

Se reivindica:

1. Una composición de cápsula oral que comprende
3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-
2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-
5 (4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-
1-il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-
c]piridina-5-carbonil]indol-1-il]-2-
metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona, o
una sal farmacéuticamente aceptable de este; y
10 un modificador de pH.
2. La composición como se reivindica en la
reivindicación 1, en donde el modificador de pH se
selecciona del grupo que consiste en carbonato de calcio,
carbonato de magnesio, bicarbonato de sodio, carbonato de
15 sodio, hidróxido de magnesio, hidróxido de calcio, óxido
de magnesio y una mezcla de estos.
3. La composición como se reivindica en la
reivindicación 2, en donde el modificador de pH se
selecciona del grupo que consiste en carbonato de calcio,
20 carbonato de calcio anhidro, bicarbonato de sodio,
bicarbonato de sodio anhidro, carbonato de sodio,
carbonato de sodio anhidro, hidróxido de magnesio e
hidróxido de magnesio anhidro.
4. La composición como se reivindica en la
25 reivindicación 2, en donde el modificador de pH es anhidro.

5. La composición como se reivindica en la reivindicación 2, en donde el modificador del pH es bicarbonato de sodio.

6. La composición como se reivindica en la
5 reivindicación 5, en donde el modificador de pH es bicarbonato de sodio anhidro.

7. La composición como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la composición comprende

10 3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-
2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-
(4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-
1-il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-
c]piridina-5-carbonil]indol-1-il]-2-
15 metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona; y
bicarbonato de sodio anhidro.

8. La composición como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde el 3-
[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-2-[(4S)-2-(4-
20 fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-(4-fluoro-1-metilindazol-5-
il)-2-oxoimidazol-1-il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-
pirazolo[4,3-c]piridina-5-carbonil]indol-1-il]-2-
metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona, o una sal
farmacéuticamente aceptable de esta, es

25 3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-
il]-2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-

3-[3-(4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-
oxoimidazol-1-il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-
pirazolo[4,3-c]piridina-5-carbonil]indol-1-
il]-2-metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-
5-ona, 0,5 hidrato de Ca.

9. La composición como se reivindica en la
reivindicación 8, en donde el 3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-
dimetiloxan-4-il]-2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-
3-[3-(4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-1-il]-
4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-c]piridina-5-
carbonil]indol-1-il]-2-metilciclopropil]-4H-1,2,4-
oxadiazol-5-ona, o una sal farmacéuticamente aceptable de
esta, es

3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-
il]-2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-
3-[3-(4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-
oxoimidazol-1-il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-
pirazolo[4,3-c]piridina-5-carbonil]indol-1-
il]-2-metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-
5-ona, 0,5 hidrato de Ca en una cantidad de
entre aproximadamente 1,2 a aproximadamente
46 mg, sobre una base de ácido libre, por
composición de cápsula.

10. La composición como se reivindica en la
reivindicación 9, en donde el 3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-
dimetiloxan-4-il]-2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-

3-[3-(4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-1-il]-
4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-c]piridina-5-
carbonil]indol-1-il]-2-metilciclopropil]-4H-1,2,4-
oxadiazol-5-ona, o una sal farmacéuticamente aceptable de
5 esta, es

3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-
2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-
(4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-
oxoimidazol-1-il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-
10 pirazolo[4,3-c]piridina-5-carbonil]indol-1-
il]-2-metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-
5-ona, 0,5 hidrato de Ca en una cantidad de
aproximadamente 46 mg, sobre una base de
ácido libre, por cápsula.

11. La composición como se reivindica en una
15 cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde el 3-
[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-2-[(4S)-2-(4-
fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-(4-fluoro-1-metilindazol-5-
il)-2-oxoimidazol-1-il]-4-metil-6, 7-dihidro-4H-
20 pirazolo[4,3-c]piridin-5-carbonil]indol-1-il]-2-
metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona, o una sal
farmacéuticamente aceptable de esta, está en una cantidad
de entre aproximadamente 1 mg y aproximadamente 45 mg,
sobre una base de ácido libre, por cápsula.

12. La composición como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 y 15 a 29 para usar en el tratamiento de la diabetes tipo 2.

13. La composición como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 y 15 a 29 para uso en el control de peso.

14. Un proceso para preparar una composición como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 que comprende una dispersión amorfa.

