

(19)



SUOMI - FINLAND

(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS

PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN

FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI 832295 A7**

(12) **JULKISEKSI TULLUT PATENTTIHAKEMUS
PATENTANSÖKAN SOM BLIVIT OFFENTLIG
PATENT APPLICATION MADE AVAILABLE TO THE
PUBLIC**

(21) Patentihakemus - Patentansökan - Patent application **832295**

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassifikation -
International patent classification (IPC⁴)
A61K 31/795

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **22.06.1983**

(23) Saapumispäivä - Ankomstdag - Reception date **22.06.1983**

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig - Available to the public **26.12.1983**

(43) Julkaisupäivä - Publiceringsdag - Publication date **12.06.2019**

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet - Priority

25.06.1982 US 392266

(71) Hakija - Sökande - Applicant

1 • National Starch and Chemical Corporation, 10 Finderne Avenue, Bridgewater, NJ 08876, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • Szymanski, Chester D., TOWN UNKNOWN, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Boco IP Oy Ab, Itämerenkatu 5, 00180 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

Ehkäisyaine.

Preventivmedel.

Ehkäisyaineseos Preventivmedelblandning

Laajat viime vuosina ihmisen syntyvyyden säännöstelyyn kohdistetut tutkimukset ovat johtaneet erilaisten ehkäisykeinojen kehittämiseen, joista esimerkkeinä mainittakoon suun kautta otettavat ehkäisyaineet, kohdunsisäiset laitteet (IUD), diafragmat ja emättimeen sijoitettaviksi tarkoitetut emätinkemikaalit. Kokemus on osoittanut, että mitään näistä keinoista ei ole todettu täysin turvalliseksi ja tyydyttäväksi. Niinpä 1950-luvulla kehitetyt suun kautta otettavat ehkäisyaineet, jotka yleisesti tunnetaan "pillereinä", ovat erittäin tehokkaita ja nykyään laajalti käytettyjä kautta koko maailman. Pillerien käyttö voi kuitenkin johtaa haitallisiin sivuvaikutuksiin, kuten päänsärkyyn ja pahoinvointiin, ja tähän käyttöön voi, vaikkakin harvoin, liittyä vakavampia systeemisiä vaikutuksia. IUD-välineet vaativat yleensä kouliintunutta lääkinnällistä apua ja valvontaa asianmukaista paikalleensijoittamista ja huoltoa varten, ja niiden on ilmoitettu aiheuttavan verenvuotoa.

Yleisimmin käytettyjen emätinkemikaalien joukossa ovat siittiöitä tappavat aineet, esim. polyetyleeniglykolin fysiologisesti hyväksyttävissä olevat mono-(alkyyylifenyyli)-eetterit, joiden alkyyyliryhmässä edullisesti on 1...10 hiiliatomia ja polyetyleeniglykoli edullisesti sisältää 2...12 etyleenioksyksiköitä, kuten nonoksinoli-9:a. Nämä ehkäisyaineet, joita hyvin usein käytetään yhdessä diafragman tai muun ehkäisylaitteen kanssa lisäehkäisysojan saamiseksi, tappavat tehokkaasti nisäkkään siittiön ja estävät täten munan hedelmöittymisen. Näitä kemikaaleja valmistetaan usein voiteina, hyytelöinä, puikkoina, vaahtoina ja vaahtoavina tabletteina, jotka on tarkoitettu sijoitettaviksi emättimeen välittömästi ennen yhdyntää.

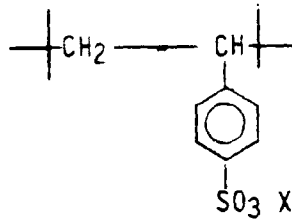
Pidettäessä edellä mainittuja puutteita edustavina on ilmeistä, että jotta mikä tahansa keino hedelmöittymisen estämiseksi

tai syntyvyyden säännöstelemiseksi voisi saavuttaa laajaa hyväksymistä, on tämän keinon oltava tehokas, turvallinen sekä lyhyt- että pitkäaikaisesti käytettäessä, edullisesti halpa ja helppo käyttää.

