



No. 13-252787- -00000-0000

Fecha: 2013-10-24 15:21:38 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 21

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO: UNA COMPOSICIÓN DE ENTACAPONA

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL A61K 31/275

71. SOLICITANTE: INNOPHARMAX INC

DOMICILIO: Taiwan, China

74. APODERADA SILVANA MARIA LÓPEZ DÍAZ

22. BOGOTÁ, D.C.

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO radicación  No. 13-252787- -00000-0000 Fecha: 2013-10-24 15:21:38 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI Act. 411 PRESENTACION Folios: 21
--	--

1	TIPO DE SOLICITUD	☒ Patente de invención ☒ Capítulo I	☐ Patente de Modelo de Utilidad ☐ Capítulo II
2	DATOS SOLICITUD INTERNACIONAL PCT (86)		
Solicitud Internacional No. PCT/CN2011/073297 Fecha 26 de Abril de 2011			
Publicación Internacional No. WO 2012/145893 A1 Fecha 01 de Noviembre de 2012			
3	TÍTULO DE LA INVENCION (200 caracteres o espacios máximos)		
UNA COMPOSICIÓN DE ENTACAPONA			
4	CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL (CIP) A61K 31/275		
5	SOLICITANTE (S) ☐ Esta persona también es inventor. Para datos adicionales utilizar hoja de información complementaria		
APELLIDOS O RAZÓN SOCIAL		NOMBRE	IDENTIFICACIÓN
INNOPHARMAX INC			
6	DATOS DEL SOLICITANTE		
DIRECCIÓN: 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City, No. TELÉFONO:			
CIUDAD: Taiwan 11492, LUGAR DE CONSTITUCIÓN: China			
PAÍS DE RESIDENCIA: China			
7	INVENTOR (ES)		
APELLIDOS		NOMBRES	NACIONALIDAD
1.HAO,		Wei-Hua	China
2.WANG,		Jong-Jing	China
3.CHEN,		Hui-Yun	China
DIRECCIÓN DE CORREO ELECTRÓNICO:			
8	DATOS INVENTOR (ES)		
DIRECCIÓN		CIUDAD	PAÍS RESIDENCIA
1. 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City,		Taiwan 11492,	China
2. 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City,		Taiwan 11492,	China
3. 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City,		Taiwan 11492,	China
OTRO(S) SOLICITANTE(S) Y/O (OTRO(S)) INVENTOR(ES)			
☐ Los demás solicitantes y/o (demás) inventores se indican en una hoja a continuación.			
9	☐ REPRESENTANTE LEGAL ☒ APODERADO		
APELLIDOS		NOMBRES	IDENTIFICACIÓN
LÓPEZ DÍAZ		SILVANA MARIA	C.C. 22.468.787 T.P. 147463 CSJ
DIRECCIÓN Cra. 11 No. 86 – 53, Piso 6 No. TELÉFONO 6181088			
CIUDAD Bogotá, D.C. CORREO notificaciones@clarkemodet.com.co.			
PAÍS Colombia ELECTRÓNICO			
10	DECLARACIONES DE PRIORIDAD ☐ SI ☐ NO		
(33) PAÍS DE ORIGEN		CÓDIGO PAÍS	(31) NÚMERO
			(32) FECHA AAA/MM/DD

