



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**

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

(43) Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.11.2008

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

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

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

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

ES 2 304 911 T1

REIVINDICACIONES

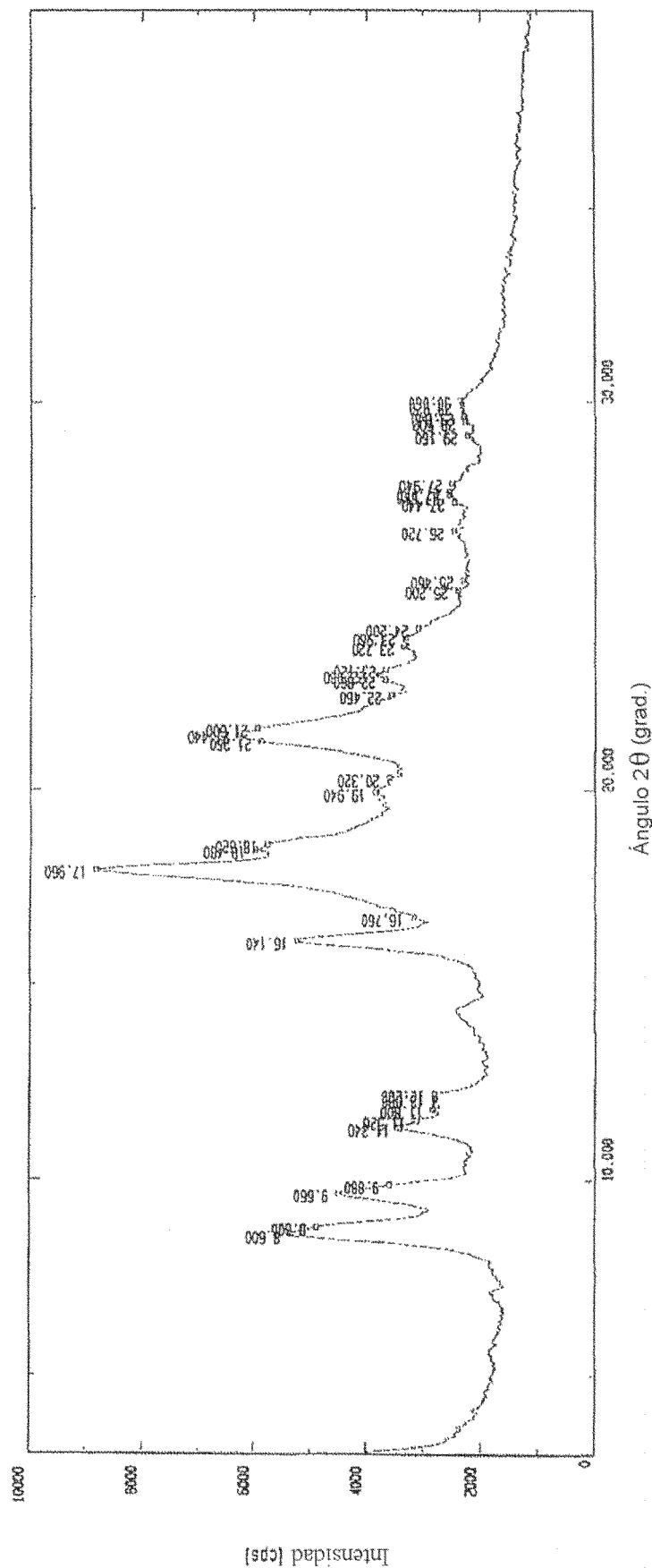
1. Forma cristalina de una sal magnésica de atorvastatina.
- 5 2. Forma cristalina, según la reivindicación 1, que tiene un patrón de difracción de RX substancialmente como el mostrado en la figura 1.
- 10 3. Forma cristalina, según la reivindicación 1, que tiene un espectro de IR substancialmente como el mostrado la figura 2.
- 15 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 $21,44 \pm 0,2$.
- 20 5. Forma cristalina, según la reivindicación 4, que comprende además picos característicos a valores de 2θ de, aproximadamente, 9,66 y $11,34 \pm 0,2$.
- 25 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 $21,60 \pm 0,2$.
- 30 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.
- 35 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.
- 10 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.
- 30 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, alcanoles menores y mezclas de los mismos.
14. Proceso, según la reivindicación 13, en el que los alcanoles 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 alcanoles 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 alcanoles 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:
 - 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.
- 60 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 amorfá.
- 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

ES 2 304 911 T1

FIGURA 1a



Intensidad [cps]