Tämän keksinnön ansiosta saadaan emättimeen sijoitettava ehkäisyaineseos, joka tehokkaasti ehkäisee suhteellisen pitkiä aikojakin sen käyttämisen jälkeen. Keksinnön mukaisen ehkäisyaineseoksen etuna tunnettuihin emättimeen sijoitettaviin ehkäisyaineisiin verrattuna on, että sillä on pidentynyt ehkäisevä fysiologinen vaikutus, eikä sitä tarvitse sijoittaa emättimeen välittömästi ennen yhdyntää. Keksinnön tarkemmat kohteet ilmenevät oheisista patenttivaatimuksista.

Emättimeen sijoitettava ehkäisyaineseos sisältää styreenin sulfonoidun homo- tai sekapolymeraatin suolaa ja farmaseuttisesti hyväksyttävää kantoainetta. Styreenin sulfonoidun polymeraatin suolan ja kantoaineen seosta on aikaisemmin käytetty haavaumia estävinä lääkkeinä GB patenttijulkaisun 1576016 ja US patenttijulkaisun 3 961 045 mukaisesti, sekä kosmeettisena aineena US patenttijulkaisun 3 862 309 mukaisesti. Keksinnön mukaan näitä seoksia voidaan yllättäen käyttää ehkäisyaineina. Tehokkaita polymeraatteja keksinnön mukaan ovat sulfonoidun styreenipolymeraatin natriumsuola, jonka polymeraatin substituoitu (D.S.) sulfonaattiryhmään nähden on noin 0,7...1,3 ja keskimolekyyllipaino on noin 3 000... 1 000 000. Niitä on läsnä noin 0,1...20 paino-% suuruisina määrinä ehkäisyaineseoksen painosta. Edullisena pidetty sulfonoitu polymeraatti on sulfonoidun styreenipolymeraatin natriumsuola, jonka polymeraatin D.S. on noin 0,9 ja keskimolekyyllipaino on noin 70 000...500 000. Vaikka tarkka raja ei ole selvä, näyttävät kokeilutulokset, että voimakkain ehkäisyvaikutus on polymeraateilla, joiden keskimolekyyllipaino on noin 70 000...noin 500 000. Arvon 70 000 alapuolella ja arvon 500 000 yläpuolella ehkäisyvaikutus vähitellen pienenee.

Sulfonoituja styreenimeerejä sisältävän polymeraatin rakenne on seuraava:



jossa kaavassa X on kationi.

Polymeraatti voi olla sulfonoitu polystyreeni tai styreenin sekapolymeraatti, jossa sulfonoitu styreeni ja toinen sopeutuva sekamonomeeri muodostavat polymeraatin rungon. Sisällytettäviksi soveltuvia sekamonomeereja tässä kysymykseen tulevien hyödyllisten sekapolymeraattien muodostamiseksi ovat mitkä tahansa styreenimonomeerien kassa sekapolymeroitavissa olevat etyleenisesti tyydyttämättömät monomeerit, joihin kuuluvat esim. maleiinihappoanhydridi, metakryylihappo, akryylihappo, metyyylimetakrylaatti, p-vinyylitolueeni ja alfa-metyylistyreeni. Edullisina pidetyt sekapolymeraatit ovat styreenin ja maleiinihappoanhydridin, metakryylihapon tai metyyylimetakryylin sulfonoidun sekapolymeraatin suolat. Käytetyn sekamonomeerimäärän olisi tavallisesti oltava enintään noin kolmannes osa lopullisesta styreenipolymeraatista, ja edullisesti käytetään sulfonoitua polystyreeniä (homopolymeraattia), koska ehkäisyvaikutuksen luullaan aiheutuvan sulfonoidusta styreenimeeristä. Sulfonoituja polymeerejä käytetään suolan muodossa, jolloin kationi on mikä tahansa yleinen kationi, esim. natrium, kalium, ammonium, tetrametyyliammonium, kalsium tai alumiini. Natriumsuolaa pidetään edullisena sen biologisen sopeutuvuuden ansiosta.