11	DECLARACIÓN SOBRE USO DE RECURSOS GENÉTICOS O BIOLÓGICOS		
Declaro que el objeto de la presente solicitud de patente fue obtenido a partir de recursos genéticos o biológicos de los que cualquiera de los países miembros de la Comunidad Andina es país de origen.			
☐ SI ☐ NO			
Nota: En caso afirmativo deberá anexar copia del contrato de acceso de recursos genéticos o productos derivados, o certificado o número de registro, expedido por la Autoridad competente.			
12	DECLARACIÓN SOBRE USO DE CONOCIMIENTOS TRADICIONALES		
Declaro que el objeto de la presente solicitud de patente fue obtenido a partir de conocimientos tradicionales de comunidades indígenas, afroamericanas o locales de países miembros de la Comunidad Andina.			
☐ SI ☐ NO			
Nota: En caso afirmativo deberá anexar la licencia o autorización de uso de conocimiento tradicional, o certificado, o número de registro expedido por la Autoridad competente.			
13	REDUCCIÓN DE TASAS		
Declaro que carezco de medios económicos para presentar la solicitud de patente.			
☐ SI ☐ NO			
Nota: En caso de ser persona natural y carecer de medios económicos, y por lo tanto, aplique la reducción de tasas a que se refiere la resolución vigente en tarifas, debe firmar la presente solicitud bajo la gravedad de juramento.			
Micro, pequeñas y medianas empresas ☐			
Universidades públicas o privadas ☐			
Entidades sin ánimo de lucro ☐			
Debe aportar los documentos que se indican en el numeral 17 de anexos			
14	AUTORIZACIÓN DE NOTIFICACIÓN EN LÍNEA ☐ SI ☐ NO		
Manifiesto que he leído y entendido perfectamente los términos y condiciones de uso de medios electrónicos para las notificaciones en línea a través de Internet de los actos administrativos proferidos por la Superintendencia de Industria y Comercio que deben ser notificados personalmente y, en consecuencia, autorizo el servicio de notificación a través de internet.			
15	COMPROBANTE DE PAGO O PAGO ELECTRÓNICO	Nº 13-099862 // 13-107553	Fecha 03/10/2013 24/10/2013
16	FIRMA DEL APODERADO :		
SILVANA MARIA LÓPEZ DÍAZ C.C. 22.468.787 T.P. 147463 CSJ			
17	ANEXOS		
Documentación Técnica Solicitud Internacional en castellano		Documentación Jurídica	
1. ☒ Descripción 2. ☒ Reivindicaciones 3. ☐ Dibujos y/o figuras 4. ☒ Resumen. 5. ☐ Certificado de depósito de material biológico si fuera el caso. 6. ☐ Listado de secuencias de nucleótidos y/o aminoácidos en forma digital si fuera el caso. 7. ☐ Arte final 12 x 12. 8. ☐ Anexo formato digital.		9. ☐ Poderes, si fuera el caso. 10. ☐ Documento que legalmente pruebe la cesión del inventor al solicitante o a su causante. 11. ☐ Copia del contrato de acceso de recursos genéticos o productos derivados, certificado o número de registro, si fuera el caso. 12. ☐ Copia de la licencia o autorización de Conocimientos Tradicionales, certificado o número de registro, si fuera el caso. 13. Reducción de tasas Micro, pequeñas o medianas empresas ☐ Copia simple de la declaración de renta del año inmediatamente anterior, o en su defecto prueba documental idónea. ☐ Documento de constancia de cumplimiento con lo establecido en la ley 905 de 2004. Universidades públicas o privadas ☐ Copia acto de reconocimiento institucional emitido por el Ministerio de Educación Entidades sin ánimo de lucro ☐ Copia de registro vigente en Cámara de comercio. ☐ Hoja de información complementaria. ☐ Otros, especificar 14. ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud. 15. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. 16. ☐ Comprobante de pago de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación. 17. ☒ Comprobante de pago por reivindicación adicional a 10.	

UNA COMPOSICIÓN DE ENTACAPONA

CAMPO DE LA INVENCION

[0001] La presente invención se relaciona con una composición de entacapona, que comprende entacapona, PVP K30 y SDS. Adicionalmente, la presente invención también se relaciona con un proceso para preparar dicha composición de entacapona y usos de la misma.

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

[0002] La entacapona, también conocida como (E)-2-ciano-3-(3,4-dihidroxi-5-nitro-fenil) -N,N-dietil-2-propenamida, es una medicina actualmente conocida para tratar Enfermedad de Parkinson.

[0003] En razón a que la entacapona tiene un bajo índice de disolución y baja biodisponibilidad, las composiciones actualmente conocidas de entacapona se hacen principalmente de gránulos de tamaño más pequeño al moler o triturar con el fin de aumentar su índice de disolución y biodisponibilidad. Por ejemplo, el documento US 2010/0104634 A1 elabora 90% de gránulos de entacapona que tienen un tamaño de partícula de menos de 40 μm , mientras que el documento WO 2009098661 A1 elabora gránulos de entacapona y alcoholes de azúcar que pasan a través de un proceso de micronización de tal manera que el tamaño de la partícula es de menos de 30 μm .

