

(12) SOLICITUD INTERNACIONAL PUBLICADA EN VIRTUD DEL TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES (PCT)

(19) Organización Mundial de la Propiedad
Intelectual
Oficina internacional



(10) Número de Publicación Internacional
WO 2011/074931 A3

(43) Fecha de publicación internacional
23 de junio de 2011 (23.06.2011)

PCT

(51) Clasificación Internacional de Patentes:

A61K 31/565 (2006.01) A61P 5/30 (2006.01)
A61K 31/57 (2006.01) A61P 5/34 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)

Heriberto Frías No. 1035, Col. del Valle, C.P. 03100 México D.F. (MX).

(21) Número de la solicitud internacional:

PCT/MX2010/000154

(22) Fecha de presentación internacional:

14 de diciembre de 2010 (14.12.2010)

(25) Idioma de presentación:

español

(26) Idioma de publicación:

español

(30) Datos relativos a la prioridad:

MX/a/2009/013768

15 de diciembre de 2009 (15.12.2009)

MX

(71) Solicitante (para todos los Estados designados salvo US): **TECHSPHERE, S.A. DE C.V.** [MX/MX]; Heriberto Frías No. 1035, Col. del Valle, C.P. 03100 México D.F. (MX).

(74) Mandatario: **SUÁREZ GARCÍA, Rodrigo**; Avenida Las Flores No. 30, Col. Tlacopac, San Ángel, C.P. 01049, México, D.F. (MX).

(81) Estados designados (a menos que se indique otra cosa, para toda clase de protección nacional admisible): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, 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, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Estados designados (a menos que se indique otra cosa, para toda clase de protección regional admisible): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europea (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT,

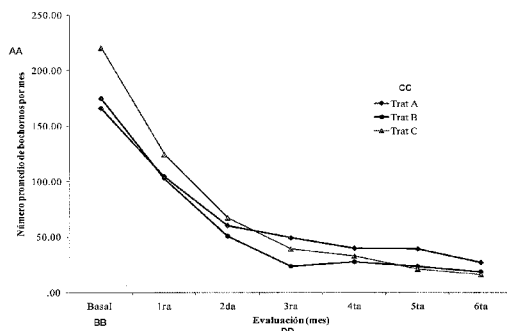
(72) Inventores; e

(75) Inventores/Solicitantes (para US solamente): **ÁNGELES URIBE, Juan** [MX/MX]; Heriberto Frías No. 1035, Col. del Valle, C.P. 03100 México D.F. (MX). **SAVOIR VILBOEUF, John Claude** [MX/MX];

[Continúa en la página siguiente]

(54) Title: PARENTERAL PHARMACEUTICAL FORMULATION IN SUSPENSION, HAVING SUSTAINED RELEASE, IN LOW AND ULTRALOW DOSAGE, IN HORMONAL THERAPY IN THE CLIMACTERIC SYNDROME

(54) Título : FORMULACIÓN FARMACÉUTICA PARENTERAL EN SUSPENSIÓN, DE LIBERACIÓN SOSTENIDA, EN DOSIS BAJA Y ULTRA BAJA, EN TERAPIA HORMONAL EN EL SÍNDROME CLIMATÉRICO



A= 0.5 mg E2 + 15 mg P4
B= 1.0 mg E2 + 20 mg P4
C= 1.0 mg E2 + 30 mg P4

FIGURA 1

AA Average number of hot flashes per month
BB Basal
CC Treatment
1ra 1st
2da 2nd
3ra 3rd
4ta 4th
5ta 5th
6ta 6th
DD Evaluation (month)

(57) Abstract: Parenteral pharmaceutical formulation or composition, in suspension, having sustained release, containing suspended particles of estradiol and progesterone for hormonal replacement in female mammals in low and ultralow dosage; the formulation consists of an injectable suspension comprising particles of estradiol, particles of progesterone, a surfactant agent, an isosmotic agent, a thickening agent, and one or more preservation agents, wherein the estradiol is in particles having a size between 1 and 100 microns and the progesterone is in particles having a size between 1 and 100 microns, for application thereof in parenteral, intramuscular, subcutaneous or intradermal pharmaceutical form.

