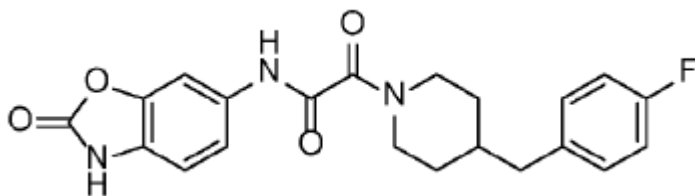


REIVINDICACIONES

1. Una composición farmacéuticamente aceptable formulada para la administración oral de un compuesto de Fórmula I:



5 Fórmula I

que comprende:

aproximadamente 0,5 % en peso a aproximadamente 15 % en peso del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición;

al menos un relleno;

10 un desintegrante;

un aglutinante, y

un tensioactivo.

2. La composición farmacéuticamente aceptable de la reivindicación 1, que comprende
15 aproximadamente 1 % en peso del compuesto basado en el peso total de la composición farmacéuticamente aceptable.

3. La composición farmacéuticamente aceptable de la reivindicación 1, que comprende
20 aproximadamente 10 % en peso del compuesto basado en el peso total de la composición farmacéuticamente aceptable.

4. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 1-3, que comprende una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I.

5. La composición farmacéuticamente aceptable de la reivindicación 4, en donde la forma
25 cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 7,8, 22,0, 23,7, 27,0 y $27,6 \pm 0,2^\circ 2\theta$.

6. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-5, en donde la
composición farmacéutica comprende aproximadamente del 10 % en peso a aproximadamente el 80 % en peso de al menos un relleno basado en el peso total de la composición farmacéutica.

30 7. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-6, en donde el al menos un relleno se selecciona del grupo que consiste en azúcar glas, azúcar comprimible, dextratos,

dextrina, dextrosa, lactosa, manitol, celulosa microcristalina, celulosa en polvo, sorbitol, sacarosa, talco y combinaciones de los mismos.

8. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-7, en donde la composición comprende dos rellenos.

9. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-8, en donde la composición farmacéutica comprende aproximadamente del 1 % en peso a aproximadamente el 10 % en peso del desintegrante basado en el peso total de la composición farmacéutica.

10. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-9, en donde el desintegrante se selecciona del grupo que consiste en crospovidona, croscarmelosa sódica, glicolato de almidón sódico, celulosa microcristalina, almidón pregelatinizado y combinaciones de los mismos.

11. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-10, en donde la composición farmacéutica comprende aproximadamente del 1 % en peso a aproximadamente el 10 % en peso del aglutinante basado en el peso total de la composición farmacéutica.

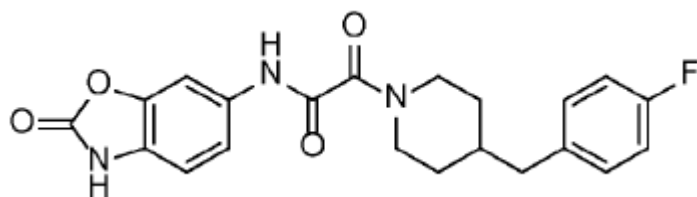
12. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-11, en donde el aglutinante se selecciona del grupo que consiste en povidona, almidón, gelatina, azúcares, gomas naturales y sintéticas, alginatos, óxido de polietileno, polietilenglicol, sales de calcio inorgánicas, ácido silícico, polimetacrilatos, ceras, agua, alcohol y combinaciones de los mismos.

13. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-12, en donde la composición farmacéutica comprende aproximadamente el 0,01 % en peso a aproximadamente el 5 % en peso del tensioactivo basado en el peso total de la composición farmacéutica.

14. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-13, en donde el tensioactivo se selecciona del grupo que consiste en estearatos de polioxietileno, éteres de polioxietileno alquílicos, ésteres de ácidos grasos de sorbitán, poloxámeros, derivados de aceite de ricino de polioxietileno, fosfolípidos, laurilsulfato de sodio, polisorbato (ésteres de ácidos grasos de polioxietileno de sorbitán) y combinaciones de los mismos.

15. La composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-14, en donde la composición es un gránulo para una solución oral.

16. Una composición sólida farmacéuticamente aceptable formulada para la administración oral de un compuesto de Fórmula I:



Fórmula I

que comprende:

aproximadamente 10 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 7,8, 22,0, 23,7, 27,0 y $27,6 \pm 0,2^\circ 2\theta$;

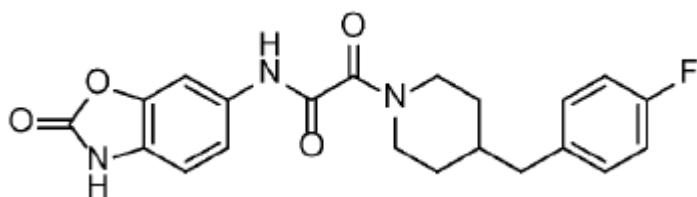
aproximadamente del 50 % al 80 % en peso de un relleno seleccionado del grupo que consiste en manitol, celulosa microcristalina y una combinación de los mismos, basado en el peso total de la composición;

aproximadamente 5 % en peso de crospovidona basado en el peso total de la composición;

aproximadamente 4 % de povidona basado en el peso total de la composición; y

aproximadamente 1 % de un polisorbato basado en el peso total de la composición.

