(19) OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 505 715**

(51) Int. Cl.:

A61K 9/00 (2006.01)
A61K 47/26 (2006.01)
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)

(12) TRADUCCIÓN DE REIVINDICACIONES DE SOLICITUD DE PATENTE EUROPEA T1

(96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.02.2013** **E 13154284 (7)**

(97) Fecha y número de publicación de la solicitud europea: **10.09.2014** **EP 2774605**

(46) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de las reivindicaciones de la solicitud: **10.10.2014**

(71) Solicitantes:

GALENICUM HEALTH S.L. (100.0%)
Avenida Diagonal, 123, 11º
08005 Barcelona, ES

(72) Inventor/es:

FORCAT SUBIRANA, TEIA

(74) Agente/Representante:

TORREJÓN NIETO, Javier

(54) Título: **Composición farmacéutica que comprende almotriptán malato que tiene una distribución y potencia uniforme**

ES 2 505 715 T1

REIVINDICACIONES

1. Una composición farmacéutica en forma de comprimido de liberación inmediata que comprende almotriptán malato y manitol, preferiblemente un comprimido recubierto con película, donde el manitol está en forma cristalina y la densidad aparente del manitol es inferior a 0,75 g/ml.

2. La composición farmacéutica según la reivindicación anterior, donde la densidad aparente del manitol oscila entre 0,40 y 0,67 g/ml, preferiblemente entre 0,48 y 0,62 g/ml, más preferiblemente entre aproximadamente 0,52 y aproximadamente 0,58 g/ml, y aún más preferiblemente es aproximadamente 0,55 g/ml; o donde el manitol tiene un tamaño medio de partícula medido por difracción láser de 15 a 180 micrómetros, preferiblemente de 35 a 80 micrómetros.

3. La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores: donde el almotriptán malato es no micronizado, preferiblemente es una forma cristalina no micronizada; donde la D50 del almotriptán malato es mayor que 20 micrómetros, preferiblemente es menor que 250 micrómetros, más preferiblemente está entre 30 y 190 micrómetros, aún más preferiblemente está entre 50 y 150 micrómetros, aún incluso más preferiblemente está entre 65 y 135 micrómetros y más preferiblemente está entre 80 y 115 micrómetros; y/o donde la D90 del almotriptán malato es mayor que 50 micrómetros, preferiblemente es menor que 700 micrómetros, más preferiblemente está entre 80 y 550 micrómetros, incluso más preferiblemente está entre 110 y 475 micrómetros, todavía aún más preferiblemente está entre 150 y 390 micrómetros, más preferiblemente está entre 200 y 300 micrómetros.

4. La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde el almotriptán malato está en forma cristalina; o donde la forma cristalina del almotriptán malato muestra un patrón de difracción de rayos X con picos en 15,4, 16,2 y 22,1º 2Θ (± 0,2º 2Θ), preferiblemente en 10,7, 15,4, 16,2, 18,3, 19,6 y 22,1º 2Θ (± 0,2º 2Θ), más preferiblemente en 10,7, 15,4, 16,2, 18,3, 19,6 y 22,1º 2Θ (± 0,2º 2Θ), e incluso más preferiblemente la forma cristalina del almotriptán malato tiene un patrón de difracción de rayos X tal como se representa en la figura 1.

5. La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde la relación en peso de (almotriptán malato):(manitol) es de 1:1 a 1:10, preferiblemente es de 1:2 a 1:7, más preferiblemente es de 1:3 a 1:4,5, y aún más preferiblemente es de 1:3,5 a 1: 4,0.

6. La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores: donde la composición farmacéutica comprende además al menos un diluyente, preferiblemente en una cantidad del 2 al 20 % en peso, más preferiblemente de 7 a 15 % en peso; donde la composición farmacéutica comprende además celulosa microcristalina, preferiblemente en una cantidad del 2 al 20 % en peso, más preferiblemente del 7 al 15 % en peso; donde la composición farmacéutica además comprende al menos un lubricante, preferiblemente en una cantidad del 0,1 al 3 % en peso, más preferiblemente de 0,5 a 1,5 % en peso; donde la composición farmacéutica comprende además estearil fumarato sódico, preferiblemente en una cantidad del 0,1 al 3 % en peso, más preferiblemente del 0,5 al 1,5 % en peso; donde la composición farmacéutica comprende además al menos un aglutinante, preferiblemente en una cantidad del 1 al 8 % en peso, más preferiblemente del 2 al 5 % en peso; donde la composición farmacéutica comprende además polivinilpirrolidona, preferiblemente en una cantidad del 1 al 8 % en peso, más preferiblemente del 2 al 5 % en peso; donde la composición farmacéutica

comprende además al menos un antiadherente, preferiblemente en una cantidad del 2 al 8 % en peso, más preferiblemente del 3 al 6 % en peso; o donde la composición farmacéutica comprende además carboximetil almidón sódico, preferiblemente en una cantidad del 2 al 8 % en peso, más preferiblemente del 3 al 6% en peso, siendo todos los % en peso en relación con la cantidad total de la composición farmacéutica.

