

P-11529

Nuevo capítulo reivindicatorio

Abril 18, 2018

REIVINDICACIONES

1. Una composición farmacéutica en forma de un comprimido que se desintegra oralmente para la administración oral que comprende:

a. un corticosteroide o sal, solvato, éster o polimorfo farmacéuticamente aceptable adsorbido sobre el portador farmacéuticamente aceptable,

en donde el corticosteroide que actúa tópicamente se selecciona del grupo que consiste en budesonida, fluticasona, flunisolida, ciclesonida, mometasona, y beclometasona, y

en donde un portador farmacéuticamente aceptable se selecciona del grupo que consiste de celulosa microcristalina, celulosa microcristalina silicificada, almidón pregelatinizado, almidón de maíz, sílice coloidal, o silicato amorfo de magnesio y aluminio; y

b. microgránulos de dispersión rápida que comprenden un alcohol de azúcar o un sacárido, o una mezcla de los mismos y al menos un desintegrante,

en donde el corticosteroide está presente en una cantidad de 5% o menos en peso de la composición.

2. La composición farmacéutica de la reivindicación 1, en donde el portador farmacéuticamente aceptable para la adsorción de las partículas del fármaco de corticosteroide se elige del grupo que consiste en celulosa microcristalina, celulosa microcristalina silificada, almidón pregelatinizado, almidón de maíz, sílice coloidal o silicato de magnesio y aluminio amorfo.

3. La composición farmacéutica de la reivindicación 2, en donde el portador es celulosa microcristalina silificada.

4. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2 o 3, en donde los microgránulos de dispersión rápida comprenden alcohol de azúcar, o un sacárido, o una mezcla de este con al menos un desintegrante.

5. La composición farmacéutica de la reivindicación 4, en donde el alcohol de azúcar o sacárido y el desintegrante están presentes en una proporción de alcohol de azúcar o sacárido a desintegrante de entre 90:10 y 99:1.

6. La composición farmacéutica de la reivindicación 1, en donde dicho corticosteroide es fluticasona.

7. La composición farmacéutica de la reivindicación 1, en donde dicho corticosteroide es propionato de fluticasona.

8. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente se encuentra en una cantidad del 3 % o menos en peso en la composición.

9. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente se encuentra en una cantidad del 1,5% o menos en peso en la composición.

10. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente se encuentra en una cantidad del 1% o menos en peso en la composición.

11. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente se encuentra en una cantidad del 0,5% o menos en peso en la composición.

12. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente se encuentra en una cantidad de 4,5 mg en la composición.

13. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 o 5, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente se encuentra en una cantidad de 3 mg en la composición.

14. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 o 5, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente se encuentra en una cantidad de 1,5 mg en la composición.

15. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente se encuentra en una cantidad de 6 mg en la composición.

16. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 o 5, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente es propionato de fluticasona en el intervalo de entre 0,05 y 15 mg en la composición en un contenido de fármaco de entre el 0,16 % y el 5 % en peso de la composición.

17. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 o 5, en donde el corticosteroide que actúa tópicamente es propionato de fluticasona en el intervalo de entre 0,75 y 4,5 mg en la composición en un contenido de fármaco de entre el 0,25% y el 1,5% en peso en la composición.

18. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 o 5, donde el corticosteroide que actúa tópicamente es propionato de fluticasona en el intervalo de entre 0,05 y 18 mg en la composición en un contenido de fármaco de entre el 0,125% y el 5% en peso en la composición.

19. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17 o 18, en donde el corticosteroide se microniza con un tamaño de partícula de no más de 50 micrones.

20. La composición farmacéutica de la reivindicación 19, en donde el corticosteroide tiene un tamaño de partícula promedio de no más de 10 micrones.

21. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19 o 20, en donde la composición además comprende un agente adhesivo.

22. La composición farmacéutica de la reivindicación 21, en donde el agente adhesivo se selecciona del grupo que consiste en complejo de sulfato de aluminio y sucrosa, quitosán y derivados de estos, polivinilpirrolidona, metilcelulosa, hidroxipropilcelulosa, hidroxipropilmetilcelulosa, hidroxietilcelulosa, carboximetilcelulosa sódica, ácido poliacrílico reticulado, poliacrilatos reticulados, copolímeros de aminoalquilmetacrilato, polímeros de carbopol, gomas de polisacárido hidrofílico, maltodextrinas, pectinas, gomas xantanas, ácido algínico, ácidos algínicos modificados y combinaciones de estos.

23. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21 o 22, en donde el desintegrante se selecciona del grupo que consiste en crospovidona, glicolato de almidón sódico, carboximetilcelulosa reticulada y hidroxilpropilcelulosa poco sustituida.

24. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22 o 23, en donde el alcohol de azúcar o sacárido se selecciona del grupo que consiste en sucralosa, lactosa, sucrosa, maltosa, manitol, sorbitol, xilitol, maltitol y mezclas de estos.

25. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23 o 24, que además comprende un alcohol de azúcar o sacárido de flujo libre seleccionado del grupo que consiste en manitol secado por pulverización, lactosa secada por pulverización y combinaciones de estos.

26. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24 o 25, que además comprende un lubricante seleccionado del grupo que consiste en estearato de magnesio, ácido esteárico, estearil estearato de sodio, behenato de glicerilo y una mezcla de estos.

27. La composición farmacéutica sólida de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25 o 26, que además comprende al menos un agente antifúngico.

28. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25 o 26, que además comprende al menos un agente antiviral.

29. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27 o 28, en donde los microgránulos de dispersión rápida además comprenden un aditivo con una función dual y en donde la proporción de alcohol de azúcar o sacárido a desintegrante a aditivo de función dual es de entre 88:10:2 y 98,5:1:0,5.

30. La composición farmacéutica de la reivindicación 29, en donde el aditivo de función dual se selecciona del grupo que consiste en almidón pregelatinizado, hidroxipropilcelulosa y similares.

31. La composición farmacéutica de las reivindicaciones 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29 o 30, en donde el corticosteroide tiene un tamaño de partícula promedio inferior a 10 μm , los microgránulos de dispersión rápida tienen un tamaño de partícula promedio inferior a 300 μm y el alcohol de azúcar y/o sacárido tiene un tamaño de partícula promedio inferior a 30 μm .

32. La composición farmacéutica de la reivindicación 31, en donde el corticosteroide es propionato de fluticasona con un tamaño de partícula inferior a 5 micrones, el portador es celulosa microcristalina silificada, los microgránulos de dispersión rápida consisten de manitol y crospovidona, el alcohol de azúcar de flujo libre es manitol secado por pulverización y el lubricante es estearil fumarato de sodio.

33. Un método para preparar la composición farmacéutica de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31 o 32, que comprende las siguientes etapas:

- a) preparar los microgránulos de dispersión rápida;
- b) preparar una premezcla 1 a través de la mezcla del preparar compuestos farmacéuticamente, corticosteroide y deslizante;
- c) preparar la premezcla 2 a través de la mezcla del relleno, la premezcla 1 de la

etapa a, desintegrante y endulzantes;

d) preparar la mezcla compresible final a través de la mezcla de los microgránulos de dispersión rápida de la etapa a, lubricante, la premezcla 2 de la etapa c, relleno;

e) preparar el comprimido a través de la compresión de la mezcla de la etapa d.

34. El método de 33, que comprende las siguientes etapas:

a) preparar los microgránulos de dispersión rápida;

b) preparar una premezcla 1 a través de la mezcla de la celulosa microcristalina silificada, propionato de fluticasona micronizado y dióxido de silicio coloidal;

c) preparar la premezcla 2 a través de la mezcla de manitol, la premezcla 1 de la etapa a, crospovidona y polvo de sucralosa;

d) preparar la mezcla compresible final a través de la mezcla de los microgránulos de dispersión rápida de la etapa a, estearil fumarato de sodio, la premezcla 2 de la etapa c, alcohol de azúcar o manitol enjuagado;

e) preparar el comprimido a través de la compresión de la mezcla de la etapa d.

