

REIVINDICACIONES

1. Una unidad de dispositivo de droga polimérica que comprende:
 - (i) un copolímero de bloque de poliuretano obtenido al reaccionar juntos:
 - 5 (a) un poli(óxido de alquileno);
 - (b) un compuesto difuncional;
 - (c) un isocianato difuncional; y
 - (d) opcionalmente un copolímero de bloque que comprende bloques de poli(óxido de alquileno); y
 - 10 (ii) quinagolida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, como un agente farmacéuticamente activo.
2. La unidad de dispositivo de droga polimérica de la reivindicación 1, en donde el poli(óxido de alquileno) es un polietilenglicol (PEG) o un propilenglicol (PPG).
- 15 3. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquiera de las reivindicaciones 2, en donde el propilenglicol tiene un peso molecular de 200 a 35000 g/mol o aproximadamente 2000 g/mol.
- 20 4. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquiera de la reivindicación 2, en donde el polietilenglicol tiene un peso molecular de 200 a 35000 g/mol o un peso molecular de aproximadamente 2000 g/mol.
5. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde el copolímero de bloque de poli(óxido de alquileno) comprende bloques de polietilenglicol y propilenglicol.
- 25

6. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde el compuesto difuncional se selecciona del grupo que consiste de dioles; diaminas; y amino alcoholes; opcionalmente, en donde el diol es un diol C₃ a C₂₀ o el compuesto difuncional se selecciona del grupo que consiste de: 1,4-butanediol; 1,5-pentanediol; 1,6-hexanediol; 1,10-decanediol; 1,12-dodecadeniol; y 1,16-hexadecanediol.
7. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde el isocianato difuncional es un diisocianato aromático o un diisocianato alifático; opcionalmente, en donde el isocianato difuncional es difenilmetano-4,4'-diisocianato, diciclohexilmetano-4,4'-diisocianato (DMDI) o diisocianato de hexametileno (HMDI).
8. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la proporción molar de los componentes (a) a (b) a (c) está en el rango de 0.05-0.75 a 1 a 1.00-2.00.
9. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la proporción de componentes (a) a (b) a (c) a (d) está en el rango de 0.05-0.7 a 1 a 1 a 1.00-2.00 a 0.01-0.50.
10. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde el dispositivo se obtiene al reaccionar juntos los componentes (a), (b), (c) y opcionalmente (d) en la presencia de un catalizador; opcionalmente, en donde el catalizador es un cloruro férrico y/o catalizadores a base de bismuto.
11. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la unidad de dispositivo de droga polimérica comprende uno o

más copolímeros de bloque de poliuretano, en donde el, o cada, copolímero de bloque de poliuretano se obtiene al reaccionar juntos:

- (a) un poli(óxido de alquileo);
- (b) un componente difuncional;
- 5 (c) un isocianato difuncional; y
- (d) opcionalmente un copolímero de bloque que comprende bloques de poli(óxido de alquileo).

12. La unidad de dispositivo de droga polimérica de la reivindicación 11, en donde
10 la unidad de dispositivo de droga polimérica comprende una estructura de polímero tipo monolítica o tipo matriz simple; una estructura de reservorio; una estructura por capas, cada capa comprende uno o más de los copolímeros de bloque de poliuretano; o una estructura de núcleo interno o capa y una capa externa, tapa, vaina, o recubrimiento.

15

13. La unidad de dispositivo de droga polimérica de la reivindicación 12, en donde la estructura o capa de núcleo interno se carga con quinagolida.

14. La unidad de dispositivo de droga polimérica de la reivindicación 12, en donde
20 la quinagolida está ausente de la capa externa o recubrimiento.

15. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde en uso, la liberación de quinagolida inicial se conforma a un cociente de liberación de entre 0.05 y 10, el cociente de liberación se calcula como
25 el porcentaje de liberación por un periodo inicial de 24 horas dividido por el porcentaje de liberación de quinagolida por un periodo posterior; opcionalmente en donde el porcentaje de liberación de quinagolida por un periodo posterior es el

porcentaje de liberación de quinagolida por el periodo de 7 a 14 días después de la administración.

16. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la unidad de dispositivo de droga polimérica comprende un polímero elástico, deformable/flexible y/o suave.

17. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la unidad de dispositivo de droga polimérica toma la forma de un anillo para inserción y/o ubicación dentro de la cavidad vaginal.

18. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la unidad de dispositivo de droga polimérica tiene un módulo elástico entre aproximadamente 5 y 100 MPa; opcionalmente donde el módulo elástico está entre aproximadamente 5 y 30 MPa, entre 10 y 20 MPa o entre aproximadamente 10 y 20 MPa cuando está en un estado hidratado.

19. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la unidad de dispositivo de droga polimérica comprende quinagolida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma a una dosis de aproximadamente 25 a aproximadamente 1500 microgramos μg ; opcionalmente en donde la unidad de dispositivo de droga polimérica comprende quinagolida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma a una dosis de aproximadamente 200 a 5000 μg , aproximadamente 400-1500 μg , aproximadamente 200 μg , aproximadamente 400 μg , aproximadamente 800 μg , aproximadamente 1200 μg , aproximadamente 2400 μg o aproximadamente 3000 μg de quinagolida.

20. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la unidad de dispositivo de droga polimérica suministra una liberación continua de quinagolida a los tejidos vaginales; opcionalmente, en donde la unidad de dispositivo de droga polimérica libera continuamente quinagolida por un periodo de aproximadamente 21, 28 o 35 días.
21. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde en uso, la unidad de dispositivo de droga polimérica libera entre aproximadamente 1 y aproximadamente 150 µg o 300 µg o entre aproximadamente 1 y aproximadamente 50 µg de quinagolida/día; opcionalmente, en donde la unidad de dispositivo de droga polimérica libera aproximadamente 5, aproximadamente 10, aproximadamente 15, aproximadamente 20 o aproximadamente 30 µg de quinagolida/día.
22. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la quinagolida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, se carga en la unidad de dispositivo de droga polimérica como una formulación granulada, por ejemplo, una formulación granulada húmeda.
23. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la quinagolida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma se formula con uno o más excipientes; opcionalmente, en donde los excipientes se seleccionan del grupo que consiste de celulosa, celulosa microcristalina, derivados de celulosa, etil celulosa, (hidroxipropil)metil celulosa (HPMC) e hidroxipropil celulosa (HPC), polisacáridos, algodón pre-gelatinizado y pululan, Zein y polivinilpirrolidona (PVP).

24. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la quinagolida se selecciona del grupo que consiste de quinagolida, una sal de quinagolida farmacéuticamente aceptable, clorhidrato de quinagolida, cualquier enantiómero activo, el enantiómero de clorhidrato de quinagolida con configuración absoluta 3S, 4aS, 10aR, el N-desetil metabolito de quinagolida y el N,N-didesetil metabolito de quinagolida.

25. La unidad de dispositivo de droga polimérica de cualquier reivindicación anterior, en donde la quinagolida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, se carga en el dispositivo usando un aditivo antiestático; opcionalmente, en donde el aditivo antiestático es sílice ahumada.

26. Un método para hacer una unidad de dispositivo de droga polimérica para la administración intravaginal de quinagolida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, dicho método comprende reaccionar juntos:

- (a) un poli(óxido de alquileo);
 - (b) un componente difuncional;
 - (c) un isocianato difuncional; y
 - (d) opcionalmente un copolímero de bloque que comprende bloques de poli(óxido de alquileo);
- para suministrar un copolímero de bloque; y
- cargar quinagolida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma en el copolímero de bloque de poliuretano.

27. El método de la reivindicación 26, en donde el copolímero de bloque de poliuretano se prepara por un proceso de extrusión reactiva o un proceso de lotes.

28. El método de la reivindicación 26 o 27, en donde la quinagolida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, se carga en el copolímero de bloque de poliuretano por medio de un proceso de extrusión de fusión en caliente.

5 29. El método de cualquiera de las reivindicaciones 26, 27 o 28, en donde la quinagolida se formula en gránulos antes de cargar.

30. Una unidad de dispositivo de droga polimérica de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25 o preparado por un método de acuerdo con cualquiera
10 de las reivindicaciones 26 a 29, para uso en el tratamiento y/o prevención de endometriosis.

31. Un método de tratamiento y/o prevención de endometriosis, dicho método comprende administrar a un sujeto en necesidad de la misma, una unidad de
15 dispositivo de droga polimérica de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25 o preparada por un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 26 a 29.

32. Uso de una unidad de dispositivo de droga polimérica de acuerdo con
20 cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25 o preparada por un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 26 a 29, en la fabricación de un medicamento para uso en el tratamiento y/o prevención de endometriosis.

33. La unidad de dispositivo de droga polimérica de la reivindicación 30, para el
25 uso de la reivindicación 30, en donde el tratamiento y/o prevención de endometriosis comprende un método en el cual la unidad dispositivo de droga se lleva intravaginalmente durante todo o parte del ciclo menstrual.

34. La unidad de dispositivo de droga polimérica de las reivindicaciones 30 o 31, para el uso de la reivindicación 30 o 31, en donde una nueva unidad de dispositivo de droga se administra al comienzo de cada nuevo ciclo menstrual.
- 5 35. El método de la reivindicación 34, en donde la unidad de dispositivo de droga se lleva durante todo o parte del ciclo menstrual.
36. El método de cualquiera de las reivindicaciones 31 o 34-35, en donde una nueva unidad de dispositivo de droga se administra al comienzo de cada nuevo ciclo
- 10 menstrual.
37. Un kit que comprende una o más unidades de dispositivo de droga polimérica de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 25 o preparada por un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 26 a 29; opcionalmente, en donde
- 15 el kit además comprende uno o más aplicadores y/o instrucciones para uso.
38. El kit de la reivindicación 37, en donde el aplicador facilita la inserción de la unidad de dispositivo de droga polimérica en una cavidad vaginal; opcionalmente en donde la o una unidad de dispositivo de droga polimérica del kit se pre-carga en
- 20 o sobre el aplicador.
39. N-desetil y/o N,N-didesetil de metabolitos de quinagolida para uso en el tratamiento o prevención de endometriosis.
- 25 40. Uso de N-desetil y/o N,N-didesetil de metabolitos de quinagolida en la fabricación de un medicamento para el tratamiento o la prevención de endometriosis.

41. Un método de tratamiento o prevención de endometriosis, dicho método comprende el paso de administrar a un sujeto en necesidad de la misma una cantidad terapéuticamente efectiva del N-desetil y/o N,N-didesetil de metabolitos de quinagolida.