Keksinnön mukaisia ehkäisyaineseoksia valmistetaan sekoittamalla ja dispergoimalla sulfonoitu polymeraatti farmaseuttisesti hyväksyttävään kantoaineeseen, kuten öljymäiseen, vesipitoiseen tai hienojakoiseen kiinteiseen perusaineeseen, riippuen seoksen halutusta lopullisesta muodosta. Eräänä edullisena suoritusmuotona seokset ovat voiteena tai hyytelönä tai emätinpuikkona. Sulfonoidun polymeraatin suhde fysiologisesti

hyväksyttävään kantoaineeseen voidaan määrätä ottaen huomioon määrätyn yksikköannoksen vähintään se määrä, joka tehokkaasti estää hedelmöittymisen käsiteltyssä naaraassa. On ymmärrettävää, että sulfonoidun polymeraatin osuus jossain määrin riippuu sen liukoisuudesta ja nopeudesta, jolla se vapautuu siitä määrätystä kantoaineesta, jota käytetään määrättyjen yksikköannosten muodostamiseksi. Useimmat kysymykseen tulevat ehkäisyaineseokset tehdään sellaisen kaavan mukaan, että ne sisältävät noin 0,1...20 paino-% sulfonoitua polymeraattia. Ammattimies voi helposti määrätä tietyssä kantoaineessa tarvittavan sulfonoidun polymeraatin tarvittavan konsentraation määrättyä käyttöä varten. Valinnaisesti ehkäisyaineseos voi sisältää tunnettua siittiömyrkyä, edullisesti nonoksinoli-9:ää.

Keksinnön mukaisella seoksella voidaan säännöstellä syntyvyyttä antamalla ehkäisevä (hedelmöittymistä estävä) suoja lämminverisille naaraseläimille sijoittamalla emättimeen tässä selitettyä ehkäisyaineseosta yksikköannoksena. Merkityksellisen suuri osa täten käsiteltyistä naaraista ei hedelmöity riippumatta parittelusta tai yhdynnästä useiden tuntien jälkeen siitä, kun ehkäisyaineseos on annettu.

Mitä sulfonoidun polystyreenin ja sulfonoidun styreenikopolymeraatin valmistukseen tulee peruspolymeraatti ensin polymeroidaan soveltamalla mitä tahansa tunnettua polymerointimenetelmää, esim. soveltamalla massasuspensio-, liuos- tai emulsiomenetelmää. Peruspolymeraatin sulfonointi voidaan suorittaa esim. soveltamalla menetelmää, joka on selitetty US-patenttijulkaisussa 3 072 618, joka on myönnetty 8.1.1963 (A.F. Turbak), käyttämällä fosforiyhdiste-rikkitrioksidi-lisäaineita. Vaihtoehtoisesti sulfonoitu monomeeri voidaan polymeroida aktiivisen sulfonoidun polymeraatin muodostamiseksi suoraan, jolloin polymeerikemian ammattimiehet tuntevat esiintyvät rajoitukset.

Valitsemalla soveltuva farmaseuttinen kantoaine, voidaan keksinnön mukaiset ehkäisyaineseokset saada useina eri muotoina, joihin kuuluvat puolikiinteät valmisteet, kuten emätinvoiteet,

voiteet diafragmojen tai kondomien pinnoittamiseksi, hyytelöt, vaahdot, aerosolit, jne., samoin kuin kiinteät valmisteet, jotka pyrkivät pehmenemään tai sulamaan kehon lämpötilassa tai hajoamaan joutuessaan kosketukseen kosteuden kanssa. Kiinteistä seoksista mainittakoon emätinpuikot tai -tabletit, esim. polyetyleeniglykoliin tai glyseroliin perustuvat emätinpuikot, geelin muodostavat tabletit tai poreilevat tabletit ja emätinpuikot.

Sopivia voidevalmisteita valmistetaan käyttämällä vesiöljy- tai öljyvesiemulsioita. Emulsio voi sisältää öljyä, joita yleisesti käytetään farmaseuttisissa valmisteissa, kuten kasvisöljyä, esim. maapähkinäöljyä tai oliiviöljyä, tai rasvahappoja, rasva-alkoholeja ja näiden estereitä. Nämä voiteet voivat myös sisältää tavanomaisia emulgoimisaineita, kuten monoglyseridejä, alginaatteja, sorbitolin rasvahappoestereitä tai niiden etoksiloituja johdannaisia ja/tai paksuntimia. Vaahdot ja aerosolit sisältävät lisäksi fysiologisesti hyväksyttäviä tanaomaisia ponneaineita, kuten kloorifluorimetaania tai kloorifluorietaania.