(57) Resumen: Una formulación o composición farmacéutica parenteral, en suspensión, de liberación sostenida, conteniendo partículas suspendidas de estradiol y progesterona para el reemplazo hormonal en mamíferos hembras en dosis baja y ultra baja, la formulación consiste en una suspensión inyectable compuesta por partículas de estradiol, partículas de progesterona, un agente tensoactivo, un agente isosmótico, un agente viscosante, y uno o más conservadores, en donde el estradiol se encuentra en partículas con un tamaño entre 1 y 100 micras y la progesterona se encuentra en partículas con un tamaño entre 1 y 100 micras para su aplicación en la forma farmacéutica parenteral, intramuscular, subcutánea o intradérmica.

WO 2011/074931 A3



RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(88) Fecha de publicación del informe de búsqueda internacional:

22 de septiembre de 2011

Publicada:

- con informe de búsqueda internacional (Art. 21(3))
- antes de la expiración del plazo para modificar las reivindicaciones y para ser republicada si se reciben modificaciones (Regla 48.2(h))

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/MX2010/000154

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

See extra sheet

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 practicable, search terms used)

EPODOC, INVENES, WPI, TATE, TATF, MEDLINE, BIOSIS, NPL, EMBASE

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2004/110408 A2 (SAVOIR, JOHN CLAUDE) 23.12.2004, Paragraphs 22, 31-32, 66-69, 71 and 80-82, and claims 34, 37, 40, 46 and 48.	1-6, 9-12
A	US 6287693 B1 (JOHN CLAUDE SAVOIR) 11.09.2001, Abstract and columns 1, 4-5, 8 and example 9.	1-15
A	US 6077531 A (LABORATOIRES BESINS ISCOVESCO) 20.06.2000, Abstract and columns 1 and 2.	1-15

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

<p>* Special categories of cited documents:</p> <p>"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance.</p> <p>"E" earlier document but published on or after the international filing date</p> <p>"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)</p> <p>"O" document referring to an oral disclosure use, exhibition, or other means.</p> <p>"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed</p>	<p>"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</p> <p>"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</p> <p>"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 documents, such combination being obvious to a person skilled in the art</p> <p>"&" document member of the same patent family</p>
--	--

Date of the actual completion of the international search
31/05/2011

Date of mailing of the international search report
(13/07/2011)

Name and mailing address of the ISA/

OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS
Paseo de la Castellana, 75 - 28071 Madrid (España)
Facsimile No.: 91 349 53 04

Authorized officer
M. García Bueno

Telephone No. 91 3497000

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

Information on patent family members

PCT/MX2010/000154

Patent document cited in the search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO2004110408 A	23.12.2004	CA2528545 A	23.12.2004
		AU2004246870 A	23.12.2004
		AU2004246870 B	23.07.2009
		US2005025827 A	03.02.2005
		US7589082 B	15.09.2009
		NO20060200 A	13.01.2006
		EP1663161 A	07.06.2006
		EP20040736545	10.06.2004
		BRPI0411335 A	25.07.2006
		CN1835737 A	20.09.2006
		CN100594907 C	24.03.2010
		JP2006527263 T	30.11.2006
		OA13307 A	13.04.2007
		EP1820494 AB	22.08.2007
		EP20070008942	10.06.2004
		EP1844765 A	17.10.2007
		EP20070008938	10.06.2004
		MX2008014654 A	09.03.2009
		US2009081303 A	26.03.2009
		EA200900451 A	30.12.2009
		EA012783 B	30.12.2009
		AT454885 T	15.01.2010
		PT1820494 E	14.04.2010
		DK1820494 T	25.05.2010
		ES2340422 T	02.06.2010
		HK1106717 A	11.06.2010
		SI1820494 T	31.08.2010
CN101816662 A	01.09.2010		
HK1097735 A	12.11.2010		
US6287693 B	11.09.2001	ZA9901058 A	11.08.1999
		WO9943304 A	02.09.1999
		CA2319176 AC	02.09.1999
		AU2293699 A	15.09.1999
		NO20004241 A	24.08.2000
		BR9908156 A	31.10.2000
		CZ20003047 A	15.11.2000
		CZ301042 B	21.10.2009
		TR200002462 T	21.11.2000
		EP1056444 AB	06.12.2000
		EP19990902729	10.02.1999
		UA73470 C	15.12.2000
		ID26523 A	11.01.2001
		CN1291887 A	18.04.2001
		CN1146407 C	21.04.2004
		PL343170 A	30.07.2001
		PL196369 B	31.12.2007
		HU0101271 A	28.09.2001
		JP2002504507 T	12.02.2002
		EE200000492 A	15.02.2002