[0004] Sin embargo, las técnicas tales como molido o micronización usualmente generan alto calor por lo tanto provocan que se deteriore los fármacos. Adicionalmente, estas técnicas aún tienen problemas como baja productividad y altos costos. Por lo tanto, resolver un problema de presión en la técnica es cómo preparar una composición de entacapona con un alto índice de disolución o alta biodisponibilidad sin utilizar técnicas como molido, triturado o micronización.

10

BREVE RESUMEN DE LA INVENCION

[0005] Para resolver los problemas mencionados anteriormente, los inventores han desarrollado un proceso mejorado que puede aumentar el índice de disolución de entacapona sin utilizar técnicas como molido, triturado o micronización, y también aumentar la productividad y reducir los costos de producción al simplificar el proceso.

20

[0006] Uno de los objetivos de la presente invención es proporcionar una composición de entacapona, que comprende entacapona o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, PVP K30 (povidona K30), SDS (dodecil sulfato de sodio), y por lo menos un excipiente farmacéuticamente aceptable.

25

[0007] Para alcanzar el anterior objetivo, la presente invención proporciona una composición de entacapona que comprende entacapona o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, PVP K30 y SDS; en donde la entacapona, PVP K30 y SDS están presentes

en una relación en peso de 1:0.05-0.6:0.06-0.1, y la composición tiene un índice de disolución de más de 88%.

[0008] En una realización preferida de la presente invención,
5 en dicha composición de entacapona, entacapona, PVP K30 y SDS están presentes en una relación en peso de 1:0.05-0.2:0.06; más preferiblemente, 1:0.2:0.06.

[0009] En una realización preferida de la presente invención,
10 dicha composición de entacapona tiene un índice de disolución de más de 90%; más preferiblemente, el índice de disolución es mayor de 95%.

[0010] En una realización preferida de la presente invención,
15 dicha composición de entacapona comprende adicionalmente por lo menos un excipiente, y dicho excipiente se selecciona de povidona, crospovidona, carbohidratos, croscarmelosa de sodio, o combinaciones de las mismas. Se puede seleccionar dicho carbohidrato de, por ejemplo, celulosa microscristalina (MCC),
20 manitol, celulosa, hidroxipropil metilcelulosa, almidón, o lactosa.

[0011] La presente invención también proporciona un proceso para preparar la composición de entacapona como se describió
25 anteriormente, que comprende las siguientes etapas:

(a) mezclar entacapona o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, PVP K30 y SDS, en donde la

entacapona, PVP K30 y SDS están presentes en una relación en peso de 1:0.05-0.6: 0.06-0.1;

(b) tamizar la mezcla obtenida en la etapa (a) a través de un tamiz, en donde el tamiz tiene un tamaño de malla más pequeño de 180 μm , más preferiblemente más pequeño de 150 μm ;

(c) granular la mezcla obtenida en la etapa (b) para obtener gránulos;

(d) secar los gránulos obtenidos en la etapa (c) hasta que el contenido de agua de estos esté entre 1% y 3%, obteniendo dicha composición de entacapona;

el proceso no comprende ninguna etapa de moler, triturar o micronizar la mezcla de entacapona o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, PVP K30 y SDS para hacer el tamaño de partícula de la mezcla menor de 30 μm .

[0012] En una realización preferida de la presente invención, en la etapa (a) de dicho proceso, entacapona, PVP K30 y SDS están presentes en una relación en peso de 1:0.05-0.2:0.06; más preferiblemente, 1:0.2:0.06.

[0013] En una realización preferida de la presente invención, en la etapa (c) de dicho proceso, la etapa de granulación es granulación en húmedo.

[0014] En una realización preferida de la presente invención, dicho proceso no comprende ninguna etapa de moler, triturar o micronizar la mezcla de entacapona, PVP K30 y SDS para hacer el tamaño de partícula de la mezcla menor de 40 μm .

5

[0015] En una realización preferida de la presente invención, la etapa (a) de dicho proceso comprende adicionalmente por lo menos un excipiente, y dicho excipiente se selecciona de povidona, crospovidona, carbohidratos, croscarmelosa de sodio, ó combinaciones de las mismas. Dicho carbohidrato se puede seleccionar de, por ejemplo, celulosa microscristalina, manitol, celulosa, hidroxipropil metilcelulosa, almidón, o lactosa.