17. Una composición sólida farmacéuticamente aceptable formulada para la administración oral de un compuesto de Fórmula I:



Fórmula I

que comprende:

aproximadamente 1 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 7,8, 22,0, 23,7, 27,0 y $27,6 \pm 0,2^\circ 2\theta$;

aproximadamente del 70 % al 89 % en peso de un relleno seleccionado del grupo que consiste en manitol, celulosa microcristalina y una combinación de los mismos, basado en el peso total de la composición;

aproximadamente 5 % en peso de crospovidona basado en el peso total de la composición;

aproximadamente 4 % de povidona basado en el peso total de la composición; y

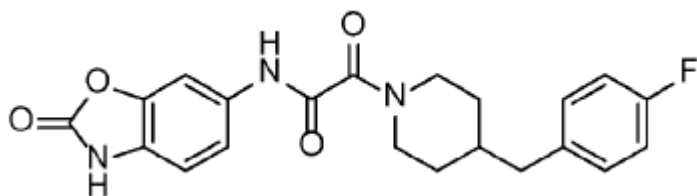
aproximadamente 1 % de un polisorbato basado en el peso total de la composición.

18. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 1-17, que comprende no más de aproximadamente 0,1 % a 0,5 % de una impureza con respecto a la cantidad del compuesto medida por HPLC.

19. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 1-18, que comprende no más de aproximadamente 0,1 % a 0,5 % de 6-amino-2-benzoxazolona con

respecto a la cantidad del compuesto medida por HPLC.

20. Una composición farmacéuticamente aceptable formulada para la administración oral de un compuesto de Fórmula I:



5 Fórmula I

que comprende:

aproximadamente 0,5 % a 15 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 7,8, 22,0, 23,7, 27,0 y $27,6 \pm 0,2^\circ 2\theta$;

no más de aproximadamente 0,1 % a 0,5 % de una impureza con respecto a la cantidad del compuesto medida por HPLC; y

uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables.

21. La composición farmacéuticamente aceptable de la reivindicación 20, que comprende no más de aproximadamente 0,5 % de una impureza con respecto a la cantidad del compuesto medida por HPLC.

22. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 20 o 21, que comprende no más de aproximadamente 0,05 % de una impureza con respecto a la cantidad del compuesto medida por HPLC.

23. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 1-22, que comprende no más de aproximadamente el 0,5 % de una impureza con respecto a cuando se expone a una humedad relativa del 60 % a 25 °C durante aproximadamente 6 meses.

24. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 1-23, que comprende no más de aproximadamente el 0,05 % de una impureza con respecto a cuando se expone a una humedad relativa del 60 % a 25 °C durante aproximadamente 6 meses.

25. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 1-24, que comprende no más de aproximadamente el 0,5 % de una impureza con respecto a cuando se expone a una humedad relativa del 60 % a 25 °C durante aproximadamente 36 meses.

26. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 1-25, que comprende no más de aproximadamente el 0,05 % de una impureza con respecto a cuando se expone a una humedad relativa del 60 % a 25 °C durante aproximadamente 36 meses.

27. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 18-26, que comprende aproximadamente el 10 % de la forma cristalina anhidra basada en el peso total de la composición.

28. La composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 18-26, que comprende aproximadamente el 1 % de la forma cristalina anhidra basada en el peso total de la composición.

29. La composición de cualquiera de las reivindicaciones 1-28, en donde la composición libera al menos el 80 % del compuesto después de 30 minutos cuando la composición se prueba en 900 ml de solución de lauril sulfato de sodio en agua usando un aparato de paleta USP II a 37 °C, con una velocidad de paleta de 75 rpm.

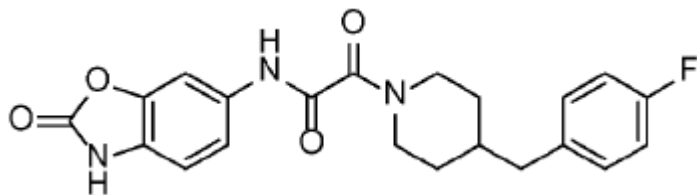
30. La composición de cualquiera de las reivindicaciones 1-29, en donde la composición libera al menos el 80 % del compuesto cuando la composición se agita en un medio acuoso desde al menos 1 minuto hasta aproximadamente 24 horas después de la reconstitución.