7. La composición farmacéutica según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde: el contenido de agua de la composición farmacéutica es inferior al 4 % en peso medido por pérdida por desecación, preferiblemente es inferior al 2 % en peso medido por pérdida por desecación; y/o el comprimido tiene una dureza inferior a 70 N, preferiblemente de 30 a 55 N, más preferiblemente de 35 a 45 N.

8. Una composición farmacéutica envasada, donde dicha composición farmacéutica envasada es: un blister que comprende una composición farmacéutica como se define en una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, preferiblemente el blister es un blister aluminio/aluminio o un blister aluminio/PVC o una caja de cartón con prospecto que comprende al menos uno de dichos blisters.

9. Un polvo farmacéutico que comprende almotriptán malato y manitol, donde el manitol está en forma cristalina y la densidad aparente del manitol es inferior a 0,75 g/ml, ventajosamente la relación en peso de (almotriptán malato):(manitol) es de 1:1 a 1:10, preferiblemente es de 1:2 a 1:7, más preferiblemente es de 1:3 a 1:4,5, e incluso más preferiblemente es de 1:3,5 a 1:4,0, y/o el polvo farmacéutico se distribuye uniformemente.

10. Un granulado que comprende almotriptán malato y manitol, donde el manitol está en forma cristalina y la densidad aparente del manitol utilizado para la fabricación de los gránulos es inferior a 0,75 g/ml.

11. Almotriptán malato: que tiene un patrón de difracción de rayos X con picos en 15,4, 16,2 y 22,1º 2Θ (± 0,2º 2Θ) y donde la D50 del almotriptán malato es mayor que 20 micrómetros y la D90 es mayor que 50 micrómetros; o que tiene un patrón de difracción de rayos X con picos en 15,4, 16,2 y 22,1º 2Θ (± 0,2º 2Θ) y donde la D50 del almotriptán malato es mayor que 20 micrómetros y la D90 es mayor que 50 micrómetros y el almotriptán malato es no micronizado.

12. Uso del almotriptán malato según cualquiera de las dos reivindicaciones anteriores, para la fabricación de comprimidos de liberación inmediata, preferiblemente uso en un proceso para la fabricación de dichos comprimidos, donde el proceso no comprende la micronización del almotriptán malato.

13. Un lote farmacéutico de al menos 10.000 unidades de la composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones de producto anteriores, preferiblemente: la cantidad de almotriptán malato en cada unidad es de alrededor de 17,0 a 18,0 mg; y/o donde las unidades están envasadas en blister, preferiblemente el blister es un blister de aluminio/aluminio o un blister de aluminio/PVC.

14. Un proceso para la preparación de una composición farmacéutica que comprende almotriptán malato según cualquiera de las reivindicaciones anteriores de composición farmacéutica, por granulación húmeda, por compresión directa o por granulación en seco.

15. Un proceso para la preparación de una composición farmacéutica que comprende almotriptán malato según cualquiera de las reivindicaciones anteriores de composición farmacéutica, donde el proceso comprende al menos la siguiente etapa (i):

i) formar una mezcla en polvo uniformemente distribuida que comprende al menos almotriptán malato y manitol, donde el manitol está en forma cristalina y la densidad aparente del manitol es inferior a 0,75 g/ml.

ii) granular en húmedo la mezcla en polvo con una mezcla del aglutinante y agua para formar los gránulos.

iii) secar los gránulos para eliminar los volátiles, preferiblemente hasta que el contenido de agua de los gránulos sea inferior al 2,5 % en peso medido por pérdida por desecación.

iv) mezclar los gránulos con los excipientes extragranulares, preferiblemente un diluyente y un antiadherente.

v) lubricar el granulado.

vi) comprimir el polvo uniformemente distribuido o los gránulos en una forma de comprimido.