[0016] La presente invención proporciona adicionalmente una composición farmacéutica, que comprende la composición de entacapona mencionada anteriormente; preferiblemente una composición farmacéutica para tratar Enfermedad de Parkinson.

[0017] En una realización preferida de la presente invención, dicha composición farmacéutica comprende adicionalmente levodopa y benserazida, o comprende adicionalmente levodopa y carbidopa.

[0018] La presente invención proporciona adicionalmente el uso de la composición de entacapona mencionada anteriormente para preparar composiciones farmacéuticas; preferiblemente, para preparar composiciones farmacéuticas para tratar enfermedad de Parkinson.

[0019] En una realización preferida de la presente invención, las composiciones farmacéuticas en dicho uso comprenden adicionalmente levodopa y benserazida, o comprenden
5 adicionalmente levodopa y carbidopa.

[0020] En vista de lo anterior, la composición de entacapona proporcionada en la presente invención puede aumentar el índice de disolución de entacapona a más de 88% sin utilizar técnicas
10 como molido, triturado o micronización. En comparación con los procesos conocidos, la presente invención puede no solo simplificar el proceso al evitar las etapas asociadas con molido, pero también evitar el riesgo de deterioro de la entacapona inducido por alto calor que resulta de las etapas asociadas con
15 molido. La presente invención también puede aumentar la productividad y reducir los costos.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION

[0021] Los siguientes ejemplos son solo ilustraciones de las
20 mejores realizaciones pero no están destinados a limitar el alcance de la presente invención. Con base en la descripción de la presente invención, aquellos expertos en la técnica cambios y modificaciones apropiadas sin violar el espíritu de la presente invención.

25

[0022] **Ejemplo**

[0023] Primero, se preparan las composiciones de gránulos de entacapona 1 a 6 de acuerdo con las relaciones de las composiciones mostradas en la Tabla 1 adelante.

5 [0024] Se agregan de forma secuencial MCC, SDS, PVP K30, manitol, y entacapona y se mezclan durante 5 minutos. Luego, la mezcla se tamiza a través de un tamiz de 150 μm de tamaño de malla (100 malla). El polvo tamizado se coloca en un granulador, se rocía con agua desionizada y se granula. Los gránulos
10 resultantes se colocan en un horno de secado a 50° C hasta que el contenido de agua de estos esté entre 1% y 3%, y luego se empacan en cápsulas o se prensan en comprimidos para obtener las composiciones de entacapona 1 a 6.

15 Tabla 1

	entacapona (mg)	PVP K30 (mg)	SDS (mg)	MCC (mg)	manitol (mg)
Composición 1	200	0	0	0.5	168
Composición 2	200	10	12	0.5	168
Composición 3	200	8	8	0.5	168
Composición 4	200	20	12	0.5	168
Composición 5	200	40	12	0.5	168
Composición 6	200	120	20	0.5	168

[0025] Se realiza la prueba de disolución de acuerdo con el método de disolución de fármaco para la entacapona obtenido al buscar la Base de Datos de Métodos de Disolución proporcionada en

el sitio web de la FDA (http://www.accessdata.fda.gov/scripts/cder/dissolution/dsp_Search_Results_Dissolutions.cfm). Se lleva a cabo la prueba de disolución utilizando un aparato de agitación de paleta con una velocidad de rotación de 50 rpm. El disolvente utilizado es 900 mL de solución reguladora de fosfato con pH 5.5 y el periodo de prueba es 120 minutos. Luego la solución resultante se analiza mediante HPLC y los índices de disolución obtenidos se muestran en la Tabla 2 adelante.

10

Tabla 2

	composiciones de entacapona			Índice de disolución (%)
	entacapona	PVP K30	SDS	
	(mg)	(mg)	(mg)	
Composición 1	200	0	0	81.15
Composición 2	200	10	12	91.78
Composición 3	200	8	8	83.20
Composición 4	200	20	12	93.72
Composición 5	200	40	12	95.98
Composición 6	200	120	20	88.93

[0026] En vista de lo anterior, el índice de disolución de entacapona per se es aproximadamente 81.15%. Cuando la relación en peso de entacapona, PVP K30 y SDS es 1:0.05-0.6:0.06-0.1, el índice de disolución de la composición de entacapona resultante aumenta significativamente para alcanzar más de 88%. Cuando la relación en peso de entacapona, PVP K30 y SDS es 1:0.05-0.2:0.06,

el índice de disolución de la composición de entacapona resultante puede incluso alcanzar más de 90%. Por último, cuando la relación en peso de entacapona, PVP K30 y SDS es 1:0.2:0.06, el índice de disolución puede alcanzar más de 95%.