Hyytelöitä valmistetaan käyttämällä vesipitoista perustaa ja geelin muodostavaa ja paksuntavaa komponenttia. Edullisia geelinmuodostusaineita ovat selluloosajohdannaiset, esim. selluloosaeetterit, varsinkin metyyli- tai etyyli-selluloosa, tai karboksymetyyli-selluloosa. Muita geelinmuodostus- ja paksuntamiskomponentteja ovat kasviskumit, jotka ovat stabiileja pH-arvoissa, jotka ovat rajoissa noin 4...9, varsinkin dragakantti- tai akasiakumi, polyvinyylialkoholi ja suuren molekyyllipainon omaavat sulfonoidut styreenipolymeraattit.

Muita keinoja polymeraattisuolojen antamiseksi ovat ns. "hietaasti vapautuvat" eli kestovalmisteet, joissa aktiivinen komponentti toimii suhteellisen pitkiä aikoja.

Muista lisäaineista, joita voidaan sisällyttää valmisteisiin, ovat hygroskooppiset aineet, kuten glyseroli tai propyleeniglykoli, fysiologisesti hyväksyttävät puskuriseokset, esim.

fosfaattipuskurit, homeenestoaaineet, kuten p-hydroksibentsoehappo, alemmat alkyylilästerit (esim. metyyliiparabeeni tai propyyliiparabeeni), tai sorbiinihappo, antiseptiset aineet, kuten boorihappo, kresolit, klooratut fenolit tai orgaaniset elohopeasuolat, kuten fenyylielohopea-asetatti, hapettumisen estoaaineet ja hajusteet. Kiinteät emätintabletit voivat sisältää kiinteitä geelinmuodostuksen kantoaineita, esim. edellä mainittuja geelinmuodostusaineita, muita vesiliukoisia ja/tai hygroskooppisia tavanomaisia farmaseuttisia kiinteitä kantoaineita, kuten laktoosia tai polyvinyylipyrrolidonia, ja ne voivat myös sisältää edellä mainittuja lisäaineita ja tavanomaisia tabletointi-lisäaineita, kuten sideaineita tai voiteluaineita. Emätinpuikot voivat sisältää polyetyleeniglykoleja, jotka normaalilämpötiloissa ovat kiinteitä, esim. seoksia, joissa on 15...40 % glykolia 6000, 9...26 % polyetyleeniglykolia 1540 ja 6...18 % polyetyleeniglykolia 400, karbovahoja ja glyserolia, mahdollisesti sekoitettuna farmaseuttisesti hyväksyttävien rasvojen ja emulgoimisaineiden ja edellä mainittujen lisäaineiden kanssa. Emätinpuikot voivat myös olla pehmeinä gelatiinikapseleina, jotka sisältävät nestemäistä tai puoliestemäistä vesiliukoista kantomateriaalia, kuten karboksimeyylliselluloosageelejä ja glyserolia, jolloin puikkoihin on lisätty noin 5...500 mg sulfonoidun polymeraatin suolaa. Seokset puskuroidaan edullisesti emättimen pH-arvoihin, toisin sanoen pH-arvoon noin 4,5...noin 5, mutta suuremmatkin pH-arvot, jopa noin 7,5, ovat myös hyväksyttäviä. Poreilevat emätinpuikot tai tabletit sisältävät lisäksi komponentteja, jotka vapauttavat inerttiä kaasua joutuessaan kosketukseen kosteuden kanssa, esim. NaHCO_3 :n ja Na_2HPO_4 :n seoksia, jotka muodostavat hiilidioksidia.

Seuraavat esimerkit kuvaavat keksinnön useita suoritusmuotoja.

Esimerkki I

Keksinnön mukaan erilaisia sulfonoituja polymeerisuoloja käyttäen valmistettujen ehkäisyaineseosten aktiviteetti "in vivo" kokeiltiin seuraavaa menetelmää soveltaen. Jokainen kokeilta-

vista polymeraattisuoloista muodostettiin geeliseokseksi, jonka konsentraatio oli 5, 25 ja 50 mg/ml, yhdistämällä suolaa ja tuotetta K-Y-Jelly (kaupan saatavaa). Kahta polymeraattisuolaa kokeiltiin ainoastaan 50 mg/ml konsentraationa. Jokaisesta valmistetta annettiin jokaisella konsentraatiolla 5 tai 10 kaniinille sijoittamalla 1,0 ml hyytelövalmistetta kaniinin emättimeen useita minutteja ennen kuin astutettiin todistettavasti hedelmällisellä koiraspuolisella kaniinilla.

