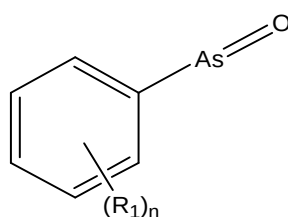


Reivindicaciones

1. Se da a conocer una composición farmacéutica que comprende un inhibidor micromolecular de PI4KIII α y un vehículo farmacéuticamente aceptable, en el que el vehículo farmacéuticamente aceptable comprende un lípido.

2. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 1, en la que dicho inhibidor micromolecular de PI4KIII α es PAO o un derivado de PAO.

3. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 1, en la que dicho inhibidor micromolecular de PI4KIII α tiene una estructura mostrada en la fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma,



Fórmula (I)

Donde, R₁ se selecciona cada uno individualmente del grupo que consiste en H, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, amino, carbamoilo, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, -As(O), N-(alquilo C₁₋₆)amino, N, N-(alquilo C₁₋₆)₂amino, -NH-C(O)-R₂, -NH-S(O)₂-R₃, -C(O)OR₄ o heterociclilo, donde n es un número entero entre 0 y 5, R₂ y R₃ se seleccionan cada uno individualmente de H, amino, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, N-(C₁₋₆alquilo)amino, N, N-(alquilo C₁₋₆)₂amino, -C(O)OR₄, cicloalquilo C₃₋₆, grupo aromático de 6-12 miembros o heterociclilo de 3-6 miembros, y está opcionalmente sustituido con halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, amino, carbamoilo, aromático, alquilo C₁₋₆, alquínilo C₂₋₆, alquenilo C₂₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, heterociclilo de 3-6 miembros, cicloalquilo C₃₋₆ o Bn-O-, y R₄ es alquilo C₁₋₆.

4. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 3, en la que dicho R₁ se selecciona cada uno individualmente del grupo que consiste en H, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, amino, carbamoilo, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, -As(O), N-(alquilo C₁₋₆)amino, N, N-(alquilo C₁₋₆)₂amino o -C(O)OR₄, donde n es un número entero entre 0 y 2, y R₄ es alquilo C₁₋₆.

5. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 3, en la que dicho R₁ se selecciona cada uno individualmente del grupo que consiste en H, halógeno, nitro, ciano, hidroxilo, amino, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆ o -As(O), donde n es un número entero entre 0 y 2.

6. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 3, en la que dicho R₁ se selecciona cada uno individualmente del grupo que consiste en H, halógeno, amino, alcoxi C₁₋₆, donde n es 1.

7. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 6, en la que dicho R₁ se encuentra en la posición adyacente u opuesta al grupo -As(O).

8. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 3, en la que dicho R₁ es H.

9. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 1, en la que el contenido de dicho inhibidor micromolecular de PI4KIII α en la composición farmacéutica es de 0,01-20 mg/g, 0,05-20 mg/g, 0,1-20 mg/g, 0,2-20 mg/g, 0,5-20 mg/g, 0,8-20 mg/g, 1-20 mg/g, 1-18 mg/g, 1-16 mg/g, 1-14 mg/g, 1-12 mg/g, 1-10 mg/g, 2-10 mg/g, 2-8 mg/g, 2-6 mg/g, 3-6 mg/g, 0,2-15 mg/g, 0,2-12 mg/g, 0,2-10 mg/g, 0,2-8 mg/g, 0,2-6 mg/g, 0,2-4 mg/g, 0,2-2 mg/g, 0,2-1 mg/g o 0,2-0,8 mg/g.

10. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 1, en la que dicho vehículo farmacéuticamente aceptable comprende al menos alrededor del 50 % (en peso), al menos alrededor del 60 % (en peso), al menos alrededor del 70 % (en peso), al menos alrededor del 80 % (en peso), al menos alrededor del 85 % (en peso), al menos alrededor del 90 % (en peso), al menos alrededor del 95 % (en peso), al menos alrededor del 97 % (en peso), al menos alrededor del 98 % (en peso), al menos alrededor del 99 % (en peso) o 100 % (en peso) de lípido.

11. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho lípido comprende un lípido que tiene un punto de fusión de -20-80 °C, -20-10 °C o -20-0 °C.

12. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho lípido tienen una insaturación de 0-5, 0-4, 0-3, 0-2, 0-1 o 0.

13. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho lípido comprende un lípido que tiene una longitud de cadena de carbono de ácido graso en el rango de 4-24, 4-22, 4-20, 6-20, 6-16, 6-14, 6-13, 6-12, 8-13, 8-12 u 8-10 átomos de carbono en el lípido.

14. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho lípido comprende un lípido que tiene una longitud de cadena de ácido graso de 8 y 10 en el lípido, y opcionalmente comprende además un lípido que tiene una longitud de cadena de ácido graso de 12-22 en el lípido.

15. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que la porción de cadena de ácido graso de dicho lípido es un ácido graso de cadena larga, un ácido graso de cadena media o un ácido graso de cadena corta.

16. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 1, en la que dicho lípido es un aceite vegetal.

17. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 16, en la que dicho aceite vegetal es aceite de oliva, aceite de árbol de té, aceite de semilla de colza, aceite de cacahuete, aceite de soja, aceite de maíz, aceite de cártamo, aceite de maní, aceite de girasol, aceite de canola, aceite de nuez, aceite de almendra, aceite de aguacate, aceite de ricino, aceite de coco, aceite de semilla de algodón, aceite de salvado de arroz, aceite de sésamo, aceite de palma refinado o una mezcla de los mismos.

18. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho lípido es ácido graso, éster de ácido graso, alcohol graso, lipóide, parafina o una mezcla de los mismos.

19. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 18, en la que dicho lipóide es fosfolípido, éster de sacarosa, esteroide, vitamina liposoluble o una mezcla de los mismos.

20. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 18, en la que dicho éster de ácido graso es éster de glicerol, éster de glicol, éster de propilenglicol o una mezcla de los mismos.

21. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 18, en la que dicho éster de ácido graso es monoéster, diéster, triglicérido o una mezcla de los mismos.

22. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 18, en la que dicho éster de ácido graso comprende éster de glicerol del ácido caprílico y/o cáprico.

23. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 18, en la que dicho éster de ácido graso comprende el triglicérido de cadena media.

24. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho vehículo farmacéuticamente aceptable comprende además un antioxidante.

25. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 24, en la que dicho antioxidante representa el 0,001-5 % (en peso), 0,005-5 % (en peso), 0,01-5 % (en peso), 0,05-5 % (en peso), 0,1-5 % (en peso), 0,1-3 % (en peso), 0,1-2 % (en peso), 0,1-1 % (en peso), 0,1-0,8 % (en peso), 0,1-0,5 % (en peso), 0,1-0,3 % (en peso), 0,3-2 % (en peso), 0,5-2 % (en peso), 0,8-2 % (en peso) o 1-2 % (en peso) de dicha composición farmacéutica.

26. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 24, en la que dicho antioxidante es sulfito, bisulfito, pirosulfito, ditiocarbamato, ácido ascórbico, palmitato de ácido anticíclico, hidroximarina, vitamina E, etanolamina, galato de propilo, butilhidroxianisol (BHA), butilhidroxitolueno (BHT), ácido nordihidroguayarático o glutatión.

27. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho vehículo farmacéuticamente aceptable comprende además un modificador de viscosidad, modificador de pH o modificador del sabor.

28. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicho vehículo farmacéuticamente aceptable comprende además etanol.

29. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 28, en la que el contenido de etanol es del 10-0,1 % (en volumen).

30. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 28, en la que el contenido de etanol es del 8-0,1 % (en volumen), 7-0,1 % (en volumen), 6-0,1 % (en volumen), 5-0,1 % (en volumen), 4-0,1 % (en volumen), 3-0,1 % (en volumen), 2-0,1 % (en volumen), 1,5-0,1 % (en volumen), 1,2-0,1 % (en volumen), 8-0,3 % (en volumen), 8-0,5 % (en volumen), 8-0,7 % (en volumen), 8-0,9 % (en volumen), 8-1 % (en volumen), 6-0,3 % (en volumen), 5-0,5 % (en volumen), 4-0,8 % (en volumen), 3-0,9 % (en volumen) o 2-1 % (en volumen).

31. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicha composición farmacéutica es para administración oral, subcutánea, intramuscular o intravenosa.

32. La composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en la que dicha composición farmacéutica es en forma de comprimido, cápsula, suspensión, emulsión, solución, preparación semisólida, parche o microaguja.

33. La composición farmacéutica descrita en la reivindicación 1, en la que dicho inhibidor micromolecular de PI4KIII α es óxido de fenilarsénico, el contenido de óxido fenilarsénico en la composición farmacéutica es de 0,25-20 mg/g y dicho vehículo farmacéuticamente aceptable consiste en triglicéridos de cadena media, en triglicéridos de cadena media y triglicéridos de cadena larga o en triglicéridos de cadena media y etanol.

34. Un método para preparar la composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-33, dicho método comprende: mezclar dicho inhibidor micromolecular de PI4KIII α y dicho vehículo farmacéuticamente aceptable para obtener una mezcla.

35. Según el método descrito en la reivindicación 34, dicho método comprende: mezclar dicho inhibidor micromolecular de PI4KIII α y dicho vehículo farmacéuticamente aceptable mediante fuerza mecánica.

36. Según el método descrito en la reivindicación 35, dicha fuerza mecánica es agitación, dispersión, oscilación o tratamiento ultrasónico.

37. Según el método descrito en la reivindicación 34, dicho método comprende: mezclar dicho inhibidor micromolecular de PI4KIII α y dicho vehículo farmacéuticamente aceptable después de fundir dicho vehículo farmacéuticamente aceptable mediante calentamiento.

38. Según el método descrito en la reivindicación 37, dicho método comprende además: filtrar dicha mezcla.

39. Un método para tratar la enfermedad relacionada con PI4KIII α en un sujeto, dicho método comprende administrar a un sujeto que lo necesita la composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones 1-33.

40. Según el método descrito en la reivindicación 39, dicha enfermedad relacionada con PI4KIII α es el mal de Alzheimer.

41. Según el método descrito en la reivindicación 39, dicho sujeto es un animal como cerdo, perro, mono, gato, ratón, rata o un ser humano.

42. El uso de la composición farmacéutica descrita en cualquiera de las reivindicaciones 1-33 en la preparación de medicamentos para el tratamiento de la enfermedad relacionada con PI4KIII α en un sujeto.

43. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-33 se utiliza para tratar la enfermedad relacionada con PI4KIII α en un sujeto.