents cités:

- *A* document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent
- *E* document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date
- *L* document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)
- *O* document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens
- *P* document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée

- *T* document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention
- *X* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément
- *Y* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier
- *Z* document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée

22 janvier 2004

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

30/01/2004

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale

Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

Stienon, P

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande Internationale No

PCT/FR 03/02471

C.(suite) DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS		
Catégorie *	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
X	Y.OZGOK E.A.: "The effect of combination of estradiol benzoate and oxybutynin in rat isolated detrusor muscle" EUROPEAN UROLOGY, vol. 38, no. 4, 2000, pages 526-527, XP008015611 page 526, colonne 2 page 526, colonne 1 ---	1
X	M.M.KARRAM, N.N.BHATIA: "management of coexistent stress and urge urinary incontinence" OBSTETRICS AND GYNECOLOGY, vol. 73, no. 1, 1989, pages 4-7, XP008015777 page 4, colonne 1 page 5, colonne 1 ---	1
X	WO 01 70154 A (FEI TECHNOLOGIES INC) 27 septembre 2001 (2001-09-27) revendication 1 -----	1

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande Internationale No

PCT/FR 03/02471

Document brevet cité au rapport de recherche		Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
WO 9811888	A	26-03-1998	AU 4421697 A	14-04-1998
			CA 2266070 A1	26-03-1998
			EP 0927034 A1	07-07-1999
			JP 2001502302 T	20-02-2001
			WO 9811888 A1	26-03-1998
			ZA 9708427 A	18-06-1999
US 6262115	B1	17-07-2001	US 5912268 A	15-06-1999
			US 5840754 A	24-11-1998
			US 5674895 A	07-10-1997
			US 2001005728 A1	28-06-2001
			ES 2141044 A1	01-03-2000
			US 6124355 A	26-09-2000
			AU 695194 B2	06-08-1998
			AU 5639296 A	11-12-1996
			AU 718849 B2	20-04-2000
			AU 9052298 A	14-01-1999
			BE 1009462 A3	01-04-1997
			CA 2218714 A1	28-11-1996
			CH 690955 A5	15-03-2001
			DE 19681389 T0	23-04-1998
			FR 2734483 A1	29-11-1996
			GB 2318055 A ,B	15-04-1998
			IT T0960427 A1	21-11-1997
			JP 11505264 T	18-05-1999
			NL 1003185 C2	03-12-1996
			NL 1003185 A1	25-11-1996
			NZ 307116 A	29-03-1999
			WO 9637202 A1	28-11-1996
WO 0170154	A	27-09-2001	US 6436428 B1	20-08-2002
			AU 4590101 A	03-10-2001
			BR 0109691 A	10-06-2003
			CA 2403475 A1	27-09-2001
			EP 1278494 A1	29-01-2003
			JP 2003527404 T	16-09-2003
			WO 0170154 A1	27-09-2001
			US 2002090390 A1	11-07-2002