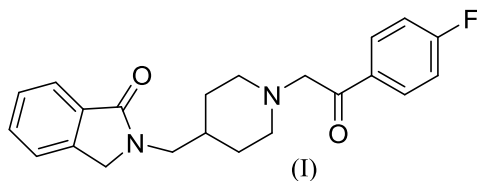


REIVINDICACIONES

1. Una forma cristalina del Compuesto (I):



que comprende una forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O, y en donde la forma (A) tiene un patrón de difracción de rayos X de polvo por lo menos con un pico mayor substancialmente similar a por lo menos un pico mayor mostrado en la Figura 11.

2. La forma cristalina de la reivindicación 1, en donde la forma (A) tiene picos de un patrón de difracción de rayos X de polvo a aproximadamente 7,6 y 14,3 °2θ usando radiación Kα de Cu.

3. La forma cristalina de la reivindicación 1 o 2, en donde la forma (A) tiene picos de difracción de rayos X de polvo a aproximadamente 7,6, 14,3 y 14,7 °2θ usando radiación Kα de Cu.

4. La forma cristalina de cualquiera de las reivindicaciones 1-3, en donde la forma (A) tiene picos de difracción de rayos X de polvo a aproximadamente 7,6, 14,3 y 27,5 °2θ usando radiación Kα de Cu.

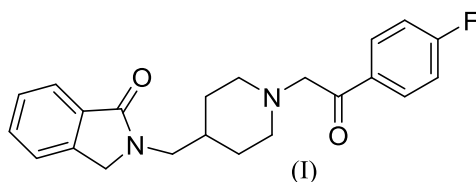
5. La forma cristalina de cualquiera de las reivindicaciones 1-4, en donde la forma (A) tiene picos de difracción de rayos X de polvo a aproximadamente 7,6, 14,3, 14,7 y 27,5 °2θ usando radiación Kα de Cu.

6. La forma cristalina de cualquiera de las reivindicaciones 1-5, en donde la forma (A) tiene picos de difracción de rayos X de polvo a aproximadamente 7,6, 14,3, 14,7, 18,6 y 27,5 °2θ usando radiación Kα de Cu.

7. La forma cristalina de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, en donde la forma (A) tiene picos de difracción de rayos X de polvo a aproximadamente 7,6, 14,3, 14,7, 14,9, 18,6, 27,5 y 30,1 °2θ usando radiación Kα de Cu.

8. La forma cristalina de cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en donde la forma (A) tiene picos de difracción de rayos X de polvo a aproximadamente 7,6, 11,2, 14,3, 14,7, 14,9, 18,6, 22,0, 25,9, 27,5 y 30,1 °2θ usando radiación Kα de Cu.

9. Una formulación farmacéutica que comprende el Compuesto (I);



en donde la formulación comprende un modificador de liberación que proporciona una concentración plasmática máxima ($C_{\max}$) del

Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O inferior a 50 ng/mL cuando se administra una dosis entre alrededor de 1-100 mg de la formulación a un humano.

10. La formulación farmacéutica de la reivindicación 9, donde el Compuesto (I) está presente como la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O.

11. La formulación farmacéutica de la reivindicación 10, que comprende alrededor de 10-75 mg del Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O.

12. La formulación farmacéutica de la reivindicación 10, que comprende alrededor de 15-65 mg del Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O.

13. La formulación farmacéutica de la reivindicación 10, que comprende alrededor de 16 mg, alrededor de 32 mg, alrededor de 40 mg, o alrededor de 64 mg del Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O.

14. La formulación farmacéutica de la reivindicación 10, en donde el modificador de liberación es una hipromelosa.

15. La formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-14, que comprende además un relleno, un fluidificante, y un lubricante.

16. La formulación farmacéutica de la reivindicación 15, en donde el relleno es celulosa microcristalina, lactosa, o una combinación de éstas.

17. La formulación farmacéutica de la reivindicación 15, en donde el fluidificante es sílice coloidal anhidra.

18. La formulación farmacéutica de la reivindicación 15, en donde el lubricante es estearato de magnesio, Kolliwax HCO, estearil fumarato sódico, o una combinación de estos.

19. La formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-18, en donde la formulación proporciona una concentración plasmática máxima (C_{max}) de BFB-520 inferior a 10,0 ng/mL, preferentemente inferior a 5,0 ng/mL.

20. La formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-19, en donde la formulación proporciona una concentración plasmática máxima (C_{max}) de BFB-999 inferior a 5,0 ng/mL.

21. La formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-20, en donde la formulación proporciona una AUC del Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O inferior a 400 hr*ng/mL.

22. La formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-21, en donde la formulación proporciona una AUC de BFB-520 inferior a 40 hr*ng/mL.

23. La formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-22, en donde la formulación proporciona una AUC de BFB-999 inferior a 40 hr*ng/mL.

24. La formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-23, en donde la formulación es adecuada para administración crónica.

25. La formulación farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 9-24, en donde la formulación está en una forma de liberación inmediata.

26. La formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-25, en donde la formulación está en una forma de liberación controlada.

27. La formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-26, en donde substancialmente toda la dosis administrada del Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O es liberada de la formulación farmacéutica a lo largo de 16-24 horas.

28. Un método para tratar una enfermedad o un trastorno neuropsiquiátrico, que comprende administrar una

cantidad terapéuticamente efectiva de la formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-27 a un sujeto que lo necesita.

29. El método de la reivindicación 28, en donde la enfermedad o el trastorno neuropsiquiátrico es esquizofrenia.

30. El método de la reivindicación 28 o 21, en donde la formulación farmacéutica es administrada una vez al día.

31. El método de cualquiera de las reivindicaciones 28-30, en donde la cantidad del Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O administrada está en el intervalo de alrededor de 1-100 mg.

32. El método de la reivindicación 31, en donde la cantidad del Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O administrada está en el intervalo de alrededor de 10-75 mg.

33. El método de la reivindicación 32, en donde la cantidad del Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del Compuesto (I)·HCl·2H₂O administrada está en el intervalo de alrededor de 15-65 mg.

34. El método de la reivindicación 31, en donde la cantidad del Compuesto (I) o la forma polimórfica (A) del

Compuesto (I)·HCl·2H₂O administrada es alrededor de 16 mg, alrededor de 32 mg, alrededor de 40 mg, o alrededor de 64 mg.

35. El método de la reivindicación 28, en donde por lo menos un síntoma de la esquizofrenia es tratado o mitigado.

36. El método de la reivindicación 35, en donde el síntoma está asociado con los síntomas negativos y/o positivos de la esquizofrenia, la función cognitiva, la arquitectura y continuidad del sueño y la función social.

37. El método de la reivindicación 28, en donde se trata por lo menos una condición o trastorno asociado con depresión.

38. Un método para tratar un trastorno del sueño, que comprende administrar una cantidad terapéuticamente efectiva de la formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-37 a un sujeto que lo necesita.

39. El método de la reivindicación 38, en donde se trata o se mitiga por lo menos un aspecto de trastorno del sueño.

40. El método de la reivindicación 39 en donde el por lo menos un aspecto de un trastorno del sueño se selecciona del período de tiempo del sueño, uno o más segmentos del

período de tiempo del sueño, continuidad general del sueño y arquitectura del sueño.

41. El método de la reivindicación 38, en donde el trastorno del sueño está asociado con esquizofrenia.

42. Un estuche que comprende la formulación farmacéutica de las reivindicaciones 9-41, e instrucciones de uso.