



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 304 911**

51 Int. Cl.:
C07D 207/34 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE REIVINDICACIONES DE SOLICITUD
DE PATENTE EUROPEA

T1

- 86 Número de solicitud europea: **06765662 .9**
86 Fecha de presentación de la solicitud: **03.05.2006**
87 Número de publicación de la solicitud: **1879862**
87 Fecha de publicación de la solicitud: **23.01.2008**

30 Prioridad: **03.05.2005 IN DE11082005**

43 Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.11.2008

46 Fecha de publicación de la traducción de las
reivindicaciones: **01.11.2008**

71 Solicitante/s: **RANBAXY LABORATORIES LIMITED**
Plot No. 90, Sector-32
Gurgaon, Haryana 122001, IN

72 Inventor/es: **Kumar, Yatendra;**
Kumar, Saridi Madhava Dileep y
Sathyanarayana, Swargam

74 Agente: **Durán Moya, Luis Alfonso**

54 Título: **Sales de magnesio de inhibidores de HMG-CoA reductasa.**

ES 2 304 911 T1

ES 2 304 911 T1

REIVINDICACIONES

1. Forma cristalina de una sal magnésica de atorvastatina.
- 5 2. Forma cristalina, según la reivindicación 1, que tiene un patrón de difracción de RX substancialmente como el mostrado en la figura 1.
- 10 3. Forma cristalina, según la reivindicación 1, que tiene un espectro de IR substancialmente como el mostrado la figura 2.
4. Forma cristalina, según la reivindicación 1, que tiene un patrón de difracción de RX que comprende picos a valores de 2θ de, aproximadamente, 8,60, 16,14, 17,96, y $21,44 \pm 0,2$.
- 15 5. Forma cristalina, según la reivindicación 4, que comprende además picos característicos a valores de 2θ de, aproximadamente, 9,66 y $11,34 \pm 0,2$.
6. Forma cristalina, según la reivindicación 4, que comprende además picos característicos a valores de 2θ de, aproximadamente, 8,80, 18,48, 18,62, 21,26, y $21,60 \pm 0,2$.
- 20 7. Forma cristalina, según la reivindicación 1, en la que la sal magnésica de atorvastatina es una sal hemimagnésica.
8. Proceso para la preparación de la sal magnésica cristalina de atorvastatina, que comprende poner en contacto una sal de metal alcalino de atorvastatina con una sal magnésica de un ácido, en presencia de un disolvente, para formar una atorvastatina magnésica cristalina.
- 25 9. Proceso, según la reivindicación 8, en el que la sal de metal alcalino comprende una o más de atorvastatina potásica, de atorvastatina sódica y de atorvastatina lítica.
- 30 10. Proceso, según la reivindicación 8, en el que la sal magnésica de un ácido comprende una sal magnésica de cualquier ácido inorgánico u orgánico.
- 35 11. Proceso, según la reivindicación 8, en el que la sal magnésica de un ácido comprende uno o más de cloruro magnésico, nitrato magnésico, sulfato magnésico, fosfato magnésico, carbonato magnésico, dihidrogenofosfato magnésico, oxalato magnésico, acetato magnésico, lactato magnésico, succinato magnésico y citrato magnésico.
12. Proceso, según la reivindicación 8, en el que el disolvente comprende unos o más disolventes hidroxílicos.
- 40 13. Proceso, según la reivindicación 12, en el que los disolventes hidroxílicos comprenden agua, alcoholes menores y mezclas de los mismos.
14. Proceso, según la reivindicación 13, en el que los alcoholes menores comprenden alcoholes primarios, secundarios y terciarios que tienen de uno a seis átomos de carbono.
- 45 15. Proceso, según la reivindicación 13, en el que los alcoholes menores comprenden alcoholes primarios, secundarios y terciarios que tienen de uno a cuatro átomos de carbono.
16. Proceso, según la reivindicación 15, en el que los alcoholes menores comprenden uno o más de metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, isobutanol, n-butanol y t-butanol.
- 50 17. Forma amorfa de una sal magnésica de atorvastatina.
18. Forma amorfa, según la reivindicación 17, que tiene un patrón de difracción de RX substancialmente como el mostrado en la figura 3.
- 55 19. Forma amorfa, según la reivindicación 17, que tiene un espectro de IR substancialmente como el mostrado en la figura 4.
20. Proceso para la obtención de atorvastatina magnésica amorfa que comprende:
- 60 a) disolver una atorvastatina magnésica cristalina en uno o más disolventes, y
- b) eliminar el disolvente de la solución para obtener una atorvastatina magnésica amorfa.
- 65 21. Proceso, según la reivindicación 20, en el que se añade un codisolvente a la solución antes de la eliminación del disolvente.
22. Proceso para la obtención de atorvastatina magnésica amorfa que comprende:

ES 2 304 911 T1

a) disolver una atorvastatina magnésica cristalina en uno o más disolventes, y

b) añadir uno o más contra disolventes a la solución para obtener una atorvastatina magnésica amorfa.

