

65
62

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.-HOFFMANN-LA ROCHE AG.-Solicitud de Patente de
Invención Fase Nacional PCT para "SOLUCIONES
DISPERSAS MOLECULARES HIDROFILAS DE
CARVEDILOL".-Clase A61K 31/403.-Expediente número 02-
088.279.-

1. Me refiero a mi Solicitud de Patente de 1 de Octubre de 2002.
2. Por medio del presente me permito manifestar a usted que en ejercicio del derecho conferido por el Artículo 28 numeral 1 del Tratado de Cooperación en materia de Patentes PCT, el capítulo reivindicatorio tal como fue presentado originalmente en Fase Internacional fue modificado al momento de su presentación en Fase Nacional, quedando con 23 reivindicaciones.

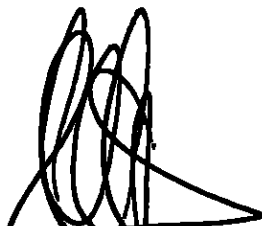
Las modificaciones realizadas se encuentran plenamente sustentadas en la descripción de la presente invención y en este sentido, no configuran una ampliación del invento o de la divulgación contenida en la solicitud presentada.

3. Por consiguiente anexo me permito presentar copia del capítulo reivindicatorio correspondiente a la solicitud de la referencia, que consta de 24 reivindicaciones, tal como fue presentado originalmente en Fase Internacional, junto con su traducción.

66⁶³

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

Señor Superintendente,

A handwritten signature in black ink, consisting of several overlapping loops and a long horizontal stroke extending to the right.

JOSE ANTONIO LLOREDA

T.P. 10.784

Código 231

Reivindicaciones

1. Una composición farmacéuticamente aceptable que comprende carvedilol o una sal del mismo farmacéuticamente aceptable, distribuida como una dispersión molecular en una concentración superior a 5% (p/p).

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, que es una solución sólida o semi-sólida.

3. La composición de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, caracterizada porque uno o más adyuvantes que no son activos en superficie, se encuentran presentes.

4. La composición de acuerdo con la reivindicación 3, caracterizada porque está presente polietilenglicol como el adyuvante que no es activo en superficie.

5. La composición de acuerdo con la reivindicación 4, caracterizada porque el polietilenglicol tiene un peso molecular de 1.000 a 20.000, preferentemente 4.000 a 10.000.

6. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizada porque está presente un sustituto del azúcar como el adyuvante que no es activo en superficie.

7. La composición de acuerdo con la reivindicación 6, caracterizada porque se encuentra isomalta como el sustituto de azúcar.

8. La composición de acuerdo con cualquiera de las

68^{GS}

reivindicaciones 1 a 7, caracterizada porque se encuentran presentes uno o más tensioactivos no iónicos.

9. La composición de acuerdo con la reivindicación 8, caracterizada porque la solución contiene un copolímero de polioxietileno-polioxipropileno como el tensioactivo no iónico.

10. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 8, caracterizada porque la solución contiene un estearato de polioxietileno como el tensioactivo no iónico.

11. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9, caracterizada porque la proporción de adyuvantes que no son activos en superficie a tensioactivos no iónicos es entre 1000:1 y 1:1, preferentemente entre 100:1 y 10:1.

12. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, caracterizada porque la concentración de carvedilol es entre 5% (p/p) y 60% (p/p).

13. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, caracterizada porque la concentración de carvedilol es entre 10% (p/p) y 40% (p/p).

14. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizada porque está presente dióxido de silicio altamente disperso.

15. Una composición de acuerdo con cualquiera de las

69⁶⁶

reivindicaciones 1 a 14, que contiene 10-20% (p/p) de carvedilol, 65-85% (p/p) de polietilenglicol, 1-10% (p/p) de copolímero de polioxietileno-polioxipropileno y 0,1-10% (p/p) de dióxido de silicio altamente disperso.

16. Una forma de administración farmacéuticamente aceptable que comprende una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15.

17. La forma de administración farmacéuticamente aceptable de acuerdo con la reivindicación 16, que posee una liberación de sustancia activa modificada, con 95% de sustancia activa, liberada en 2 a 24 horas.

