

REIVINDICACIONES

1. Una composición farmacéutica para administración oral, caracterizada porque comprende:

partículas de un compuesto de carbamato de la siguiente Fórmula 1, un isómero del mismo, o una sal, solvato o hidrato farmacéuticamente aceptable del mismo como un ingrediente activo;

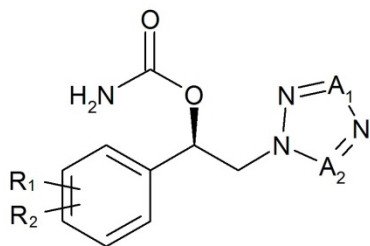
un diluyente que es uno o más seleccionados del grupo que consiste de almidón de maíz, almidón pre-gelatinizado, almidón de papa, almidón de harina de trigo, almidón de arroz glutinoso, almidón de camote, almidón de tapioca, almidón de arroz, almidón de maíz ceroso, sacarosa, lactosa anhidra, hidrato de lactosa, manitol, sorbitol, xilitol, lactitol, maltitol, eritritol, silicato de aluminio sintético, hidroxipropil almidón, celulosa microcristalina y celulosa cristalina;

un desintegrante que es uno o más seleccionados del grupo que consiste de hidroxipropil celulosa baja-sustituida, celulosa microcristalina, almidón, lactosa anhidra, hidrato de lactosa, almidón glicolato de sodio, crospovidona, carboximetil celulosa y una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, hidroxipropil celulosa, almidón de maíz y croscarmelosa y una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos; y

un lubricante que es uno o más seleccionados del grupo que consiste de dióxido de silicio, sílice anhidra coloidal, trisilicato de magnesio, fosfato de calcio tribásico, silicato de calcio, silicato de magnesio, dióxido de silicio coloidal, celulosa en polvo, almidón, estearato de magnesio, talco, ácido silícico anhidro ligero, estearil fumarato de sodio, polietilenglicol, aceite mineral, aceite vegetal hidrogenado, estearato de zinc y ácido esteárico;

en donde un diámetro de partícula $d(0.9)$ de las partículas de ingrediente activo es menos de 300 μm :

[Fórmula 1]



en donde,

R₁ y R₂ son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, perfluoroalquilo de C₁-C₈, alquilo de C₁-C₈, tioalcoxi de C₁-C₈ y alcoxi de C₁-C₈; y

uno de A₁ y A₂ es CH, y el otro es N.

2. La composición farmacéutica para administración oral de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque el diámetro de partícula d(0.9) de las partículas de ingrediente activo es 250 µm o menos.

3. La composición farmacéutica para administración oral de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque el diámetro de partícula d(0.9) de las partículas de ingrediente activo es 150 µm o menos.

4. La composición farmacéutica para administración oral de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizada porque el ingrediente activo está comprendido en una cantidad de 5 mg a 400 mg.

5. La composición farmacéutica para administración oral de conformidad con la reivindicación 1, caracterizada porque además comprende un surfactante,

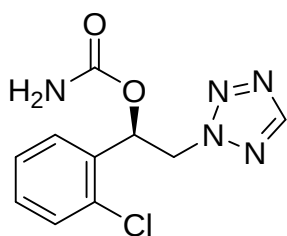
en donde el surfactante es uno o más seleccionados del grupo que consiste de polisorbato 80, oleoil macrogol glicérido, linoleoil, caprilcaproil macrogol glicérido, polioxilglicérido, hidroxipropil metilcelulosa (HPMC), hidroxipropil celulosa (HPC),

carboximetilcelulosa de sodio, polivinilpirrolidona, lauril sulfato de sodio, oleato de sodio y dioctil sulfosuccinato de sodio.

6. La composición farmacéutica para administración oral de conformidad con la reivindicación 5, caracterizada porque comprende 5 a 35% en peso del ingrediente activo, 55 a 90% en peso del diluyente, 2 a 6% en peso del desintegrante y 0.1 a 4% en peso del lubricante, en base al peso total de la composición farmacéutica.

7. La composición farmacéutica para administración oral de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizada porque el ingrediente activo es un compuesto de carbamato de la siguiente Fórmula 2, un isómero del mismo, o una sal, solvato o hidrato farmacéuticamente aceptable del mismo:

[Fórmula 2]



8. La composición farmacéutica para administración oral de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizada porque está en una forma de tableta comprimida, tableta multi-comprimida, tableta recubierta de azúcar, tableta recubierta de película, cápsula dura o cápsula blanda.