5

[0027] Por lo tanto, las composiciones de entacapona obtenidas al adoptar las relaciones mencionadas anteriormente sin utilizar técnicas como molido, triturado o micronización pueden proporcionar no solo ventajas tales como alto índices de disolución y procesos simplificados, pero también evitar los problemas de deterioro de entacapona que resultan de alto calor generado durante molido.

10

REIVINDICACIONES

Lo que se reivindica es:

- 5 1. Una composición de entacapona, que comprende entacapona o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, PVP K30 y SDS; en donde la entacapona, PVP K30 y SDS están presentes en una relación en peso de 1:0.05-0.6:0.06-0.1, y la composición tiene un índice de disolución de más de 88%.
10
2. La composición de entacapona de acuerdo con la reivindicación 1, en donde la entacapona, PVP K30 y SDS están presentes en un peso de 1:0.05-0.2:0.06.
- 15 3. La composición de entacapona de acuerdo con la reivindicación 2, en donde la entacapona, PVP K30 y SDS están presentes en un peso de 1:0.2:0.06.
- 20 4. La composición de entacapona de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el índice de disolución es mayor de 90%.
- 25 5. La composición de entacapona de acuerdo con la reivindicación 4, en donde el índice de disolución es mayor de 95%.

6. La composición de entacapona de acuerdo con la reivindicación 1, comprende adicionalmente por lo menos un excipiente, y dicho excipiente se selecciona de povidona, crospovidona, carbohidratos, croscarmelosa de sodio, o combinaciones de las mismas.

7. La composición de entacapona de acuerdo con la reivindicación 6, en donde los carbohidratos se seleccionan de celulosa microscristalina, manitol, celulosa, hidroxipropil metilcelulosa, almidón, o lactosa.

8. Un proceso para preparar la composición de entacapona de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende las siguientes etapas:

(a) mezclar entacapona o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, PVP K30 y SDS, en donde la entacapona, PVP K30 y SDS están presentes en una relación en peso de 1:0.05-0.6: 0.06-0.1;

(b) tamizar la mezcla obtenida en la etapa (a) a través de un tamiz, en donde el tamiz tiene un tamaño de malla más pequeño de 180 μm ;

(c) granular la mezcla obtenida en la etapa (b) para obtener gránulos;

(d) secar los gránulos obtenidos en la etapa (c) hasta que el contenido de agua de estos se encuentre entre 1% y 3%, obteniendo la composición de entacapona de acuerdo con la reivindicación 1;

el proceso no comprende ninguna etapa de moler, triturar o micronizar la mezcla de entacaponá o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, PVP K30 y SDS para hacer el tamaño de partícula de la mezcla menor de 30 μm .

5

9. El proceso de acuerdo con la reivindicación 8, en donde en la etapa (a) la entacaponá, PVP K30 y SDS están presentes en una relación en peso de 1:0.05-0.2:0.06.

10 10. El proceso de acuerdo con la reivindicación 9, en donde en la etapa (a) entacaponá, PVP K30 y SDS están presentes en una relación en peso de 1:0.2:0.06.

11. El proceso de acuerdo con la reivindicación 8, en donde en la etapa (c) la etapa de granulación es granulación en húmedo.

12. El proceso de acuerdo con la reivindicación 8, que no comprende ninguna etapa de moler, triturar o micronizar la mezcla de entacaponá o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, PVP K30 y SDS para hacer el tamaño de partícula de la mezcla menor de 40 μm .

13. El proceso de acuerdo con la reivindicación 8, en donde la etapa (a) comprende adicionalmente agregar por lo menos un excipiente, y dicho excipiente se selecciona de povidona,

crospovidona, carbohidratos, croscarmelosa de sodio, o combinaciones de las mismas.