18. La forma de administración farmacéuticamente aceptable de acuerdo con las reivindicaciones 16 o 17, que es una forma de administración sólida.

19. La forma de administración farmacéuticamente aceptable de acuerdo con las reivindicaciones 16 o 17, que es una forma de administración oral.

20. Un procedimiento para la producción de una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15, cuyo procedimiento comprende mezclar el carvedilol con un adyuvante que no es activo en superficie y/o un tensioactivo no iónico.

21. El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 20, caracterizado porque la mezcla fundida resultante se solidifica mediante la solidificación por spray.

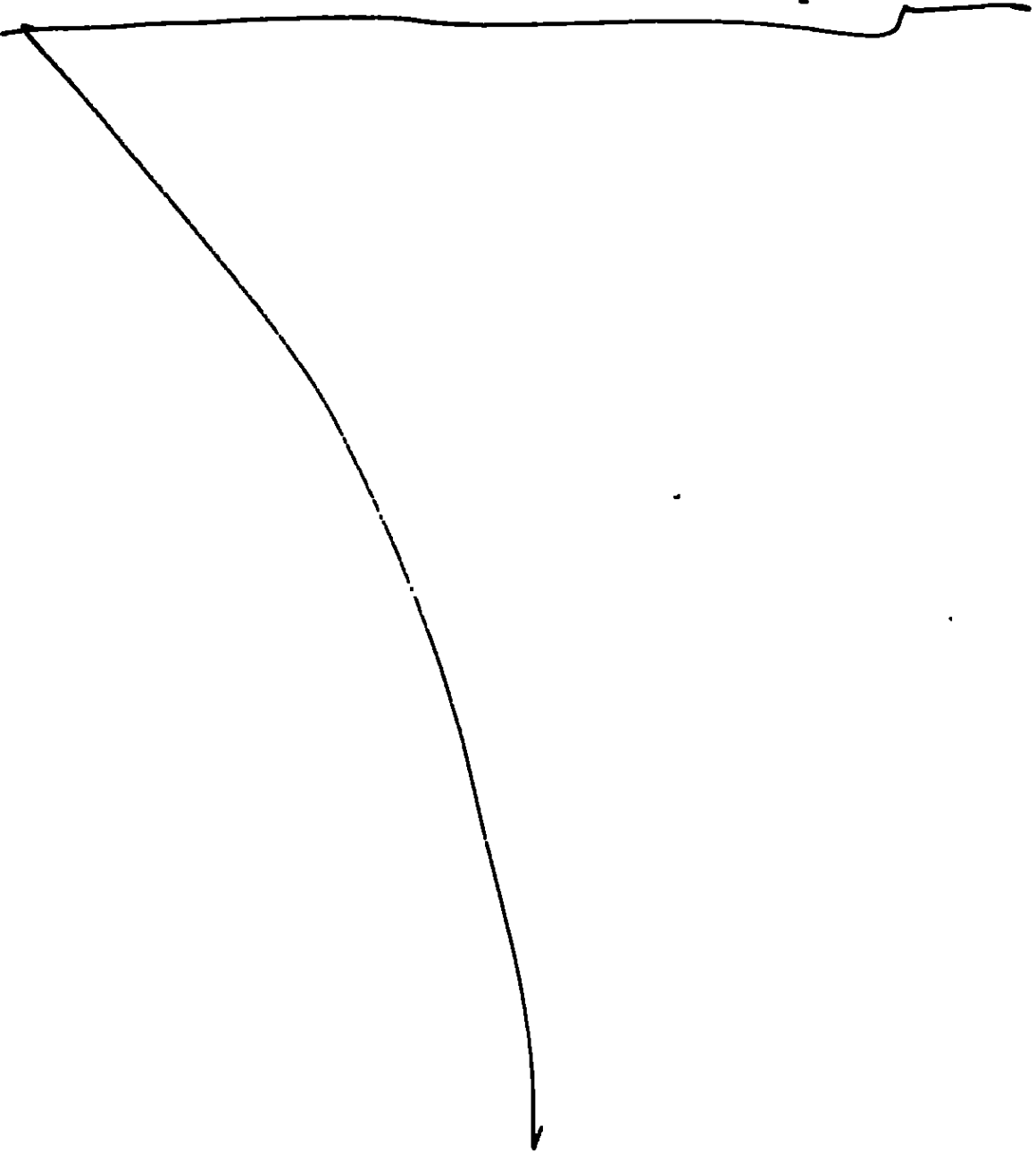
7162

31

22. La utilización de una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15, para el tratamiento y/o profilaxis de enfermedades tales como hipertensión, insuficiencia cardíaca o angina de pecho.

23. La utilización de una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15, para la producción de medicamentos para el tratamiento o profilaxis de enfermedades como hipertensión, insuficiencia cardíaca o angina de pecho.

24. La invención como se ha descrito hasta aquí.



77

Claims

1. A pharmaceutically acceptable composition comprising carvedilol or a pharmaceutically acceptable salt thereof distributed as a molecular dispersion in a concentration above 5% (wt./wt.).
2. The composition according to claim 1, which is a solid or semi-solid solution.
3. The composition according to any one of claims 1 to 2, wherein one or more adjuvants which are not surface-active are present.
4. The composition according to claim 3, wherein polyethylene glycol is present as the adjuvant which is not surface-active.
5. The composition according to claim 4, wherein the polyethylene glycol has a molecular weight of 1,000 to 20,000, preferably 4,000 to 10,000.
6. The composition according to any one of claims 1 to 5, wherein a sugar substitute is present as the adjuvant which is not surface-active.
7. The composition according to claim 6, wherein isomalt is present as the sugar substitute.
8. The composition according to any one of claims 1 to 7, wherein one or more non-ionic tensides are present.
9. The composition according to claim 8, wherein the solution contains a polyoxyethylene-polyoxypropylene copolymer as the non-ionic tenside.