15. Una composición que comprende:

una SDD de aproximadamente 30 % en peso a aproximadamente 35 % en peso de 3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-(4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-1-il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-c]piridina-5-carbonil]indol-1-il]-2-metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona, o una sal farmacéuticamente aceptable de este; en una cantidad de entre aproximadamente 0,7 mg a aproximadamente 50 mg, sobre una base de ácido libre; y el resto de la SDD está compuesto por PVP-VA; y un modificador de pH seleccionado del grupo que consiste en carbonato de calcio, carbonato de magnesio, bicarbonato de sodio,

carbonato de sodio, hidróxido de magnesio, hidróxido de calcio, óxido de magnesio y una mezcla de estos.

16. La composición como se reivindica en la reivindicación 15, en donde la composición comprende:

la SDD de aproximadamente 30 % en peso 3-
[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-2-
[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-(4-
fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-1-
il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-
c]piridina-5-carbonil]indol-1-il]-2-
metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona,
o una sal farmacéuticamente aceptable de
este; en una cantidad de entre
aproximadamente 0,7 mg a aproximadamente
45 mg, sobre una base de ácido libre;
un modificador de pH el cual es bicarbonato de
sodio; en una cantidad de aproximadamente
150 mg a aproximadamente 650 mg;
opcionalmente, un relleno seleccionado del
grupo que consiste en un alcohol de azúcar,
celulosa microcristalina, metilcelulosa,
hidroxipropilcelulosa,
hidroxipropilmetilcelulosa, almidón, fosfato
dicálcico y una mezcla de estos; en una

cantidad de aproximadamente 0 mg a aproximadamente 200 mg; y
opcionalmente, un deslizante seleccionado del grupo que consiste en aceite de silicio,
5 dióxido de silicio, talco, carbonato de magnesio, y una mezcla de estos; en una cantidad de aproximadamente 0 mg a aproximadamente 5 mg.

17. La composición como se reivindica en la
10 reivindicación 16, en donde la composición comprende:

una SDD de aproximadamente 30 % en peso de
3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-
il]-2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-
3-[3-(4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-
15 oxoimidazol-1-il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-
pirazolo[4,3-c]piridina-5-carbonil]indol-1-
il]-2-metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-
5-ona, 0,5 hidrato de Ca. en una cantidad de
entre aproximadamente 1 mg a aproximadamente
20 36 mg, sobre una base de ácido libre; y el
resto de la SDD está compuesto por PVP-VA;
un modificador de pH el cual es bicarbonato de
sodio; en una cantidad de aproximadamente
200 mg a aproximadamente 600 mg;
25 opcionalmente, un relleno seleccionado del
grupo que consiste en un alcohol de azúcar,

celulosa microcristalina, metilcelulosa,
hidroxipropilcelulosa,
hidroxipropilmetilcelulosa, almidón, fosfato
dicálcico y una mezcla de estos; en una
5 cantidad de aproximadamente 0 mg a
aproximadamente 60 mg; y
opcionalmente, un deslizante seleccionado del
grupo que consiste en aceite de silicio,
dióxido de silicio, talco, carbonato de
10 magnesio, y una mezcla de estos; en una
cantidad de aproximadamente 0 mg a
aproximadamente 5 mg.

18. Una composición farmacéutica como se
reivindica en la reivindicación 17, en donde:
15 el relleno es MCC PH-102; en una cantidad de
aproximadamente 2 mg a aproximadamente
25 mg; y
el deslizante es aceite de silicio o dióxido
de silicio; en una cantidad de aproximadamente
20 0,1 mg a aproximadamente 5 mg.

19. Una composición farmacéutica como se
reivindica en la reivindicación 17, en donde:
no hay relleno presente; y
el deslizante es aceite de silicio; en una
25 cantidad de aproximadamente 0,1 mg a
aproximadamente 5 mg.

20. La composición como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 15-19, en donde la SDD tiene un tamaño medio de partícula de aproximadamente 5 µm a aproximadamente 113 µm de diámetro.

5 21. La composición como se reivindica en la reivindicación 17, en donde la composición comprende:

una SDD de aproximadamente 30 % en peso de
3-[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-
il]-2-[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-
10 3-[3-(4-fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-
oxoimidazol-1-il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-
pirazolo[4,3-c]piridina-5-carbonil]indol-1-
il]-2-metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-
5-ona, 0,5 hidrato de Ca; en una cantidad de
15 aproximadamente 1 mg, sobre una base de
ácido libre;

un modificador de pH el cual es bicarbonato de sodio; en una cantidad de aproximadamente 200 mg;

20 un relleno el cual es MCC PH-102; en una cantidad de aproximadamente 40 mg a aproximadamente 50 mg; y

un deslizante el cual es aceite de silicio o dióxido de silicio; en una cantidad de
25 aproximadamente 1 mg a aproximadamente 5 mg;

en donde el peso total de la composición es de aproximadamente 250 mg.

