

Reivindicaciones

1. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea que comprende:

una cantidad terap3uticamente eficaz de al menos un inhibidor del canal TASK-1 y / o TASK-3 o
5 de un hidrato, solvato, polimorfo o metabolito del mismo o de una sal farmac3uticamente
aceptable del mismo en

>2.5% a 100% p/v de polietilenglicol y

gegebenenfalls mindestens einen Hilfsstoff,

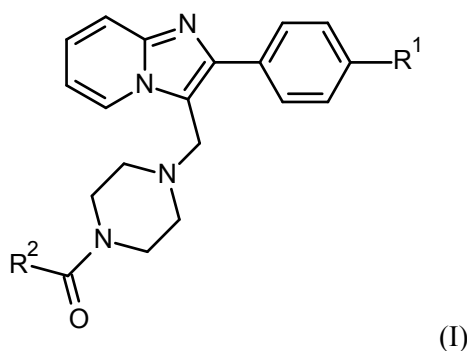
opcionalmente al menos un adyuvante,

10 donde la formulaci3n tiene un pH de 4 a 8.
2. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea de acuerdo con la
reivindicaci3n 1, en la que opcionalmente al menos un adyuvante se selecciona del grupo que
consiste en al menos un regulador de pH, al menos un solubilizante, al menos un antioxidante, al
menos un estabilizante, al menos un espesante, al menos un conservante, al menos una sustancia
15 reguladora de la tonicidad, al menos un aroma, al menos una fragancia y al menos un colorante.
3. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea de acuerdo con la
reivindicaci3n 1 o 2, en la que opcionalmente al menos un regulador de pH se selecciona del grupo
que consiste en 3cido c3trico y sus sales, 3cido ac3tico y sus sales y 3cido fosf3rico y sus sales,
3cido clorh3drico, 3cido b3rico, 3cidos carbox3licos, 3cidos bicarbox3licos, amino3cidos, 3cidos
20 oxocarbox3licos, 3cidos policarbox3licos, hidr3xido de sodio, hidr3xido de potasio, carbonato de
sodio, bicarbonato de sodio.
4. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea seg3n una de las
reivindicaciones 1 a 3, en la que opcionalmente al menos un solubilizante se selecciona del grupo
que consiste en etanol, polisorbato 20, polioxietileno(8)-estearato y polisorbato 80.
- 25 5. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea seg3n una de las
reivindicaciones 1 a 4, en la que opcionalmente al menos un antioxidante se selecciona del grupo
que consiste en 3cido c3trico, butilhidroxianisol, butilhidroxitolueno, EDTA y una fumigaci3n con
nitr3geno.
6. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea seg3n una de las
30 reivindicaciones 1 a 5, en la que opcionalmente al menos un conservante se selecciona del grupo

- 2 -

que consiste en C₈-C₁₈ cloruro dealconio, metilparabeno, propilparabeno, ácido sórbico, clorobutanol y cloruro de benzalconio.

7. Formulación farmacéutica estable para aplicación nasal o faríngea según una de las reivindicaciones 1 a 6, en la que la formulación contiene 5 a 100% p/v de polietilenglicol 400, 0 a 10% p/v de un solubilizantes, 0 a 95% p/v de un regulador de pH y opcionalmente al menos otro adyuvante.
8. Formulación farmacéutica estable para aplicación nasal o faríngea según una de las reivindicaciones 1 a 7, en la que al menos inhibidor del canal TASK-1 y / o TASK-3 se selecciona de un compuesto de la fórmula (I),



en la cual

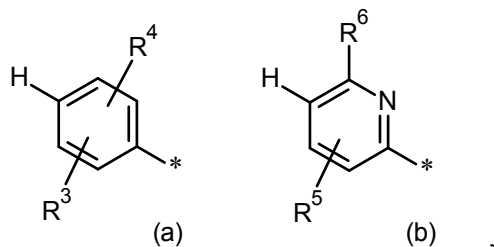
R¹ representa halógeno ciano, (C₁-C₄)-alquilo, ciclopropilo o ciclobutilo

y

R² representa (C₄-C₆)-cicloalquilo, en donde un grupo de anillo CH₂ se puede reemplazar por -O-,

o

representa un grupo fenilo de la fórmula (a) o un grupo piridilo de la fórmula (b)



donde * marca el enlace al grupo carbonilo adyacente y

R³ significa flúor, cloro, bromo, ciano, (C₁-C₃)-alquilo o (C₁-C₃)-alcoxi,

- 3 -

donde (C₁-C₃)-alquilo y (C₁-C₃)-alcoxi pueden ser sustituidos hasta tres veces con flúor,

