

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 549 127**

51 Int. Cl.:

**A61K 9/48** (2006.01)

**A61K 31/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE REIVINDICACIONES DE SOLICITUD DE  
PATENTE EUROPEA

T1

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.03.2015** **E 15158167 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la solicitud europea: **16.09.2015** **EP 2918268**

30 Prioridad:

**10.03.2014 EP 14158478**

46 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de las reivindicaciones de la solicitud: **23.10.2015**

71 Solicitantes:

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

72 Inventor/es:

**ARROYO HIDALGO, SERGIO y**  
**PUIGVERT COLOMER, MARINA**

74 Agente/Representante:

**TORREJÓN NIETO, Javier**

54 Título: **Composiciones farmacéuticas que comprenden un principio activo**

ES 2 549 127 T1

## REIVINDICACIONES

- 1.- Una composición farmacéutica que comprende un granulado y un lubricante extragranular, donde dicho granulado comprende el principio activo racecadotril, y donde al menos el 60% del principio activo de la composición farmacéutica se disuelve en 30 minutos en un test de disolución de cestillos, a 100 rpm con una solución al 3% p/v de lauril sulfato sódico en agua como medio de disolución y un volumen de 900 ml por vaso.
- 2.- La composición farmacéutica según la reivindicación anterior, donde el lubricante se selecciona de entre ácido esteárico, estearato magnésico, polietilenglicol, estearil fumarato sódico, benzoato sódico y mezclas de los mismos, preferiblemente el lubricante es estearato magnésico o estearil fumarato sódico, más preferiblemente cuando el lubricante es estearato magnésico, dicho lubricante es exclusivamente extragranular.
- 3.- La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde el granulado comprende óxido de silicio coloidal hidrófilo que tiene un área superficial BET entre 150 y 250 m<sup>2</sup>/g.
- 4.- La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde la relación en peso principio activo:óxido de silicio coloidal hidrófilo es de entre 5:1 y 150:1.
- 5.- La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde la composición farmacéutica contiene una cantidad de principio activo por dosis unitaria de entre 9,5 y 10,5 mg, o entre 28,5 y 31,5 mg, o entre 95 y 105 mg, preferiblemente de entre 95 y 105 mg; y/o donde el tamaño de partícula del principio activo tiene una distribución en volumen con un D50 entre 2 y 9 micras y/o un D90 entre 14 y 35 micras, cuando se mide por análisis de difracción láser.
- 6.- La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde el granulado es un granulado de compresión; y/o donde el tamaño de partícula del granulado tiene una distribución en volumen con un D50 entre 50 y 250 micras y/o un D90 entre 380 y 720 micras, cuando se mide por análisis de difracción láser.
- 7.- La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, que además comprende al menos un ácido, preferiblemente el ácido es intragranular, más preferiblemente el ácido se selecciona de entre ácido tartárico, ácido cítrico y ácido ascórbico.
- 8.- La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, que comprende: un diluyente seleccionado de entre celulosa microcristalina, fosfato dicálcico, sorbitol, lactosa y mezclas de los mismos, preferiblemente el diluyente es lactosa monohidrato; y/o que comprende un disgregante seleccionado de entre almidón, almidón pregelatinizado, carboximetil celulosa sódica, croscarmelosa sódica, polivinil pirrolidona reticulada, hidroxipropil celulosa de baja sustitución y mezclas de los mismos, preferiblemente el disgregante es almidón de maíz pregelatinizado.
- 9.- La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde el granulado se fabrica mediante granulación en seco.
- 10.- Un comprimido, una cápsula, preferiblemente una cápsula dura, más preferiblemente una cápsula de gelatina dura, un sobre, un stick-pack o una suspensión líquida que comprende la composición farmacéutica tal y como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9.
- 11.- Un lote farmacéutico que comprende al menos 20.000 unidades, preferiblemente 50.000 unidades de la composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones anteriores.
- 12.- Un proceso para la fabricación de una composición farmacéutica que comprende un granulado y un lubricante extragranular, donde dicho granulado comprende el principio activo racecadotril, y donde al menos el 60% del principio activo de la composición farmacéutica se disuelve en 30 minutos en un test de disolución de cestillos, a 100 rpm con una solución al 3% p/v de lauril sulfato sódico en agua como medio de disolución y un volumen de 900 ml por vaso; donde el proceso comprende las siguientes etapas, y donde dichas etapas se llevan a cabo preferiblemente bajo luz roja:
- (i) mezclar el principio activo racecadotril con al menos un excipiente farmacéuticamente aceptable, preferiblemente con óxido de silicio coloidal hidrófilo con un área superficial BET entre 140 y 265 m<sup>2</sup>/g, donde la relación en peso principio activo:óxido de silicio coloidal hidrófilo es de entre 4:1 y 200:1;
  - (ii) granular la mezcla obtenida en la etapa (i), preferentemente por granulación en seco que comprende compactación, molienda y tamizado de la mezcla obtenida en la etapa (i); y
  - (iii) añadir al menos un lubricante extragranular a los granulos obtenidos en la etapa (ii).
- 13.- La composición farmacéutica obtenida mediante el proceso según se describe en la reivindicación anterior.

14.- La composición farmacéutica según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 o 13, la cápsula dura, el sobre o el stick-pack según la reivindicación 10, o el lote farmacéutico según la reivindicación 11, para su uso en el tratamiento de la diarrea.

5

15.- Una caja de cartón con un folleto de información para el paciente que comprende al menos un blíster de aluminio/PVC o de PVC/PVDC/aluminio con al menos 3 unidades de la composición farmacéutica tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 o en la reivindicación 13 o de la cápsula según la reivindicación 10, o que comprende al menos un sobre o al menos un stick-pack que comprende la composición farmacéutica tal y como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 o en la reivindicación 13.

10