

NOVEDAD DE LA INVENCION

Habiendo descrito la presente invención, se considera como novedad, y por lo tanto se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes:

5

REIVINDICACIONES

1. Una formulación farmacéutica de odevixibat, caracterizada porque comprende una pluralidad de partículas, en donde cada partícula tiene un tamaño de entre aproximadamente 0.1 y aproximadamente 1.5 mm y contiene odevixibat, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en una cantidad de aproximadamente 0.1% p/p a aproximadamente 5.0% p/p basado en el peso total de la partícula.

2. La formulación de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque cada partícula contiene odevixibat, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en una cantidad de aproximadamente 0.5% p/p a aproximadamente 2.0% p/p basado en el peso total de la partícula.

15 3. La formulación de conformidad con la reivindicación 1 o 2, caracterizada porque cada partícula contiene odevixibat, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en una cantidad de aproximadamente 0.5% p/p basado en el peso total de la partícula.

4. La formulación de conformidad con la reivindicación 1 o 2, caracterizada porque cada partícula contiene odevixibat, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en una cantidad de aproximadamente 1.5% p/p basado en el peso total de la partícula.

20 5. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizada porque cada partícula comprende un núcleo y una capa de recubrimiento que rodea el núcleo.

6. La formulación de conformidad con la reivindicación 5, caracterizada porque el núcleo no contiene odevixibat.

25 7. La formulación de conformidad con la reivindicación 5 o 6, caracterizada porque el núcleo comprende celulosa microcristalina.

8. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 5 a 7, caracterizada porque la capa de recubrimiento comprende odevixibat, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

30 9. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 5 a 8, caracterizada porque la capa de recubrimiento comprende además un polímero formador de película.

35 10. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 5 a 9, caracterizada porque la capa de recubrimiento se rocía sobre las partículas como una suspensión homogénea de odevixibat en agua.

11. La formulación de conformidad con la reivindicación 10, caracterizada porque la suspensión homogénea se prepara dispersando odeixibat en agua mediante molienda en húmedo.

12. La formulación de conformidad con la reivindicación 10 u 11, caracterizada porque la suspensión homogénea no contiene aglomerados de odeixibat mayores a 200 μm .

13. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 5 a 12, caracterizada porque la capa de recubrimiento no contiene un tensioactivo.

14. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizada porque las partículas tienen un tamaño de entre aproximadamente 0.1 y aproximadamente 1.0 mm.

15. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, caracterizada porque odeixibat está presente como un hidrato cristalino de odeixibat.

16. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15, caracterizada porque odeixibat está presente como modificación de cristal 1 de odeixibat.

17. La formulación de conformidad con la reivindicación 16, caracterizada porque la modificación de cristal 1 de odeixibat tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo (XRPD), obtenido con radiación $\text{CuK}\alpha 1$, con al menos picos específicos en las posiciones 2θ 5.6 ± 0.2 , 6.7 ± 0.2 y/o 12.1 ± 0.2 .

18. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17, caracterizada porque las partículas están contenidas en un sobre o cápsula.

19. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18, caracterizada porque es una formulación pediátrica.

20. La formulación de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, caracterizada porque es para su uso en el tratamiento o prevención de una enfermedad hepática.

21. La formulación de conformidad con la reivindicación 20, caracterizada porque la enfermedad hepática es una enfermedad dependiente de ácidos biliares.

22. La formulación de conformidad con la reivindicación 20, caracterizada porque la enfermedad hepática es la enfermedad hepática es la colestasis intrahepática familiar progresiva (PFIC).

23. La formulación de conformidad con la reivindicación 20, caracterizada porque la enfermedad hepática es la atresia biliar.

24. Un proceso para la preparación de la formulación farmacéutica de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, caracterizado porque comprende la etapa de preparar una suspensión acuosa homogénea de odeixibat.

25. El proceso de conformidad con la reivindicación 24, caracterizado porque la suspensión de recubrimiento se prepara dispersando odevixibat en agua mediante molienda en húmedo.

26. El proceso de conformidad con la reivindicación 24 u 25, caracterizado porque la suspensión de recubrimiento no contiene aglomerados de odevixibat mayores a 200 μm .

27. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 24 a 26, caracterizado porque la suspensión de recubrimiento no contiene un tensioactivo.

28. Un proceso para la preparación de la formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19, caracterizado porque comprende las etapas de

- a) humedecer odevixibat en agua usando un homogeneizador; y
- b) dispersar el odevixibat humedecido en agua mediante molienda en húmedo, obteniendo así una suspensión acuosa homogénea de odevixibat.

29. El proceso de conformidad con la reivindicación 18, caracterizado porque se añade un polímero formador de película a la suspensión obtenida en la etapa (b).

30. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 24 a 29, caracterizado porque odevixibat está presente como un hidrato cristalino de odevixibat.

31. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 24 a 29, caracterizado porque odevixibat está presente como modificación de cristal 1 de odevixibat.

32. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 31, caracterizado porque la modificación de cristal 1 de odevixibat tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo (XRPD), obtenido con radiación $\text{CuK}\alpha 1$, con al menos picos específicos en las posiciones 2θ 5.6 ± 0.2 , 6.7 ± 0.2 y/o 12.1 ± 0.2 .

33. Una formulación caracterizada porque es obtenida por el proceso de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 24 a 32.