5 23. Composición farmacéutica que comprende atorvastatina magnésica, según la reivindicación 1 o la reivindicación 17, y uno o más de los excipientes, diluyentes y portadores farmacéuticamente aceptables.

10 24. Método de tratamiento de la hipercolesterolemia primaria, disbetalipoproteinemia o hipercolesterolemia homocigótica familiar, que comprende la administración de una cantidad terapéuticamente efectiva de atorvastatina magnésica, según la reivindicación 1 o la reivindicación 17, a un mamífero en necesidad de la misma.

15 25. Método de inhibición de la reductasa HMG-CoA, que comprende la administración de una cantidad terapéuticamente efectiva de atorvastatina magnésica, según la reivindicación 1 o la reivindicación 17, a un mamífero en necesidad de la misma.

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

FIGURA 1a

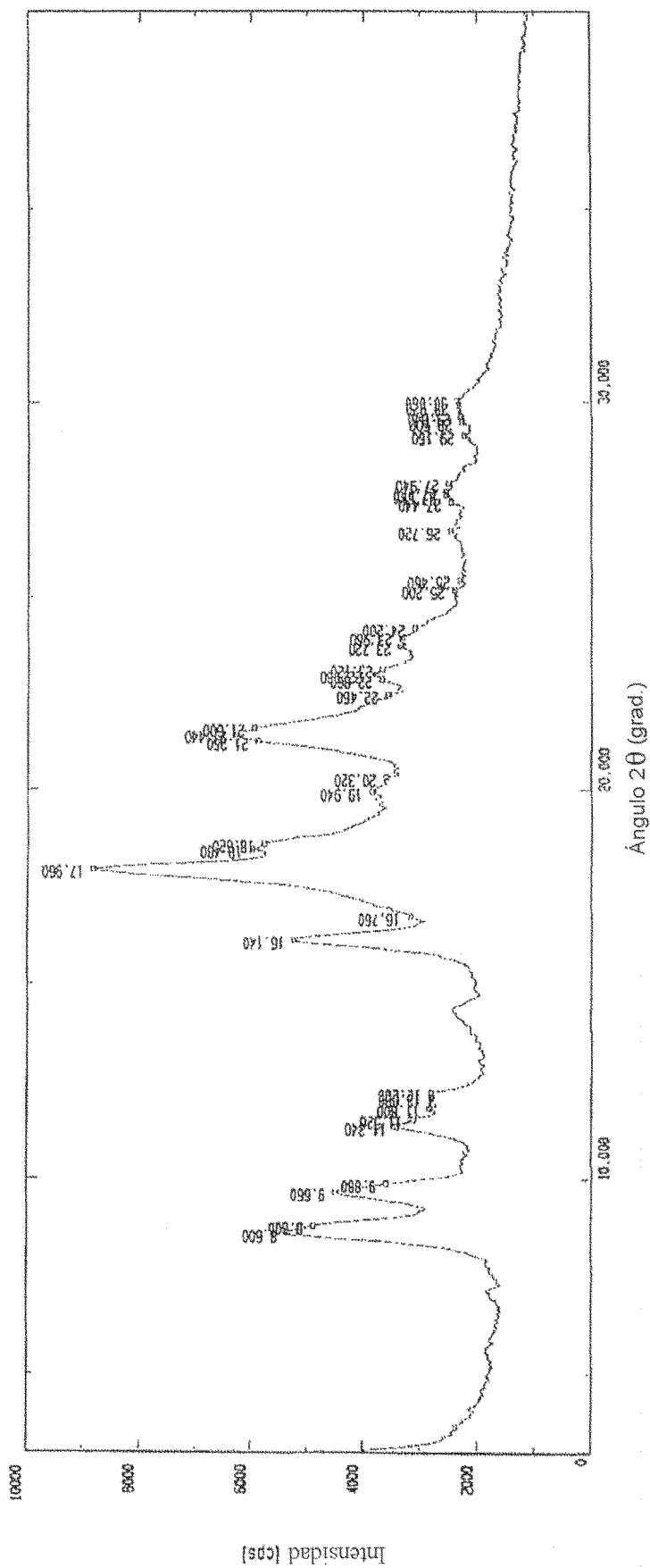


FIGURA 1b

Busqueda de pico											
Muestra	: SMO/302/30 Kg		Archivo	: AIDAFASLAIN-3415		Comentario	: 06-19934143				
Fecha	: 14-Feb-03 16:51		Operador	: AD							
Numero de pico	Zu	FWHM	valor d	Intensidad	I/Io	Numero de pico	Zu	FWHM	valor d	Intensidad	I/Io
1	8.600	0.282	10.2733	5346	67	31	27.620	0.118	3.2269	2564	29
2	8.800	0.212	10.0403	4882	55	32	27.720	0.094	3.2155	2560	29
3	9.650	0.259	9.1483	4493	51	33	27.340	0.118	3.1907	2519	29
4	9.880	0.212	8.9431	3593	41	34	29.160	0.118	3.0599	2243	23
5	11.340	0.235	7.7965	3405	39	35	29.580	0.094	3.0254	2287	28
6	11.520	0.094	7.6750	3121	36	36	29.840	0.094	3.0115	2313	26
7	11.800	0.094	7.4935	2832	32	37	29.320	0.118	2.9839	2348	27
8	12.080	0.094	7.3205	2808	32	38	30.050	0.118	2.8703	2360	27
9	12.200	0.165	7.2487	2813	32						
10	15.140	0.400	5.4870	3228	59						
11	16.760	0.418	5.2854	3178	36						
12	17.980	0.375	4.9349	8817	100						
13	18.480	0.118	4.7972	5987	68						
14	18.620	0.141	4.7614	5777	66						
15	19.940	0.094	4.4491	3855	44						
16	20.320	0.094	4.3667	3505	41						
17	21.260	0.165	4.1757	5888	67						
18	21.440	0.212	4.1411	6280	71						
19	21.600	0.165	4.1108	5355	66						
20	22.460	0.094	3.8953	3872	41						
21	22.860	0.118	3.8870	3684	42						
22	22.980	0.118	3.8869	3684	44						
23	23.120	0.212	3.8438	3678	42						
24	23.720	0.141	3.7479	3337	38						
25	23.960	0.094	3.7103	3336	38						
26	24.200	0.118	3.6747	3107	35						
27	25.200	0.094	3.5311	2418	27						
28	25.460	0.118	3.4956	2919	26						
29	25.720	0.118	3.3336	2484	20						
30	27.440	0.118	3.2877	2475	28						

