



OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

① Número de publicación: 2 339 213

(51) Int. Cl.:

C07D 211/90 (2006.01) A61K 31/435 (2006.01) **A61P 9/12** (2006.01)

12	TRADUCCIÓN DE REIVINDICACIONES DE SOLICITUD
	DE PATENTE EUROPEA

T1

- 96 Número de solicitud europea: 06723128 .2
- 96 Fecha de presentación de la solicitud: **24.02.2006**
- 97 Número de publicación de la solicitud: 1856051
- 97 Fecha de publicación de la solicitud: 21.11.2007
- 30 Prioridad: 25.02.2005 US 656836 P
- (71) Solicitante/s: **RECORDATI IRELAND LIMITED**
 - Raheens East Ringaskiddy, County Cork, IE
- 43 Fecha de publicación de la mención BOPI: 18.05.2010
- (2) Inventor/es: Leonardi, Amedeo; Motta, Gianni y Berlati, Fabio
- 46 Fecha de publicación de la traducción de las reivindicaciones: 18.05.2010
- (74) Agente: Manresa Val, Manuel

54 Título: Hidrocloruro de lercanidipino amorfo.

ES 2 339 213 T1

ES 2 339 213 T1

REIVINDICACIONES

- 1. Hidrocloruro de lercanidipino amorfo que presenta una pureza de por lo menos el 95%.
- 2. Hidrocloruro de lercanidipino amorfo según la reivindicación 1, que presenta una pureza de por lo menos el 99%.
- 3. Hidrocloruro de lercanidipino amorfo según la reivindicación 1, que presenta una pureza de por lo menos el 99,5%.
 - 4. Hidrocloruro de lercanidipino amorfo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, que carece sustancialmente de hidrocloruro de lercanidipino cristalino.
- 5. Hidrocloruro de lercanidipino amorfo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, que se ha micronizado hasta un tamaño de partícula de D (90%) < 15 μ m.
 - 6. Procedimiento para la preparación de hidrocloruro de lercanidipino amorfo, comprendiendo el procedimiento
 - (a) la disolución del hidrocloruro de lercanidipino cristalino en un disolvente orgánico; y
 - (b) el aislamiento del hidrocloruro de lercanidipino amorfo mediante

20

2.5

30

45

- (i) la adición de la disolución a agua para formar un precipitado y la recogida del precipitado, o
- (ii) la retirada por evaporación del disolvente orgánico.
- 7. Procedimiento según la reivindicación 6, en el que el disolvente orgánico es un disolvente polar prótico o una mezcla de los mismos.
- 8. Procedimiento según la reivindicación 6, en el que el disolvente orgánico es un alcohol, una cetona, un disolvente clorado o una amida.
 - 9. Procedimiento según la reivindicación 6, en el que el disolvente orgánico es metanol o diclorometano.
- 10. Procedimiento según la reivindicación 6, en el que el disolvente orgánico es acetona, dimetilformamida o una mezcla de metanol y etanol.
- 11. Procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 6 a 10, en el que la etapa (a) se realiza a una temperatura comprendida entre 30°C y 50°C.
 - 12. Procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 6 a 11, en el que el agua de la etapa (i) se encuentra a una temperatura comprendida entre 1°C y 20°C. y la disolución permanece a dicha temperatura durante un período comprendido entre 4 y 24 horas para permitir que se complete la precipitación.
- 13. Procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones 6 a 11, en el que la evaporación del disolvente se realiza al vacío a una temperatura comprendida entre 20°C y 40°C.
- 14. Composición farmacéutica que comprende hidrocloruro de lercanidipino amorfo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o hidrocloruro de lercanidipino amorfo preparado mediante un método según cualquiera de las reivindicaciones 6 a 13 y un diluyente, vehículo y/o excipiente farmacéuticamente aceptables.
 - 15. Composición farmacéutica según la reivindicación 14, comprendiendo la composición por lo menos un componente seleccionado de entre un diluyente, un saborizante, un edulcorante, un conservante, un tinte, un aglutinante, un agente de suspensión, un agente para aumentar la viscosidad, un agente dispersante, un colorante, un desintegrante, un lubricante, un antioxidante, un plastificante, y un aceite comestible, todos ellos farmacéuticamente aceptables
- 16. Composición farmacéutica según la reivindicación 14, adaptándose la composición para una liberación modificada y comprendiendo por lo menos una sustancia cerosa.
 - 17. Composición farmacéutica según la reivindicación 16, en la que la sustancia cerosa es un éster de acilo graso con polialcohol o una mezcla de ésteres de acilo graso con polialcohol.
- 18. Composición farmacéutica según la reivindicación 17, en la que el o cada éster de acilo graso con polialcohol es un éster de polietilenglicol, un éster de polipropilenglicol o un glicérido de un ácido graso.

ES 2 339 213 T1

19. Composición farmacéutica según la reivindicación 16, en la que la sustancia cerosa es un glicérido poliglicolizado que comprende un éster de un ácido graso y un éster de polietilenglicol, presentando el glicérido poliglicolizado un punto de fusión comprendido entre 33°C y 64°C y un valor del equilibrio hidrófilo - lipófilo (HLB) comprendido entre 1 y 14.

20. Composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones 14 a 20, adaptándose la composición para una liberación modificada, siendo en forma de dosis unitaria y encontrándose contenida en una cápsula de gelatina,

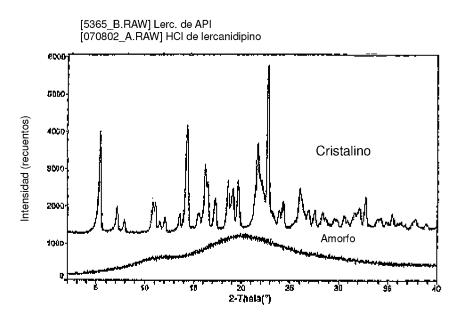


Figura 1. Espectro de difracción de polvo por rayos X del HCl de lercanidipino cristalino (Ler3) y amorfo (Ler1).

Figura 2

Niveles plasmáticos medios de lercanidipino

Variable = S-lerca

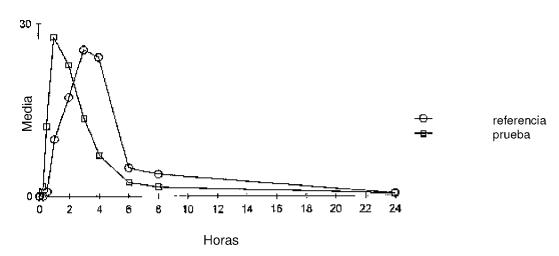


Figura 3

Niveles plasmáticos medios de lercanidipino

Variable = S-lerca