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/MX2010/000154

Information on patent family members

Patent document cited in the search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
		EE05019 B	16.06.2008
		AU747779 B	23.05.2002
		US2002168395 A	14.11.2002
		US6663895 B	16.12.2003
		US6528094 B	04.03.2003
		US6537580 B	25.03.2003
		NZ505987 A	25.07.2003
		US2003147964 A	07.08.2003
		US6638536 B	28.10.2003
		US2003191101 A	09.10.2003
		US6737081 B	18.05.2004
		RU2225708 C	20.03.2004
		US2004166164 A	26.08.2004
		US7427413 B	23.09.2008
		CN1524608 A	01.09.2004
		CN100528140 C	19.08.2009
		HK1036017 A	25.02.2005
		TWI256308 B	11.06.2006
		IL137970 A	05.10.2006
		AT345779 T	15.12.2006
		DK1056444 T	12.03.2007
		EP1772141 AB	11.04.2007
		EP20060022834	10.02.1999
		ES2275334 T	01.06.2007
		DE69934099 T	21.06.2007
		AT427102 T	15.04.2009
		DK1772141 T	20.07.2009
		EP2085075 A	05.08.2009
		EP20090156268	10.02.1999
		ES2324366 T	05.08.2009
		EP2319497 A	11.05.2011
		EP20100183811	10.02.1999
-----	-----	-----	-----
US6077531 A	20.06.2000	FR2747042 AB	10.10.1997
		CA2251002 AC	16.10.1997
		WO9737642 A	16.10.1997
		EP0896529 AB	17.02.1999
		EP19970919485	04.04.1997
		JP2000508309 T	04.07.2000
		AT213934 T	15.03.2002
		ES2172782 T	01.10.2002
		DE69710879 T	14.11.2002
-----	-----	-----	-----

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/MX2010/000154

CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A61K31/565 (2006.01)

A61K31/57 (2006.01)

A61K9/16 (2006.01)

A61P5/30 (2006.01)

A61P5/34 (2006.01)

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Solicitud internacional n°
PCT/MX2010/000154

A. CLASIFICACIÓN DEL OBJETO DE LA SOLICITUD

Ver Hoja Adicional

De acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP) o según la clasificación nacional y CIP.

B. SECTORES COMPRENDIDOS POR LA BÚSQUEDA

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido de los símbolos de clasificación)

A61K, A61P

Otra documentación consultada, además de la documentación mínima, en la medida en que tales documentos formen parte de los sectores comprendidos por la búsqueda

Bases de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda internacional (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizados)

EPODOC, INVENES, WPI, TATE, TATF, MEDLINE, BIOSIS, NPL, EMBASE

C. DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES

Categoría*	Documentos citados, con indicación, si procede, de las partes relevantes	Relevante para las reivindicaciones n°
X	WO 2004/110408 A2 (SAVOIR, JOHN CLAUDE) 23.12.2004, Párrafos 22, 31-32, 66-69, 71 y 80-82, y reivindicaciones 34, 37, 40, 46 y 48.	1-6, 9-12
A	US 6287693 B1 (JOHN CLAUDE SAVOIR) 11.09.2001, Resumen y columnas 1, 4-5, 8 y ejemplo 9.	1-15
A	US 6077531 A (LABORATOIRES BESINS ISCOVESCO) 20.06.2000, Resumen y columnas 1 y 2.	1-15

En la continuación del recuadro C se relacionan otros documentos Los documentos de familias de patentes se indican en el anexo

* Categorías especiales de documentos citados:	"T" documento ulterior publicado con posterioridad a la fecha de presentación internacional o de prioridad que no pertenece al estado de la técnica pertinente pero que se cita por permitir la comprensión del principio o teoría que constituye la base de la invención.
"A" documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante.	"X" documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado.
"E" solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior.	"Y" documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.
"L" documento que puede plantear dudas sobre una reivindicación de prioridad o que se cita para determinar la fecha de publicación de otra cita o por una razón especial (como la indicada).	"&" documento que forma parte de la misma familia de patentes.
"O" documento que se refiere a una divulgación oral, a una utilización, a una exposición o a cualquier otro medio.	
"P" documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.	