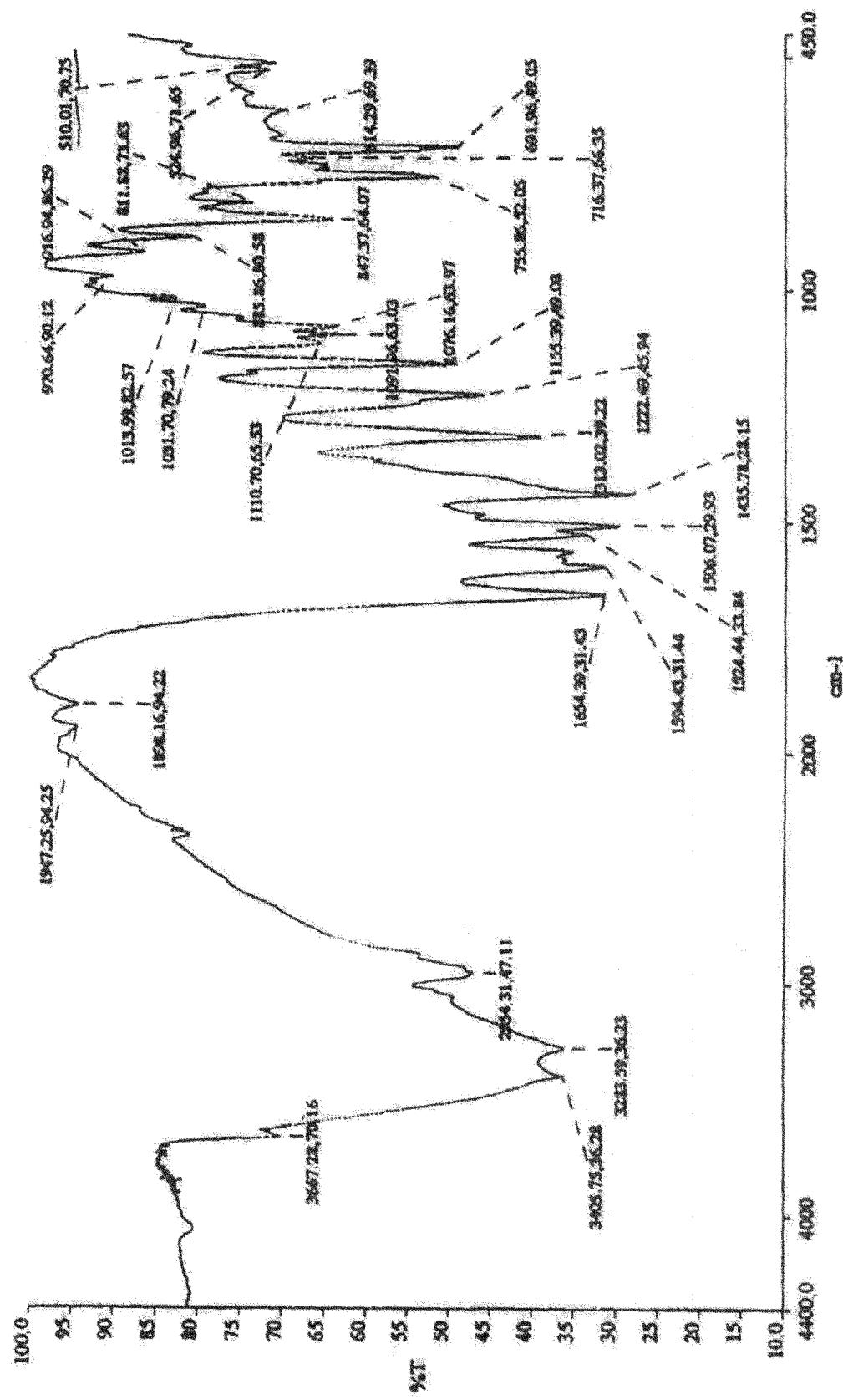
ES 2 304 911 T1

FIGURA 1b

Búsqueda de pico									
Muestra	SM0/4302/38 MG	Archivo	A100045121IN_5415	Comentario	06/09/11 40				
Fecha	14-Feb-03 18:51	Operador	1-A0						
Número de pico	20	FWHM	Val. d.	1/10	Intensidad	20	FWHM	Val. d.	Intensidad
1	8.600	0.282	10.2733	5346	61	31	27.620	0.318	3.2263
2	8.800	0.212	10.0403	4882	55	32	27.720	0.094	3.2155
3	9.650	0.259	9.1483	4493	51	33	27.940	0.118	3.1907
4	9.880	0.212	8.9451	3581	41	34	29.160	0.116	3.0599
5	11.340	0.235	7.7965	3405	39	35	29.500	0.094	3.0254
6	11.520	0.094	7.6750	3131	36	36	28.540	0.094	3.0115
7	11.800	0.094	7.4935	2832	32	37	29.920	0.116	2.9839
8	12.060	0.094	7.3205	2808	32	36	30.060	0.116	2.9703
9	12.200	0.165	7.2487	2843	32				
10	15.140	0.400	5.4870	5228	49				
11	16.760	0.418	5.2854	3178	36				