R⁴ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo o metilo,

R⁵ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo o metilo

5 y

R⁶ significa hidrógeno, (C₁-C₃)-alcoxi, ciclobutiloxi, oxetano-3-iloxi, tetrahidrofuran-3-iloxi o tetrahidro-2*H*-piran-4-iloxi,

donde (C₁-C₃)-alcoxi puede ser sustituido hasta tres veces con flúor,

10 y un hidrato, solvato, polimorfo o metabolito del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

9. Formulación farmacéutica estable para aplicación nasal o faríngea según una de las reivindicaciones 1 a 8, en la que al menos inhibidor del canal TASK-1 y / o TASK-3 se selecciona de

15 (4-{[2-(4-clorofenil)imidazo[1,2-a]piridina-3-il]metil}piperazin-1-il)(6-metoxipiridina-2-il)metanona,

(4-{[2-(4-bromofenil)imidazo[1,2-a]piridina-3-il]metil}piperazin-1-il)(2-fluorofenil)-metanona,

(4-{[2-(4-bromofenil)imidazo[1,2-a]piridina-3-il]metil}piperazin-1-il)(ciclopentilo)-metanona, y

(4-{[2-(4-clorofenil)imidazo[1,2-a]piridina-3-il]metil}piperazin-1-il)(ciclopentilo)-metanona,

20 y un hidrato, solvato, polimorfo o metabolito del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10. 10. Formulación farmacéutica estable según una de las reivindicaciones 1 a 9, en la que al menos un inhibidor del canal TASK-1 y / o TASK-3 es (4-{[2-(4-clorofenil)imidazo[1,2-a]piridina-3-il]metil}piperazin-1-il)(6-metoxi-piridina-2-il)-metanona o es un hidrato, solvato, polimorfo o metabolito del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

- 25 11. Formulación farmacéutica estable para aplicación nasal o faríngea según una de las reivindicaciones 1 a 9 para el tratamiento y / o prevención de enfermedades.

12. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea seg3n una de las reivindicaciones 1 a 9 para el uso en un m3todo para el tratamiento y / o prevenci3n de trastornos respiratorios, trastornos respiratorios relacionados con el sue1o, apneas obstructivas del sue1o, apneas centrales del sue1o, ronquido, arritmias card3acas, arritmias, enfermedades neurodegenerativas, enfermedades neuroinflamatorias y trastornos neuroinmunol3gicos.
13. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea seg3n una de las reivindicaciones 1 a 9 para uso en un m3todo para el tratamiento y / o prevenci3n de trastornos respiratorios, trastornos respiratorios relacionados con el sue1o, apneas obstructivas del sue1o, apneas centrales del sue1o, ronquido, arritmias card3acas, arritmias, enfermedades neurodegenerativas, enfermedades neuroinflamatorias y trastornos neuroinmunol3gicos, en donde la aplicaci3n nasal o far3ngea se lleva a cabo por medio de aerosoles nasales, gotas nasales, soluciones nasales, inhaladores de polvo, nebulizadores, inhaladores con dosificador, geles semis3lidos.
14. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea seg3n una de las reivindicaciones 1 a 9 para uso en un m3todo para el tratamiento y / o prevenci3n de trastornos respiratorios, trastornos respiratorios relacionados con el sue1o, apneas obstructivas del sue1o, apneas centrales del sue1o, ronquido, arritmias card3acas, arritmias, enfermedades neurodegenerativas, enfermedades neuroinflamatorias y trastornos neuroinmunol3gicos, donde la duraci3n de la acci3n es de al menos 4 horas.
15. Formulaci3n farmac3utica estable para aplicaci3n nasal o far3ngea seg3n una de las reivindicaciones 1 a 9 para uso en un m3todo para el tratamiento y / o prevenci3n de apneas obstructivas del sue1o o ronquido, que comprende:
- una cantidad terap3uticamente eficaz del inhibidor del canal TASK-1 y / o TASK-3 4- {[2-(4-clorofenil)imidazo[1,2-a]piridina-3-il]metil}piperazin-1-il)(6-metoxipiridina-2-il)-metanona o un hidrato, solvato, polimorfo o metabolito del mismo o una sal farmac3uticamente aceptable del mismo en
- 20% a 100% p/v de PEG400 y
- 0 a 10% p/v de polisorbato 80 y 0 a 80% p/v de un tamp3n de fosfato, que tiene un pH de 7, y opcionalmente al menos otro adyuvante,
- donde la duraci3n de la acci3n de la formulaci3n farmac3utica estable despu3s de la administraci3n nasal o far3ngea es de al menos 5 horas.