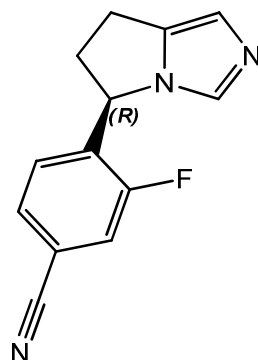


REIVINDICACIONES

1. Una forma de dosificación farmacéutica para administración oral que comprende
- (a) el fármaco 4-[(5R)-6,7P-dihidro-5H-pirrol[1,2-c]imidazol-5-il]-3-fluorobenzonitrilo como se define por la fórmula (1)



(1)

o cualquier sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y

- (b) al menos 30% por peso de celulosa microcristalina con base en el peso total de dicha forma de dosificación farmacéutica.

2. La forma de dosificación farmacéutica de acuerdo con **la reivindicación 1** en donde la celulosa microcristalina está presente de 30 a 95% por peso con base en el peso total de dicha forma de dosificación farmacéutica.
3. La forma de dosificación farmacéutica según **cualquiera de las reivindicaciones anteriores**, en donde dicho fármaco está presente como sal de fosfato, preferiblemente como sal de mono-fosfato.
4. La forma de dosificación farmacéutica según **cualquiera de las reivindicaciones anteriores**, en donde dicho fármaco, calculado con base en su base libre, está presente de 0.5 a 20% por peso con base en el peso total de dicha forma de dosificación farmacéutica.

5. La forma de dosificación farmacéutica de acuerdo con **cualquiera de las reivindicaciones anteriores** que comprende además un agente deslizante, preferiblemente dicho agente deslizante es un dióxido de silicio, más preferiblemente dicho agente deslizante es un dióxido de silicio coloidal.

5

6. La forma de dosificación farmacéutica de acuerdo con **la reivindicación 6** en donde dicho agente deslizante está presente de 0.1 a 5% por peso con base en el peso total de dicha forma de dosificación farmacéutica.

- 10 7. La forma de dosificación farmacéutica según **cualquiera de las reivindicaciones anteriores** que comprende

- (a) el fármaco 4-[(5R)-6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-5-il]-3-fluorobenzonitrilo presente como sal de fosfato,
(b) al menos 30% por peso de celulosa microcristalina con base en el peso total de dicha forma de dosificación farmacéutica, y
(c) dióxido de silicio coloidal.

15

8. La forma de dosificación farmacéutica según **la reivindicación 7** que comprende:

- (a) 1 a 8%, calculado con base a su base libre, por peso del fármaco 4-[(5R)-6,7-dihidro-5H-pirrolo [1,2-c]imidazol-5-il]-3-fluorobenzonitrilo presente como sal de monofosfato,
(b) 30 - 95% por peso de la celulosa microcristalina,
(c) 0.3 - 1,5% por peso del dióxido de silicio coloidal,
con base en el peso total de dicha forma de dosificación farmacéutica.

25

9. La forma de dosificación farmacéutica según **cualquiera de las reivindicaciones anteriores** que comprende además manitol.

10. La forma de dosificación farmacéutica de acuerdo con **la reivindicación 8** en donde dicho manitol está presente de 3 a 40% por peso, preferiblemente 5 a 40% por peso con base en el peso total de dicha forma de dosificación farmacéutica.
- 5 11. La forma de dosificación farmacéutica según **cualquiera de las reivindicaciones anteriores** que comprende:
- (a) $4 \pm 1\%$, calculado con base a su base libre, por peso del fármaco 4-[(5R)-6,7-dihidro-5H-pirrolo [1,2-c]imidazol-5-il]-3-fluorobenzonitrilo presente como sal de monofosfato,
- 10 (b) $77 \pm 7\%$ por peso de la celulosa microcristalina,
- (c) $0.6 \pm 0.2\%$ por peso de dióxido de silicio coloidal,
- (b) $10 \pm 2\%$ por peso de manitol,
- y opcionalmente que comprende además:
- (e) $2 \pm 0.5\%$ por peso de un agente disgregante, preferiblemente croscarmelosa de
- 15 sodio, y
- (f) $1.5 \pm 0.5\%$, por peso de un lubricante, preferiblemente estearato de magnesio.
- con base en el peso total de dicha forma de dosificación farmacéutica.
- 20 12. Un procedimiento para la preparación de una forma de dosificación farmacéutica **como se define por cualquiera de las reivindicaciones anteriores** que comprende la mezcla del fármaco 4-[(5R)-6,7-dihidro-5H-pirrolo[1,2-c]imidazol-5-il]-3-fluorobenzonitrilo con celulosa microcristalina.
- 25 13. El proceso según la **reivindicación 12** en donde la mezcla del fármaco con celulosa microcristalina se realizó como una primera etapa del proceso antes de cualquier etapa de cribado, tamizado, compactación, o compresión.
- 30 14. El proceso según las **reivindicaciones 12 o 13** comprende además el uso de un agente deslizante para preparar una mezcla que está lista para la formación de comprimidos.

15. El proceso según las **reivindicaciones 12 a 14** caracterizado además por los siguientes pasos del proceso:

(1) mezclar el fármaco junto con la celulosa microcristalina, y opcionalmente ingredientes adicionales tales como un agente deslizante, un agente disgregante, y un agente lubricante, para obtener una mezcla compactable por máquina,

(2) compactar la mezcla compactable por máquina mediante granulación en seco, preferiblemente mediante compactación con rodillo, para obtener un material compactado,

(3) mezclar el material compactado con dióxido de silicio coloidal, y opcionalmente con ingredientes adicionales tales como celulosa microcristalina, manitol, un agente disgregante, y un lubricante, para obtener una mezcla comprensible por máquina,

(4) comprimir la mezcla compresible por máquina mediante el uso de una máquina de formación de comprimidos para obtener los comprimidos.

16. Una forma de dosificación farmacéutica obtenible mediante el proceso **como se define mediante cualquiera de las reivindicaciones 12 a 15**.

17. El uso de celulosa microcristalina para transformar el fármaco 4-[(5R)-6,7-dihidro-5H-pirrol[1,2-c]imidazol-5il]-3-fluorobenzonitrilo en un material farmacéuticamente procesable.

18. Una forma de dosificación farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones 1-11 o la reivindicación 16 para uso en el tratamiento de la enfermedad de Cushing o síndrome de Cushing.