FIGURA 2

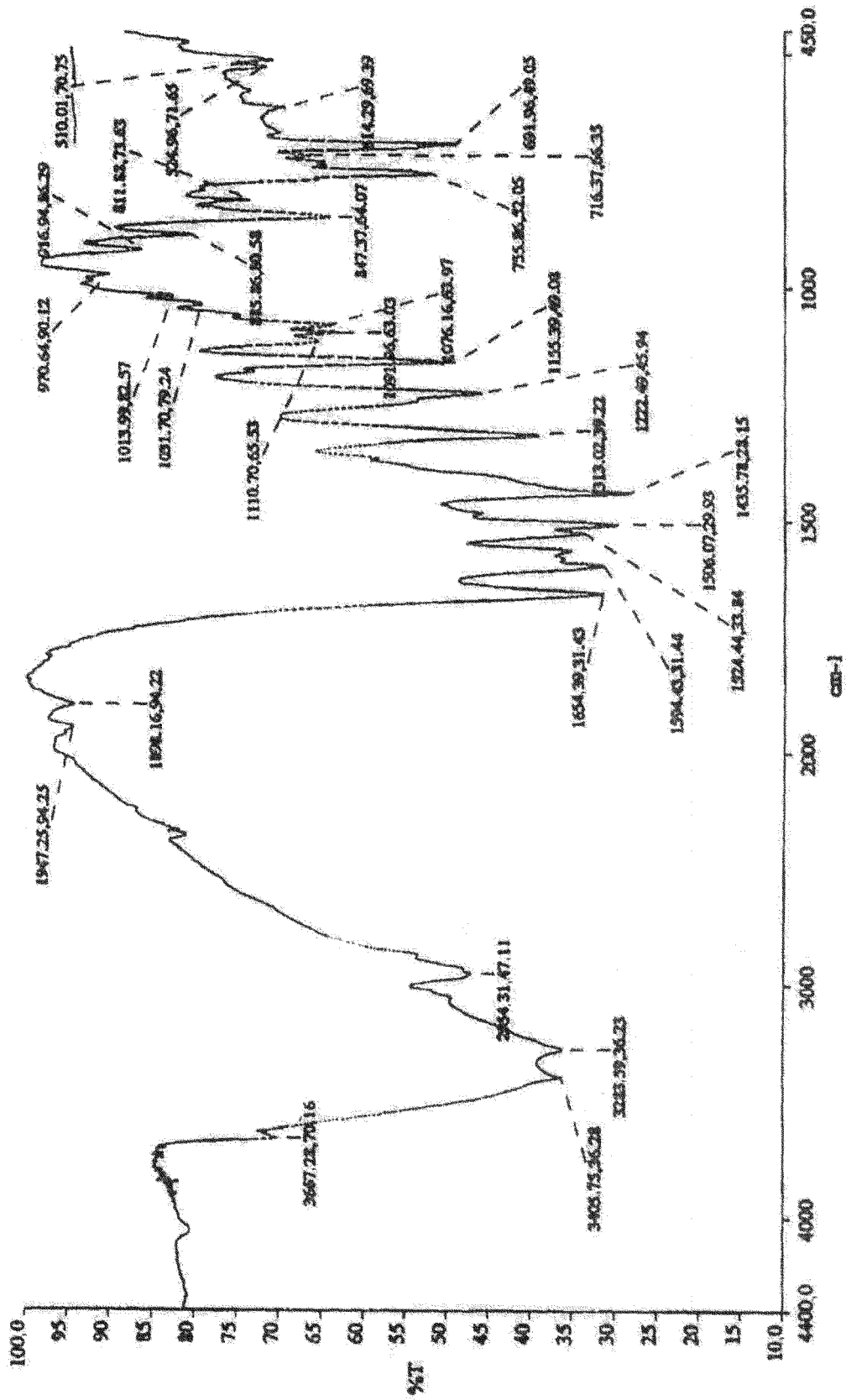