31. La composición de la reivindicación 30, en donde el medio acuoso comprende una suspensión a base de almidón.

32. Una suspensión acuosa farmacéuticamente aceptable que comprende la composición farmacéuticamente aceptable de cualquiera de las reivindicaciones 1-31 y un medio acuoso.

33. La suspensión farmacéuticamente aceptable de la reivindicación 32, en donde el medio acuoso comprende una suspensión a base de almidón.

34. Una suspensión acuosa farmacéuticamente aceptable para administrar por vía oral aproximadamente de 0,1 mg/kg a 2 mg/kg de un compuesto de Fórmula I:



Fórmula I

que comprende:

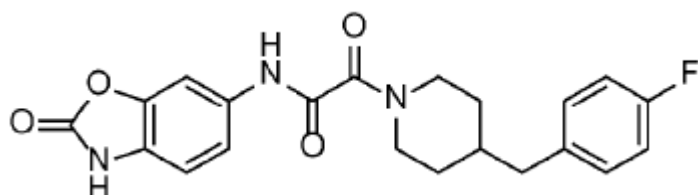
(i) una composición sólida farmacéuticamente aceptable que comprende:

aproximadamente 10 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 7,8, 22,0, 23,7, 27,0 y $27,6 \pm 0,2^\circ 2\theta$;

aproximadamente del 50 % al 80 % en peso de un relleno seleccionado del grupo que consiste en manitol, celulosa microcristalina y una combinación de los mismos, basado en el peso total de la composición;

aproximadamente 5 % en peso de crospovidona basado en el peso total de la composición;
 aproximadamente 4 % de povidona basado en el peso total de la composición; y
 aproximadamente 1 % de un polisorbato basado en el peso total de la composición; y
 (ii) un medio acuoso.

- 5 35. Una suspensión acuosa farmacéuticamente aceptable para administrar por vía oral aproximadamente de 0,2 mg/kg a 2 mg/kg de un compuesto de Fórmula I:



Fórmula I

(i) una composición sólida farmacéuticamente aceptable que comprende:

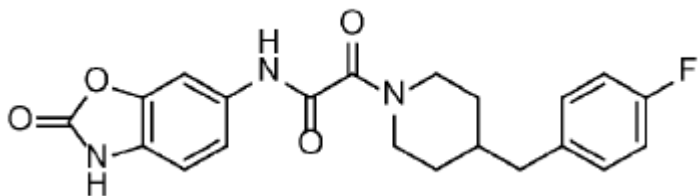
- 10 aproximadamente 1 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 7,8, 22,0, 23,7, 27,0 y $27,6 \pm 0,2^\circ 2\theta$;

- 15 aproximadamente del 70 % al 89 % en peso de un relleno seleccionado del grupo que consiste en manitol, celulosa microcristalina y una combinación de los mismos, basado en el peso total de la composición;

- aproximadamente 5 % en peso de crospovidona basado en el peso total de la composición;
 aproximadamente 4 % de povidona basado en el peso total de la composición; y
 aproximadamente 1 % de un polisorbato basado en el peso total de la composición; y
 20 (ii) un medio acuoso.

36. La suspensión farmacéuticamente aceptable de la reivindicación 34 o 35, en donde el medio acuoso comprende una suspensión a base de almidón.

37. Una composición sólida farmacéuticamente aceptable formulada para la administración oral de un compuesto de Fórmula I:

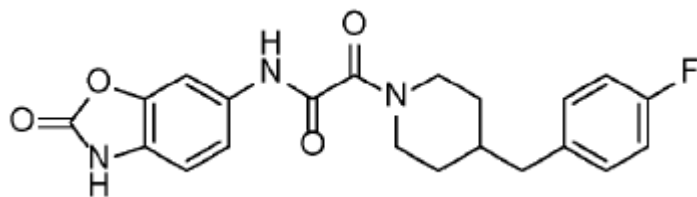


Fórmula I

que comprende: aproximadamente 10 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un

patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 6,4, 13,7, y $25,8 \pm 0,2^\circ$ 2θ ; aproximadamente del 50 % al 80 % en peso de un relleno seleccionado del grupo que consiste en manitol, celulosa microcristalina y una combinación de los mismos, basado en el peso total de la composición; aproximadamente 5 % en peso de crospovidona basado en el peso total de la composición; aproximadamente 4 % de povidona basado en el peso total de la composición; y aproximadamente 1 % de un polisorbato basado en el peso total de la composición.