22. La composición como se reivindica en la reivindicación 17, en donde la composición comprende:

5 una SDD de aproximadamente 30 % en peso de 3-
[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-2-
[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-(4-
fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-1-
il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-
10 c]piridina-5-carbonil]indol-1-il]-2-
metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona,
0,5 hidrato de Ca; en una cantidad de
aproximadamente 16 mg, sobre una base de
ácido libre;
15 un modificador de pH el cual es bicarbonato de
sodio; en una cantidad de aproximadamente
200 mg;
un relleno el cual es MCC PH-102; en una
cantidad de aproximadamente 5 mg a
20 aproximadamente 10 mg; y
un deslizante el cual es aceite de silicio o
dióxido de silicio; en una cantidad de
aproximadamente 1 mg a aproximadamente 5 mg;
en donde el peso total de la composición es
25 aproximadamente 260 mg.

23. La composición como se reivindica en la reivindicación 17, en donde la composición comprende:

una SDD de aproximadamente 30 % en peso de 3-
[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-2-
5 [(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-(4-
fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-1-
il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-
c]piridina-5-carbonil]indol-1-il]-2-
metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona,
10 0,5 hidrato de Ca; en una cantidad de
aproximadamente 6 mg, sobre una base de ácido
libre; y aproximadamente 70 % en peso de PVP-
VA en una cantidad de aproximadamente 14 mg;
un modificador de pH el cual es bicarbonato de
15 sodio; en una cantidad de aproximadamente
600 mg; y
un deslizante el cual es aceite de silicio; en
una cantidad de aproximadamente 1 mg a
aproximadamente 10 mg.

20 24. La composición como se reivindica en la reivindicación 17, en donde la composición comprende:

una SDD de aproximadamente 30 % en peso de 3-
[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-2-
[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-(4-
25 fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-1-
il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-

c]piridina-5-carbonil]indol-1-il]-2-
metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona,
0,5 hidrato de Ca; en una cantidad de
aproximadamente 12 mg, sobre una base de ácido
libre; y aproximadamente 70 % en peso de PVP-
VA en una cantidad de aproximadamente 28 mg;
un modificador de pH el cual es bicarbonato de
sodio; en una cantidad de aproximadamente
600 mg; y
un deslizante el cual es aceite de silicio; en
una cantidad de aproximadamente 1 mg a
aproximadamente 10 mg.

25. La composición como se reivindica en la
reivindicación 17, en donde la composición comprende:
una SDD de aproximadamente 30 % en peso de 3-
[(1S,2S)-1-[5-[(4S)-2,2-dimetiloxan-4-il]-2-
[(4S)-2-(4-fluoro-3,5-dimetilfenil)-3-[3-(4-
fluoro-1-metilindazol-5-il)-2-oxoimidazol-1-
il]-4-metil-6,7-dihidro-4H-pirazolo[4,3-
c]piridina-5-carbonil]indol-1-il]-2-
metilciclopropil]-4H-1,2,4-oxadiazol-5-ona,
0,5 hidrato de Ca; en una cantidad de
aproximadamente 36 mg, sobre una base de ácido
libre; y aproximadamente 70 % en peso de PVP-
VA en una cantidad de aproximadamente 83 mg;

un modificador de pH el cual es bicarbonato de sodio; en una cantidad de aproximadamente 600 mg; y

5 un deslizante el cual es aceite de silicio; en una cantidad de aproximadamente 1 mg a aproximadamente 10 mg.

26. La composición como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 21-25, en donde la SDD tiene un tamaño medio de partícula de aproximadamente 5 μm a
10 aproximadamente 113 μm de diámetro.

27. La composición como se reivindica en la reivindicación 26, en donde la SDD tiene un tamaño medio de partícula de aproximadamente 40 μm a aproximadamente 65 μm de diámetro.

15 28. La composición como se reivindica en una cualquiera de la reivindicación 27, en donde la composición es una cubierta de la cápsula.

29. La composición como se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 28, en donde la cubierta
20 de la cápsula es una cubierta de cápsula de HPMC.