FIGURA 3

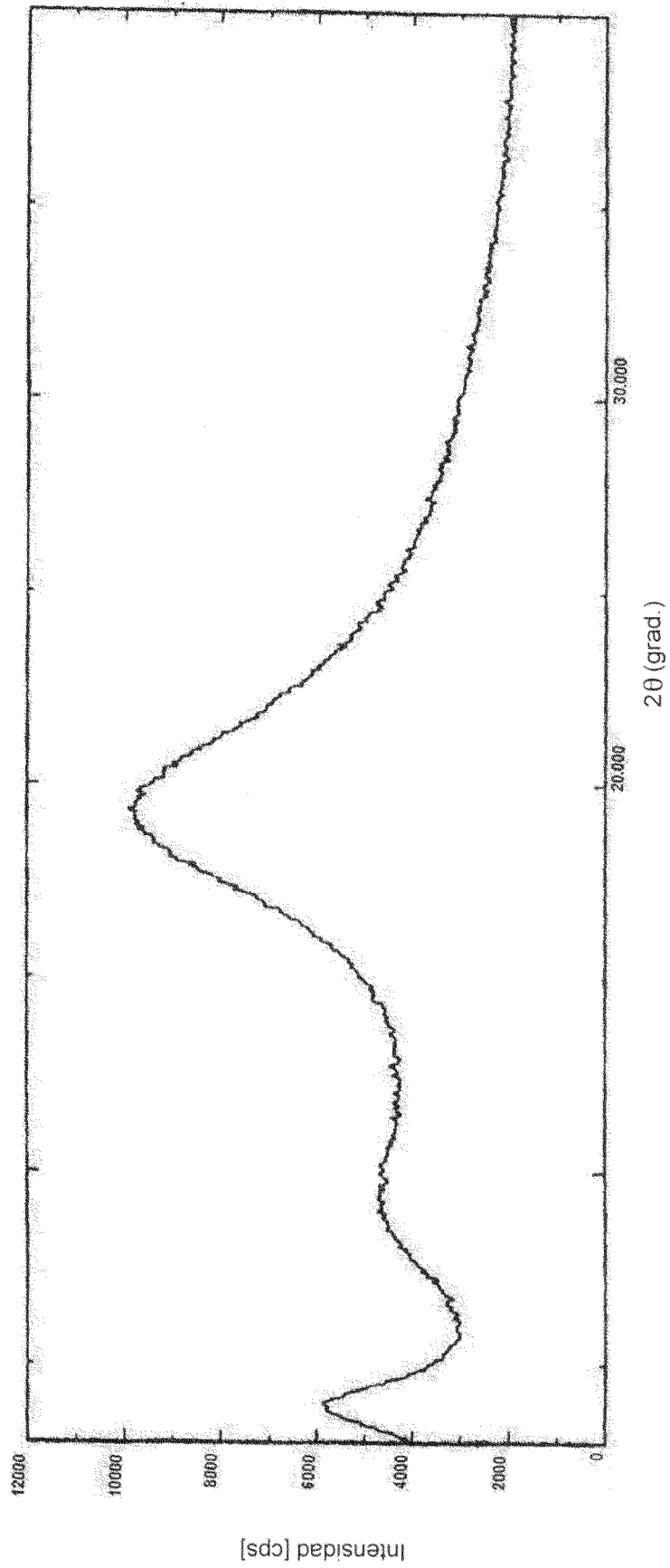


FIGURA 4

