



- (51) Clasificación Internacional de Patentes:
A61K 9/16 (2006.01) *A61K 47/34* (2006.01)
- (21) Número de la solicitud internacional:
PCT/CL2012/000067
- (22) Fecha de presentación internacional:
15 de noviembre de 2012 (15.11.2012)
- (25) Idioma de presentación: español
- (26) Idioma de publicación: español
- (30) Datos relativos a la prioridad:
2901-2011
18 de noviembre de 2011 (18.11.2011) CL
- (71) Solicitante: **UNIVERSIDAD DE SANTIAGO DE CHILE** [CL/CL]; Av. Libertador Bernardo O'Higgins 3363, Santiago (CL).
- (72) Inventores; e
- (71) Solicitantes : **VILOS ORTIZ, Cristian** [CL/CL]; Av. Libertador Bernardo O'Higgins 3363, Santiago (CL). **VELASQUEZ CUMPLIDO, Luis** [CL/CL]; Av. Libertador Bernardo O'Higgins 3363, Santiago (CL). **CONSTANDIL CORDOVA, Luis** [CL/CL]; Av. Libertador Bernardo O'Higgins 3363, Santiago (CL). **RIOS RAMIREZ, Miguel** [CL/CL]; Av. Libertador Bernardo O'Higgins 3363, Santiago (CL).
- (74) Mandatario: **MOLINA VILLASECA, Eduardo**; Estudio Federico Villaseca y Cia., Av. Alonso de Cordova 5151, Piso 8, Las, Condes, 7560873 santiago (CL).
- (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, BN, 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, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, 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, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, 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, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Continúa en la página siguiente]

(54) Title: INJECTABLE VETERINARY COMPOSITION FOR CONTROLLED, SUSTAINED RELEASE OF CEFTIOFUR AND FLORFENICOL IN ANIMAL SPECIES, BASED ON POLYHYDROXYBUTYRATE HYDROXYVALERATE (PHBV) MICROPARTICLES

(54) Título : COMPOSICIÓN VETERINARIA INYECTABLE DE LIBERACIÓN PROLONGADA DE CONTROLADA DE CEFTIOFUR Y FLORFENICOL EN ESPECIES ANIMALES, BASADA EN MICROPARTÍCULAS DE POLIHIDROXIBUTIRATO HIDROXIVALERATO (PHBV)

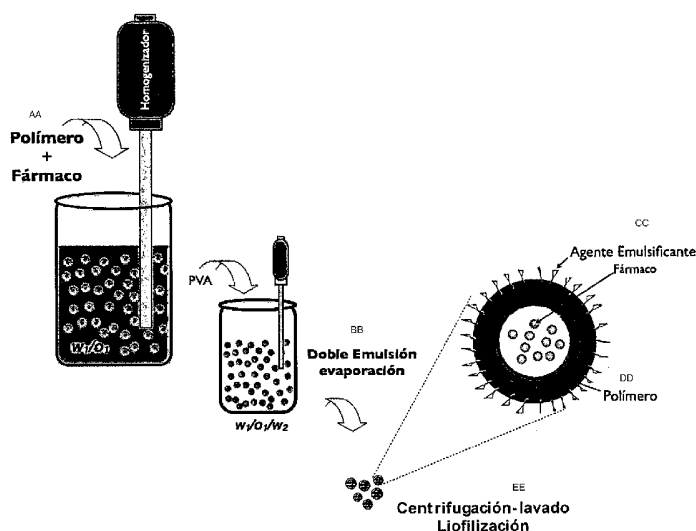


Figura 7

AA Polymer + drug
BB Double emulsion evaporation
CC Emulsifying agent drug
DD Polymer
EE Centrifugation-washing lyophilization

(57) Abstract: Sustained-release injectable veterinary composition that comprises microparticles containing a biocompatible biodegradable polymer selected from poly-3-hydroxybutyrate-co-3-hydroxyvalerate (PHBV), which encapsulates an antimicrobial agent selected from ceftiofur or florfenicol or a mixture thereof, and the method for the preparation thereof.

(57) Resumen: Composición veterinaria inyectable de liberación prolongada, que comprende micropartículas que contienen un polímero biodegradable biocompatible seleccionado de Poli-3-hidroxibutirato co-3-hidroxivalerato (PHBV), que encapsula un agente antimicrobiano seleccionado de Cefotiofur o Florfenicol o una mezcla de los mismos y procedimiento de preparación.

WO 2013/071457 A4



Publicada:

- *con informe de búsqueda internacional (Art. 21(3))*
- *con reivindicaciones modificadas (Art. 19(1))*

Fecha de publicación de las reivindicaciones modificadas:

18 de julio de 2013

REIVINDICACIONES MODIFICADAS
recibidas por la oficina Internacional el 22 Abril 2013 (22.04.2013)

- 1.- Composición veterinaria inyectable de liberación prolongada, que comprende micropartículas de Poli-3-hidroxi-butarato co-3-hidroxi-valerato (PHBV) como un polímero biodegradable biocompatible que encapsula Florfenicol.
- 2.- La composición según la reivindicación 1, que es de dosis única.
- 3.- La composición según la reivindicación 1, en donde Florfenicol está presente en una cantidad de 60% en peso basado en el total del peso de tal partícula.
- 4.- La composición según la reivindicación 1, en donde las micropartículas de Florfenicol – PHBV tienen un tamaño en el rango de 0.1- 10 micrómetros.
- 5.- La composición según la reivindicación 4, en donde las micropartículas de Florfenicol – PHBV tienen un tamaño de 1 micrómetro.
- 6.- La composición veterinaria inyectable de liberación prolongada, que comprende micropartículas de Poli-3-hidroxi-butarato co-3-hidroxi-valerato (PHBV) como un polímero biodegradable biocompatible que encapsula Ceftiofur.
- 7.- La composición según la reivindicación 6, en donde es una dosis única.
- 8.- La composición según la reivindicación 6, en donde Ceftiofur está presente en una cantidad de 60% en peso basado en el total del peso de tal partícula.
- 9.- La composición según la reivindicación 6, en donde las micropartículas de Ceftiofur – PHBV tienen un tamaño en el rango de 1- 20 micrómetros.
- 10.- La composición según la reivindicación 9, en donde las partículas de Ceftiofur – PHBV tienen un tamaño de 10 micrómetros
- 11.- La composición según la reivindicación 9, en donde las partículas de Ceftiofur – PHBV tienen un tamaño de 5 micrómetros.
- 12.- Procedimiento para la preparación de la composición veterinaria inyectable de liberación prolongada de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, que comprende
 - (a) emulsionar en una primera vez, una disolución de dos fases de: 1) un polímero biodegradable biocompatible seleccionado de ácido poliláctico-glicólico (PHBV) en un

solvente orgánico seleccionado de diclorometano, y agua, y 2) un agente antimicrobiano seleccionado de Cefotiofur o Florfenicol, el que ha sido previamente disuelto en metanol; y emulsionar en una segunda vez, la mezcla obtenida de la primera emulsión, usando como agente emulsionante, polivinilalcohol (PVA);

(b) evaporar el exceso de solvente orgánico bajo agitación durante un período de entre 10 y 18 horas; y

(c) lavar, centrifugar y liofilizar las micropartículas poliméricas con antibiótico encapsulado.

13.- El procedimiento de la reivindicación 12, que además comprende en las etapas a) y b), controlar la velocidad de emulsificación, el tiempo de emulsificación o la concentración de los polimeros en valores predeterminados para regular el tamaño de las micropartículas.

14.- El procedimiento de la reivindicación 10, donde se agrega PVA muy lentamente.