10. The composition according to any one of claims 7 to 8, wherein the solution contains a polyoxyethylene stearate as the non-ionic tenside.
11. The composition according to any one of claims 7 to 9, wherein the ratio of adjuvants which are not surface active to non-ionic tensides lies between 1000:1 and 1:1, preferably between 100:1 and 10:1.

69
73

12. The composition according to any one of claims 1 to 11, wherein the carvedilol concentration lies between 5% (wt./wt.) and 60% (wt./wt.).

13. The composition according to any one of claims 1 to 11, wherein the
5 carvedilol concentration lies between 10% (wt./wt.) and 40% (wt./wt.).

14. The composition according to any one of claims 1 to 13, wherein highly dispersed silicon dioxide is present.

10 15. A composition according to any one of claims 1 to 14, which contains 10-20% (wt./wt.) carvedilol, 65-85% (wt./wt.) polyethylene glycol, 1-10% (wt./wt.) polyoxyethylene-polyoxypropylene copolymer and 0.1-10% (wt./wt.) highly dispersed silicon dioxide.

15 16. A pharmaceutically acceptable administration form comprising a composition according to any one of claims 1 to 15.

17. The pharmaceutically acceptable administration form according to claim 16, which has a modified active substance release, with 95% of the active substance being
20 released in 2 to 24 hours.

18. The pharmaceutically acceptable administration form according to claim 16 or claim 17, which is a solid administration form.

25 19. The pharmaceutically acceptable administration form according to claim 16 or claim 17, which is an oral administration form.

20. A process for the production of a composition according to any one of claims 1 to 15, which process comprises mixing the carvedilol with an adjuvant which is
30 not surface-active and/or a non-ionic tenside.

21. The process according to claim 20, wherein the resulting melt is solidified by spray solidification.

35 22. The use of a composition according to any one of claims 1 to 15 for the treatment and/or prophylaxis of illnesses such as hypertension, cardiac insufficiency or angina pectoris.

70
7A

23. The use of a composition according to any one of claims 1 to 15 for the production of medicaments for the treatment or prophylaxis of illnesses such as hypertension, cardiac insufficiency or angina pectoris.

5

24. The invention as described above.