12	17.360	0.375	4.9349	6817	100				
13	18.480	0.118	4.7972	5937	68				
14	19.520	0.141	4.7614	5777	66				
15	19.940	0.094	4.7491	3856	44				
16	20.320	0.094	4.7366	3655	41				
17	21.260	0.165	4.7175	3608	67				
18	21.440	0.212	4.1411	6289	71				
19	21.600	0.165	4.1108	5955	66				
20	22.460	0.094	3.9553	3512	41				
21	22.860	0.118	3.8870	3654	42				
22	22.980	0.118	3.0659	3864	44				
23	23.120	0.212	3.8438	3678	42				
24	23.720	0.141	3.7479	3387	38				
25	23.950	0.094	3.7103	3335	38				
26	24.200	0.118	3.6747	3107	35				
27	25.200	0.094	3.5211	2439	27				
28	25.460	0.118	3.4956	2319	26				
29	26.720	0.118	3.3335	2434	28				
30	27.440	0.118	3.2427	2416	28				

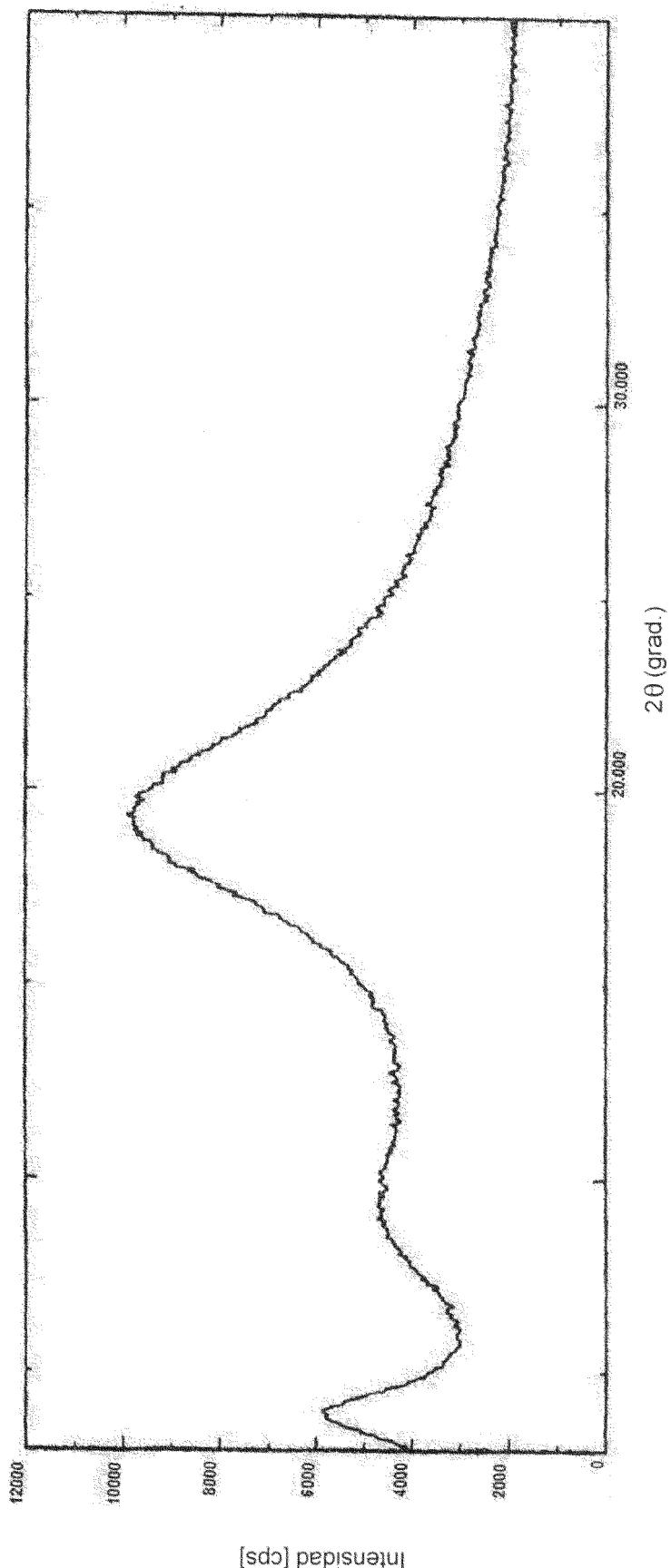
ES 2 304 911 T1

FIGURA 2



ES 2 304 911 T1

FIGURA 3



ES 2 304 911 T1

FIGURA 4