9. Un método para preparar una composición farmacéutica para administración oral, caracterizado porque comprende una etapa de mezclar partículas de un compuesto de carbamato de la siguiente Fórmula 1, un isómero del mismo, o una sal, solvato o hidrato farmacéuticamente aceptable del mismo como un ingrediente activo con portadores

farmacéuticamente aceptables que son un diluyente, un desintegrante y un lubricante, y formar en tabletas;

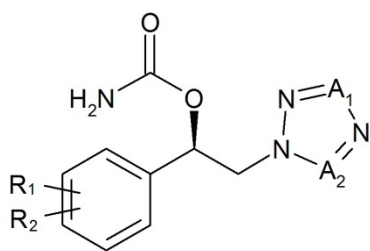
en donde un diámetro de partícula d(0.9) de las partículas de ingrediente activo es menos de 300 μm ;

en donde el diluyente es uno o más seleccionados del grupo que consiste de almidón de maíz, almidón pre-gelatinizado, almidón de papa, almidón de harina de trigo, almidón de arroz glutinoso, almidón de camote, almidón de tapioca, almidón de arroz, almidón de maíz ceroso, sacarosa, lactosa anhidra, hidrato de lactosa, manitol, sorbitol, xilitol, lactitol, maltitol, eritritol, silicato de aluminio sintético, hidroxipropil almidón, celulosa microcristalina y celulosa cristalina;

en donde el desintegrante es uno o más seleccionados del grupo que consiste de hidroxipropil celulosa baja-sustituida, celulosa microcristalina, almidón, lactosa anhidra, hidrato de lactosa, almidón glicolato de sodio, crospovidona, carboximetil celulosa y una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, hidroxipropil celulosa, almidón de maíz y croscarmelosa y una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos; y

en donde el lubricante es uno o más seleccionados del grupo que consiste de dióxido de silicio, sílice anhidra coloidal, trisilicato de magnesio, fosfato de calcio tribásico, silicato de calcio, silicato de magnesio, dióxido de silicio coloidal, celulosa en polvo, almidón, estearato de magnesio, talco, ácido silícico anhidro ligero, estearil fumarato de sodio, polietilenglicol, aceite mineral, aceite vegetal hidrogenado, estearato de zinc y ácido esteárico:

[Fórmula 1]



en donde,

R_1 y R_2 son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, perfluoroalquilo de C_1 - C_8 , alquilo de C_1 - C_8 , tioalcoxi de C_1 - C_8 y alcoxi de C_1 - C_8 ; y

uno de A_1 y A_2 es CH, y el otro es N.

10. El método para preparar una composición farmacéutica para administración oral de conformidad con la reivindicación 9, caracterizado porque la formación de tabletas se lleva a cabo mediante compresión directa.

11. El método para preparar una composición farmacéutica para administración oral de conformidad con la reivindicación 9 o 10, caracterizado porque el diámetro de partícula $d(0.9)$ de las partículas de ingrediente activo es 250 μm o menos.

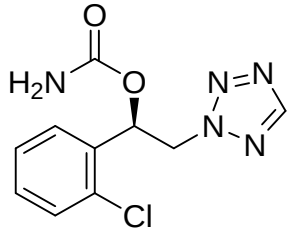
12. El método para preparar una composición farmacéutica para administración oral de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 9 a 11, caracterizado porque la composición farmacéutica comprende el ingrediente activo en una cantidad de 5 mg a 400 mg.

13. El método para preparar una composición farmacéutica para administración oral de conformidad con la reivindicación 9, caracterizado porque el portador farmacéuticamente aceptable además comprende un surfactante,

en donde el surfactante es uno o más seleccionados del grupo que consiste de polisorbato 80, oleoil macrogol glicérido, linoleoilo, caprilcaproil macrogol glicérido, polioxilglicérido, hidroxipropil metilcelulosa (HPMC), hidroxipropil celulosa (HPC), carboximetilcelulosa de sodio, polivinilpirrolidona, lauril sulfato de sodio, oleato de sodio y dioctil sulfosuccinato de sodio.

14. El método para preparar una composición farmacéutica para administración oral de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 9 a 13, caracterizado porque el ingrediente activo es un compuesto de carbamato de la siguiente Fórmula 2, un isómero del mismo, o una sal, solvato o hidrato farmacéuticamente aceptable del mismo:

[Fórmula 2]



15. El método para preparar una composición farmacéutica para administración oral de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 9 a 14, caracterizado porque la composición farmacéutica está en una forma de tableta comprimida, tableta multi-comprimida, tableta recubierta de azúcar, tableta recubierta de película, cápsula dura o cápsula blanda.