35. El método de la reivindicación 33, que comprende las siguientes etapas:

a) preparar los microgránulos de dispersión rápida;

b) preparar la premezcla 1 que comprende cargar una mezcladora con un cuarto del portador, corticosteroide, deslizante y otro cuarto del portador y mezclar los contenidos;

c) preparar la premezcla 2 que comprende cargar un granulador de alto cizallamiento con un relleno de flujo libre, la premezcla 1, la mitad restante del portador, desintegrante y endulzante y mezclar los contenidos;

d) preparar la mezcla compresible final que comprende cargar una mezcladora con la mitad de los gránulos de dispersión rápida de la etapa a, lubricante, la premezcla 2 de la etapa c y la mitad restante de los gránulos de dispersión rápida de la etapa a y mezclar;

e) preparar los comprimidos que se desintegran oralmente a través de la compresión de la mezcla compresible de la etapa d.

36. El método de la reivindicación 35, que comprende las siguientes etapas:

- a) preparar los microgránulos de dispersión rápida;
- b) preparar la premezcla 1 que comprende cargar una mezcladora con un cuarto de celulosa microcristalina silificada (SMCC), propionato de fluticasona micronizado, dióxido de silicio coloidal y otro cuarto de (SMCC) y mezclar;
- c) preparar la premezcla 2 que comprende cargar un granulador de alto cizallamiento con manitol secado por pulverización, la premezcla 1, la mitad restante de SMCC, crospovidona y polvo de sucralosa y mezclar;
- d) preparar la mezcla compresible final que comprende cargar una mezcladora V con la mitad de los gránulos de dispersión rápida de la etapa a, la premezcla 2 de la etapa c y la mitad restante de los gránulos de dispersión rápida de la etapa a y mezclar;
- e) preparar los comprimidos que se desintegran oralmente a través de la compresión de la mezcla compresible de la etapa d.

37. El método de la reivindicación 33, que comprende las siguientes etapas:

- a) preparar los microgránulos o granulado de dispersión rápida con un tamaño de partícula promedio de no más de 400 μm mediante la granulación de uno o más alcoholes de azúcar y/o sacáridos, donde cada uno tiene un diámetro de partícula promedio de no más de 30 μm , con un desintegrante en presencia de agua o una mezcla de alcohol y agua y luego secar el granulado;
- b) preparar una premezcla molida 1 a través de la mezcla del preparar compuestos farmacéuticamente, corticosteroide y deslizante en una mezcladora y luego moler a través de un molino de trituration equipado con un tamiz con una abertura de 30 mesh;
- c) preparar la premezcla molida 2 a través de la mezcla de la mitad del manitol de flujo libre, la premezcla 1 de la etapa b, desintegrante y endulzante en una mezcladora V y luego moler a través de un molino de trituration equipado con un tamiz con una abertura de 30 mesh y enjuagar el molino con la mitad restante del manitol de flujo libre;
- d) preparar la mezcla compresible a través de la mezcla de los microgránulos de dispersión rápida de la etapa a, lubricante, la premezcla molida 2 de la etapa c, manitol de flujo libre enjuagado;
- e) preparar los comprimidos que se desintegran oralmente a través de la compresión de la mezcla compresible de la etapa d.

38. El método de la reivindicación 37, que comprende las siguientes etapas:

a) preparar los microgránulos o granulado de dispersión rápida con un tamaño de partícula promedio de no más de 400 μm mediante la granulación de uno o más alcoholes de azúcar y/o sacáridos, donde cada uno tiene un diámetro de partícula promedio de no más de 30 μm , con crospovidona en presencia de agua o una mezcla de alcohol y agua y luego secar el granulado;

f) preparar una premezcla molida 1 a través de la mezcla de la celulosa microcristalina silificada, propionato de fluticasona micronizado y dióxido de silicio coloidal en una mezcladora y luego moler a través de un molino de trituración equipado con un tamiz con una abertura de 30 mesh;

g) preparar la premezcla molida 2 a través de la mezcla de la mitad del manitol de flujo libre, la premezcla 1 de la etapa b, crospovidona y polvo de sucralosa en una mezcladora V y luego moler a través de un molino de trituración equipado con un tamiz con una abertura de 30 mesh y enjuagar el molino con la mitad restante del manitol de flujo libre;

h) preparar la mezcla compresible a través de la mezcla de los microgránulos de dispersión rápida de la etapa a, estearil fumarato de sodio, la premezcla molida 2 de la etapa c, manitol de flujo libre enjuagado;

i) preparar los comprimidos que se desintegran oralmente a través de la compresión de la mezcla compresible de la etapa d.