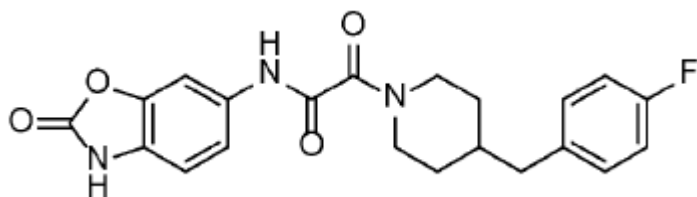
38. Una composición sólida farmacéuticamente aceptable formulada para la administración oral de un compuesto de Fórmula I:



Fórmula I

que comprende: aproximadamente 1 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 6,4, 13,7, y $25,8 \pm 0,2^\circ$ 2θ ; aproximadamente del 70 % al 89 % en peso de un relleno seleccionado del grupo que consiste en manitol, celulosa microcristalina y una combinación de los mismos, basado en el peso total de la composición; aproximadamente 5 % en peso de crospovidona basado en el peso total de la composición; aproximadamente 4 % de povidona basado en el peso total de la composición; y aproximadamente 1 % de un polisorbato basado en el peso total de la composición.

39. Una composición farmacéuticamente aceptable formulada para la administración oral de un compuesto de Fórmula I:



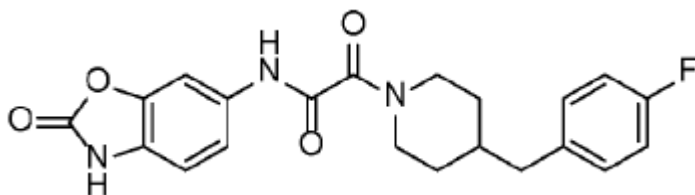
Fórmula I

que comprende: aproximadamente 0,5 % a 15 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de polvo de rayos X con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 6,4, 13,7, y $25,8 \pm 0,2^\circ$ 2θ ; no más de

aproximadamente 0,1% a 0,5% de una impureza (p. ej., 6-amino-2-benzoxazolona) con respecto a la cantidad del compuesto medida por HPLC; y uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables.

40. Una suspensión acuosa farmacéuticamente aceptable para administrar por vía oral

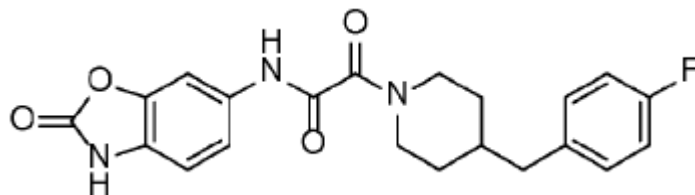
5 aproximadamente de 0,1 mg/kg a 2 mg/kg de un compuesto de Fórmula I:



Fórmula I

que comprende: (i) una composición sólida farmacéuticamente aceptable que comprende: aproximadamente 10 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 6,4, 13,7, y $25,8 \pm 0,2^\circ$ 2θ ; aproximadamente del 50 % al 80 % en peso de un relleno seleccionado del grupo que consiste en manitol, celulosa microcristalina y una combinación de los mismos, basado en el peso total de la composición; aproximadamente 5 % en peso de crospovidona basado en el peso total de la composición; aproximadamente 4 % de povidona basado en el peso total de la composición; y aproximadamente 1 % de un polisorbato basado en el peso total de la composición; y (ii) un medio acuoso.

41. Una suspensión acuosa farmacéuticamente aceptable para administrar por vía oral aproximadamente de 0,2 mg/kg a 2 mg/kg de un compuesto de Fórmula I:



Fórmula I

(i) una composición sólida farmacéuticamente aceptable que comprende: aproximadamente 1 % en peso de una forma cristalina anhidra del compuesto de Fórmula I basado en el peso total de la composición, en donde la forma cristalina anhidra tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con picos característicos entre y que incluyen los siguientes valores de 2θ en grados: 6,4, 13,7, y $25,8 \pm 0,2^\circ$ 2θ ; aproximadamente del 70 % al 89 % en peso de un relleno seleccionado del grupo que consiste en manitol, celulosa microcristalina y una combinación de los mismos, basado en el peso total de la composición; aproximadamente 5 % en peso de crospovidona basado en el peso

total de la composición; aproximadamente 4 % de povidona basado en el peso total de la composición; y aproximadamente 1 % de un polisorbato basado en el peso total de la composición; y (ii) un medio acuoso.

- 5 42. Un método para tratar un trastorno convulsivo en un sujeto que lo necesita, que comprende administrar al sujeto la composición farmacéutica de cualquiera de las reivindicaciones 1-31 y 37-39, o la suspensión de cualquiera de las reivindicaciones 32-36 y 40-41.
43. El método de la reivindicación 42, en donde el trastorno convulsivo es epilepsia.
44. El método de la reivindicación 42 o 43, en donde el sujeto es un sujeto pediátrico.
- 10 45. El método de cualquiera de las reivindicaciones 42-44, en donde el trastorno convulsivo es el síndrome de espasmo infantil.