14. El proceso de acuerdo con la reivindicación 13, en donde los
5 carbohidratos se seleccionan de celulosa microscristalina, manitol, celulosa, hidroxipropil metilcelulosa, almidón, o lactosa.

15. Una composición farmacéutica, que comprende la composición
10 de entacapona de acuerdo con la reivindicación 1.

16. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación
15, que es una composición farmacéutica para tratar Enfermedad de Parkinson.

17. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación
16, que comprende adicionalmente levodopa y benserazida, o
que comprende adicionalmente levodopa y carbidopa.

18. Uso de la composición de entacapona de acuerdo con la
20 reivindicación 1 para fabricar una composición farmacéutica.

19. El uso de acuerdo con la reivindicación 18, en donde dicha
composición farmacéutica es aquella para tratar enfermedad
25 de Parkinson.

20. El uso de acuerdo con la reivindicación 18, en donde dicha composición farmacéutica comprende adicionalmente levodopa y benserazida, o comprende adicionalmente levodopa y carbidopa.

RESUMEN

Se describe una composición de entacapona que comprende entacapona o sales farmacéuticamente aceptables, PVPK30 y SDS en la presente invención, en donde la relación de masa de entacapona : PVPK30: SDS es 1:0.05~0.6:0.06~0.1. La presente invención también describe método preparativo y uso de la composición de entacapona.

(12) 按照专利合作条约所公布的国际申请

(19) 世界知识产权组织
国际局



(43) 国际公布日
2012 年 11 月 1 日 (01.11.2012)

WIPO | PCT

(10) 国际公布号

WO 2012/145893 A1

(51) 国际专利分类号:

A61K 31/275 (2006.01) A61K 47/02 (2006.01)
A61K 47/32 (2006.01) A61P 25/16 (2006.01)

(21) 国际申请号: PCT/CN2011/073297

(22) 国际申请日: 2011 年 4 月 26 日 (26.04.2011)

(25) 申请语言: 中文

(26) 公布语言: 中文

(71) 申请人 (对除美国外的所有指定国): 因华生技制药股份有限公司 (INNOPHARMAX INC) [CN/CN]; 中国台湾省台北市内湖区瑞光路 478 巷 22 号 9 楼, Taiwan 11492 (CN)。

(72) 发明人; 及

(75) 发明人/申请人 (仅对美国): 郝为华 (HAO, Wei-Hua) [CN/CN]; 中国台湾省台北市内湖区瑞光路 478 巷 22 号 9 楼, Taiwan 11492 (CN)。王钟靓 (WANG, Jong-Jing) [CN/CN]; 中国台湾省台北市内湖区瑞光路 478 巷 22 号 9 楼, Taiwan 11492 (CN)。陈蕙筠 (CHEN, Hui-Yun) [CN/CN]; 中国台湾省台北市内湖区瑞光路 478 巷 22 号 9 楼, Taiwan 11492 (CN)。

(74) 代理人: 北京三友知识产权代理有限公司 (BEIJING SANYOU INTELLECTUAL PROPERTY

AGENCY LTD.); 中国北京市金融街 35 号国际企业大厦 A 座 16 层, Beijing 100033 (CN)。

(81) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的国家保护): 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) 指定国 (除另有指明, 要求每一种可提供的地区保护): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 欧亚 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧洲 (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, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)。

本国际公布:

— 包括国际检索报告(条约第 21 条(3))。



WO 2012/145893 A1

(54) Title: A COMPOSITION OF ENTACOPONE

(54) 发明名称: 安它可朋组合物

(57) Abstract: A composition of entacapone comprising entacapone or pharmaceutically acceptable salts, PVPK30 and SDS is disclosed in the present invention, wherein the mass ratio of entacapone : PVPK30 : SDS is 1:0.05~0.6:0.06~0.1. The present invention also discloses preparative method and use of the composition of entacapone.

