

REIVINDICACIONES

1. Una composición farmacéutica oral estable caracterizada porque comprende una tableta recubierta que comprende:

a) un núcleo de tableta que comprende tesofensina, o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, en mezcla íntima con excipientes farmacéuticamente aceptables que consisten en hidroxipropilcelulosa, monohidrato de lactosa, croscarmelosa sódica, celulosa microcristalina, estearato de magnesio, y combinaciones de los mismos, y opcionalmente un solvente; y

b) una película de recubrimiento.

2. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque la tesofensina, medida como base libre, constituye del 0.30% al 0.70% en peso del peso total de la tableta recubierta, los excipientes farmacéuticamente aceptables constituyen del 96% al 98% en peso del peso total de la tableta recubierta, y la película de recubrimiento constituye del 2% al 3% en peso del peso total de la tableta recubierta.

3. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque comprende de 0.25 a 1 mg de Tesofensina, medida como base libre, por tableta recubierta.

4. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque el solvente se selecciona del grupo que consiste en agua y etanol, preferiblemente en donde el solvente ha sido evaporado a sequedad.

5. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque el núcleo de la tableta consiste en:

a) 90-98% en peso de monohidrato de lactosa y celulosa microcristalina, tal como 93-97%, tal como 95-96%;

b) 1-3% en peso de croscarmelosa sódica, tal como 1.5-2.5%;

c) 0.5-1.5% en peso de estearato de magnesio, tal como 0.75-1%; y

d) 0.5-1.5% en peso de hidroxipropilcelulosa, tal como 0.75-1.25%; y

e) tesofensina o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma.

6. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque el núcleo de la tableta consiste en:

a) 40-80% en peso de monohidrato de lactosa, tal como 40-70%, tal como 50-80%, tal como 60-70%, tal como 66-67%;

b) 20-50% en peso de celulosa microcristalina, tal como 20-40% tal como 25-35%;

c) 1-3% en peso de croscarmelosa sódica, tal como 1.5-2.5%;

d) 0.5-1.5% en peso de estearato de magnesio, tal como 0.75-1%;

e) 0.5-1.5% en peso de hidroxipropilcelulosa, tal como 0.75-1.25%;

f) tesofensina o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma.

7. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la película de recubrimiento comprende uno o más agentes seleccionados del grupo que consiste en agentes de recubrimiento, plastificantes, solventes, deslizantes

y pigmentos.

8. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 7, caracterizada porque el agente de revestimiento es hipromelosa.

9. La composición farmacéutica de conformidad con las reivindicaciones 7-8, caracterizada porque el plastificante es macrogol, preferiblemente un macrogol con un peso molecular mayor a 2,000, tal como macrogol 6,000.

10. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 7-9, caracterizada porque el deslizante es talco.

11. La composición farmacéutica de conformidad con una cualquiera de las reivindicaciones 7-10, caracterizada porque el pigmento se selecciona del grupo que consiste en óxido de titanio y óxido de hierro.

12. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 7-11, caracterizada porque el solvente se selecciona del grupo que consiste en agua y etanol, preferiblemente en donde el solvente se ha evaporado a sequedad.

13. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 7-12, caracterizada porque la película de recubrimiento comprende:

- a. 30-70% en peso de agente de recubrimiento, tal como 40-60%, tal como 45-55%;
- b. 2.5-10% en peso de plastificante, tal como 3-8%, tal como 4-6%;
- c. 20-40% en peso de pigmento, tal como 25-35%; y
- d. 10-20% de deslizante, tal como 12.5-17.5%.

14. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 7-12, caracterizada porque la película de recubrimiento comprende:

- a. 30-70% en peso de hipromelosa, tal como 40-60%, tal como 45-55%;
- b. 2.5-10% en peso de macrogol 6,000, tal como 3-8%, tal como 4-6%;
- c. 20-30% en peso de óxido de titanio;
- d. 2.5-7.5% en peso de óxido de hierro; y
- e. 10-20% de talco, tal como 12.5-17.5%.

15. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la película de recubrimiento comprende hipromelosa, dióxido de titanio, macrogol 6,000, talco, y óxido de hierro.

16. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque el núcleo de la tableta no comprende povidona (polivinilpirrolidona, PVP), crospovidona, (polivinilpolipirrolidona, PVPP), copovidona (copolímero de polivinilpirrolidona y acetato de vinilo), macrogol (polietilenglicol, PEG), o dióxido de titanio, y en donde opcionalmente el núcleo de la tableta no comprende dióxido de silicio coloidal.

17. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizada porque la sal de tesofensina farmacéuticamente aceptable es citrato de tesofensina.

18. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones

anteriores, caracterizada porque la tesofensina es el único principio activo.

19. La composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, la cual no comprende ningún beta-bloqueante.

20. Un procedimiento para preparar la composición de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, caracterizado porque comprende los pasos de:

a) formar un núcleo de tableta el cual comprende tesofensina, o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, y excipientes farmacéuticamente aceptables, en donde los excipientes farmacéuticamente aceptables consisten en hidroxipropilcelulosa, monohidrato de lactosa, croscarmelosa sódica, celulosa microcristalina, y estearato de magnesio; y

b) formar la tableta recubierta mediante el rociado de la película de recubrimiento sobre el núcleo de la tableta.

21. El método de conformidad con la reivindicación 20, caracterizado porque la tesofensina, medida como base libre, constituye de 0.30% a 0.70% en peso del peso total de la tableta recubierta, los excipientes farmacéuticamente aceptables constituyen de 96% a 98% en peso del peso total de la tableta recubierta, y la película de recubrimiento constituye de 2% a 3% en peso del peso total de la tableta recubierta.

22. El método de conformidad con la reivindicación 20, caracterizado porque cada tableta recubierta comprende de 0.25 a 1.0 mg de tesofensina, medida como base libre.

23. El método de conformidad con la reivindicación 20, caracterizado porque el núcleo de tableta se prepara mediante:

a) disolver tesofensina, o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, y un aglutinante en un líquido de granulación para obtener una mezcla líquida de granulación;

b) humedecer una carga con la mezcla líquida de granulación para formar un granulado humedecido;

c) secar y tamizar el granulado humedecido;

d) mezclar el granulado humedecido con desintegrante, carga/aglutinante, y lubricante para formar una mezcla final; y

e) formar núcleos de tabletas con la mezcla final.

24. El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 20 a 23, caracterizado porque el líquido de granulación comprende agua y etanol.

25. El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 20 a 24, caracterizado porque la película de recubrimiento comprende hipromelosa, macrogol 6000, dióxido de titanio, talco, y óxido de hierro.

26. El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 20 a 25, caracterizado porque el núcleo de la tableta no comprende povidona (polivinilpirrolidona, PVP), crospovidona, (polivinilpolipirrolidona, PVPP), copovidona (copolímero de polivinilpirrolidona y acetato de vinilo), macrogol (polietilenglicol, PEG), y dióxido de titanio, y en donde opcionalmente el núcleo de la tableta no comprende dióxido de silicio coloidal.

27. El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 20 a 25, caracterizado

porque la sal de tesofensina farmacéuticamente aceptable es citrato de tesofensina.

28. El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 20 a 27, caracterizado porque la tesofensina es el único principio activo en la tableta.

5 29. El método de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 20 a 28, caracterizado porque la tableta recubierta no comprende ningún beta-bloqueante.

30. El uso de la composición farmacéutica de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1-19, para preparar un medicamento para prevenir y tratar el sobrepeso y la obesidad, y comorbilidades asociadas.

10 31. El uso de conformidad con la reivindicación 30, en donde la comorbilidad asociada es diabetes mellitus tipo 2.

32. El uso de conformidad con la reivindicación 30 ó 31, en donde el medicamento comprende de 0.25 a 1.0 mg de tesofensina, medida como base libre, por tableta.