Fecha en que se ha concluido efectivamente la búsqueda internacional.
31/05/2011

Fecha de expedición del informe de búsqueda internacional.
13 de julio de 2011 (13/07/2011)

Nombre y dirección postal de la Administración encargada de la búsqueda internacional
OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS
Paseo de la Castellana, 75 - 28071 Madrid (España)
N° de fax: 91 349 53 04

Funcionario autorizado
M. García Bueno
N° de teléfono 91 3497000

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Solicitud internacional n°

Informaciones relativas a los miembros de familias de patentes

PCT/MX2010/000154

Documento de patente citado en el informe de búsqueda	Fecha de Publicación	Miembro(s) de la familia de patentes	Fecha de Publicación
WO2004110408 A	23.12.2004	CA2528545 A	23.12.2004
		AU2004246870 A	23.12.2004
		AU2004246870 B	23.07.2009
		US2005025827 A	03.02.2005
		US7589082 B	15.09.2009
		NO20060200 A	13.01.2006
		EP1663161 A	07.06.2006
		EP20040736545	10.06.2004
		BRPI0411335 A	25.07.2006
		CN1835737 A	20.09.2006
		CN100594907 C	24.03.2010
		JP2006527263 T	30.11.2006
		OA13307 A	13.04.2007
		EP1820494 AB	22.08.2007
		EP20070008942	10.06.2004
		EP1844765 A	17.10.2007
		EP20070008938	10.06.2004
		MX2008014654 A	09.03.2009
		US2009081303 A	26.03.2009
		EA200900451 A	30.12.2009
		EA012783 B	30.12.2009
		AT454885 T	15.01.2010
		PT1820494 E	14.04.2010
		DK1820494 T	25.05.2010
		ES2340422 T	02.06.2010
		HK1106717 A	11.06.2010
		SI1820494 T	31.08.2010
		CN101816662 A	01.09.2010
HK1097735 A	12.11.2010		
-----	-----	-----	-----
US6287693 B	11.09.2001	ZA9901058 A	11.08.1999
		WO9943304 A	02.09.1999
		CA2319176 AC	02.09.1999
		AU2293699 A	15.09.1999
		NO20004241 A	24.08.2000
		BR9908156 A	31.10.2000
		CZ20003047 A	15.11.2000
		CZ301042 B	21.10.2009
		TR200002462 T	21.11.2000
		EP1056444 AB	06.12.2000
		EP19990902729	10.02.1999
		UA73470 C	15.12.2000
		ID26523 A	11.01.2001
		CN1291887 A	18.04.2001
		CN1146407 C	21.04.2004
		PL343170 A	30.07.2001
		PL196369 B	31.12.2007
		HU0101271 A	28.09.2001
		JP2002504507 T	12.02.2002
		EE200000492 A	15.02.2002

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Solicitud internacional n°

Informaciones relativas a los miembros de familias de patentes

PCT/MX2010/000154

Documento de patente citado en el informe de búsqueda	Fecha de Publicación	Miembro(s) de la familia de patentes	Fecha de Publicación
		EE05019 B	16.06.2008
		AU747779 B	23.05.2002
		US2002168395 A	14.11.2002
		US6663895 B	16.12.2003
		US6528094 B	04.03.2003
		US6537580 B	25.03.2003
		NZ505987 A	25.07.2003
		US2003147964 A	07.08.2003
		US6638536 B	28.10.2003
		US2003191101 A	09.10.2003
		US6737081 B	18.05.2004
		RU2225708 C	20.03.2004
		US2004166164 A	26.08.2004
		US7427413 B	23.09.2008
		CN1524608 A	01.09.2004
		CN100528140 C	19.08.2009
		HK1036017 A	25.02.2005
		TWI256308 B	11.06.2006
		IL137970 A	05.10.2006
		AT345779 T	15.12.2006
		DK1056444 T	12.03.2007
		EP1772141 AB	11.04.2007
		EP20060022834	10.02.1999
		ES2275334 T	01.06.2007
		DE69934099 T	21.06.2007
		AT427102 T	15.04.2009
		DK1772141 T	20.07.2009
		EP2085075 A	05.08.2009
		EP20090156268	10.02.1999
		ES2324366 T	05.08.2009
		EP2319497 A	11.05.2011
		EP20100183811	10.02.1999
-----	-----	-----	-----
US6077531 A	20.06.2000	FR2747042 AB	10.10.1997
		CA2251002 AC	16.10.1997
		WO9737642 A	16.10.1997
		EP0896529 AB	17.02.1999
		EP19970919485	04.04.1997
		JP2000508309 T	04.07.2000
		AT213934 T	15.03.2002
		ES2172782 T	01.10.2002
		DE69710879 T	14.11.2002
-----	-----	-----	-----

CLASIFICACIONES DE INVENCION

A61K31/565 (2006.01)

A61K31/57 (2006.01)

A61K9/16 (2006.01)

A61P5/30 (2006.01)

A61P5/34 (2006.01)