(57) 摘要:

本发明公开了一种安它可朋组合物, 其包含安它可朋或其医药可接受盐, PVPK30 及 SDS; 其中安它可朋:PVPK30:SDS 的质量比为 1:0.05~0.6:0.06~0.1。本发明还公开了安它可朋组合物的制备方法和应用。

(12) International Application Status Report

Received at International Bureau: 04 May 2011 (04.05.2011)

Report generated on: 02 October 2013 (02.10.2013)

(10) Publication number:

WO2012/145893

(43) Publication date:

01 November 2012 (01.11.2012)

(26) Publication language:

Chinese (ZH)

(21) Application Number:

PCT/CN2011/073297

(22) Filing Date:

26 April 2011 (26.04.2011)

(25) Filing language:

Chinese (ZH)

(51) International Patent Classification:

A61K 31/275 (2006.01); A61K 47/32 (2006.01); A61K 47/02 (2006.01); A61P 25/16 (2006.01)

(71) Applicant(s):

INNOPHARMAX INC [CN/CN]; 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City, Taiwan 11492 (CN) (*for all designated states except US*)

HAO, Wei-Hua [CN/CN]; 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City, Taiwan 11492 (CN) (*for US only*)

WANG, Jong-Jing [CN/CN]; 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City, Taiwan 11492 (CN) (*for US only*)

CHEN, Hui-Yun [CN/CN]; 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City, Taiwan 11492 (CN) (*for US only*)

(72) Inventor(s):

HAO, Wei-Hua; 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City, Taiwan 11492 (CN)

WANG, Jong-Jing; 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City, Taiwan 11492 (CN)

CHEN, Hui-Yun; 9F., No.22, Lane 478, Rueiguang Rd., Neihu District Taipei City, Taiwan 11492 (CN)

(74) Agent(s):

BEIJING SANYOU INTELLECTUAL PROPERTY AGENCY LTD.; F16, Block A, Corporate Square, No.35 Jinrong Street
Beijing 100033 (CN)

(54) Title (EN): A COMPOSITION OF ENTACOPONE

(54) Title (FR): COMPOSITION D'ENTACOPONE

(54) Title (ZH): 安它可朋组合物

(57) Abstract:

(EN): A composition of entacapone comprising entacapone or pharmaceutically acceptable salts, PVPK30 and SDS is disclosed in the present invention, wherein the mass ratio of entacapone : PVPK30 : SDS is 1:0.05~0.6:0.06~0.1. The present invention also discloses preparative method and use of the composition of entacapone.

(FR): La présente invention concerne une composition d'entacapone comprenant de l'entacapone ou des sels pharmaceutiquement acceptables, PVPK30 et SDS, où le rapport en masse d'entacapone : PVPK30 : SDS est de 1:0,05~0,6:0,06~0,1. La présente invention concerne également un procédé de préparation et d'utilisation de la composition d'entacapone.

International search report:

Received at International Bureau: 13 February 2012 (13.02.2012) [CN]

International Report on Patentability (IPRP) Chapter II of the PCT:

Not available

(81) Designated States:

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

European Patent Office (EPO) : 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, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR

African Intellectual Property Organization (OAPI) : BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG

African Regional Intellectual Property Organization (ARIPO) : BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW

Eurasian Patent Organization (EAPO) : AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 0099862
		Bogotá D.C., Octubre 03 de 2013 - 16:51:22

RECIBIDO DE : CLARKE MODET	NI 830.008.643
----------------------------	----------------

*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	560783226	02/10/2013	71.325.000.00

*** Conceptos Pagados ***			
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO Vr.CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCIÓN	500.000.00 500.000.00
			\$500.000.00
=====			

SON: **QUINIENTOS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-252787- -00000-0000

Fecha: 2013-10-24 15:21:38 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 21

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 107553
		Bogotá D.C., Octubre 24 de 2013 - 09:53:41

RECIBIDO DE : CLARKE MODET				NI 830.008.643	
*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
RECIBO DE CA	999999999	107537	24/10/2013		4.410.000.00

*** Conceptos Pagados ***				
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
10 50005-01-01	SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INIC	30.000.00	300.000.00
				\$300.000.00

SON: **TRESCIENTOS MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____



Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Octubre 24 de 2013 - 09:53:42



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-252787- -00000-0000

Fecha: 2013-10-24 15:21:38 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 21

PATENTE DE INVENCION ☐

MODEL C

☐	Indicación que se solicita una patente.
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Descripción de la invención
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)
Completa ☐	Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☐

MODELO DE UTILIDAD PCT ☐

Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

☐	Indicación que se solicita una PCT
☐	Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
Completa ☐	Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita 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 ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita un esquema de trazado
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica de un esquema de trazado
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