Tämän jälkeen kaniinit astutettiin ja arvostettiin jokaista koekaniinia varten prosenttimääräinen tiineys ja kiinnittymisten lukumäärä. Käytettiin kontrollia, missä ei ollut mitään ehkäisyainetta, ja kantoaineen kontrollia, jossa ainoastaan tuotetta "K-Y-Jelly" sijoitettiin emättimeen vertailun vuoksi. Astutuksen jälkeen naaraspuoliset koekaniinit tapettiin viidentenätoista päivänä tiineydestä ja tiineyksien ja kiinnittymisten lukumäärä merkittiin. Tulokset on esitetty seuraavassa taulukossa I.

Taulukko I

Polymeraatti	Polymeraatin konsentraatio hyytelössä mg/ml	Tiineys % *	Kiinnittymiset (keskiarvo $\pm$ standardivirhe)
1. Kontrolli	0	100	9,0 $\pm$ 1,0
2. Kantoaineen kontrolli	0	80	7,2 $\pm$ 2,0
3. Polystyreenin natriumsuola, molek. paino 500 000, pääasiallisesti suoraviivainen	5 25 50	50** 30** 0**	2,6 $\pm$ 1,1 2,9 $\pm$ 1,5 0
4. Sulfonoidun polystyreenin natriumsuola, molek. paino 500 000, pääasiallisesti suoraviivainen, dialysoitu ja saostettu asetonista	5 25 50	20 0 20	0,8 $\pm$ 0,8 0 2,4 $\pm$ 2,4

5. Sulfonoidun poly- styreenin natrium- suola, molek.paino	5	20	1,2 $\pm$ 1,2
400 000, suora-	25	20	3,0 $\pm$ 3,0
viivainen	50	0	0
6. Sulfonoidun poly- styreenin natrium- suola, molek.paino	5	80	8,8 $\pm$ 2,2
70 000, suora-	25	40	2,0 $\pm$ 1,8
viivainen	50	0	0
7. Sulfonoidun styree- nin ja maleiinian- hydridisekapoly-me- raatin natrium-	5	100	6,6 $\pm$ 1,0
suola, molekyyli-	25	20	2,2 $\pm$ 2,2
paino 3 000	50	20	0,2 $\pm$ 0,2
8. Sulfonoidun polysty- reenin natriumsuola, molekyylipaino			
7 000 000, suora-	50	60	5,4 $\pm$ 2,9
viivainen			
9. Sulfonoidun poly- styreenin natrium- suola, molekyyli-			
paino 6...7 000 000, ristisilloitettu	50	80	4,8 $\pm$ 2,4
ksyleenidikloridilla			
10. Sulfonoidun styree- nin ja metyyylimetak- rylaatin 70/30	5	60	4,0 $\pm$ 1,7
sekapolymeraatin	25	40	1,6 $\pm$ 1,4
natriumsuola,	50	0	0
molek.paino noin 500 000			
11. Sulfonoidun sty- reenin ja metak- ryylihapon 93/7	5	40	3,4 $\pm$ 2,1
sekapolymeraatin	25	60	6,2 $\pm$ 2,7
natriumsuola,	50	20	0,8 $\pm$ 0,8
12. Sulfonoidun styree- nin ja metakryyli- hapon 93/7 sekapoly- meraatin natrium-	50	20	1,0 $\pm$ 1,0
suola, molek.paino noin 60 000, dialy- soitu ja jäädytys- kuivattu			

* Jokaista koetta varten käytettiin viisi kaniinia, paitsi

milloin muuta on mainittu

** Kymmenen kaniinia käytettiin.

Esimerkki II

Tämä esimerkki kuvaa edustavan seoksen ehkäisyvaikutusta pitemmän ajan kuluessa sen jälkeen, kun seos on sijoitettu emättimeen.

Esimerkin I polymeraattia 3, joka oli valmistettu käyttämällä tuotetta "K-Y- Jelly" hyytelövalmisteeeksi, annettiin 50 mg/ml suuruisina konsentraatioina viidelle tai kymmenelle kaniinille sijoittamalla 1,0 ml hyytelövalmistetta hyvin kaniinin emättimeen. Tietyn ajan annettiin kulua antamisesta ennen kuin astutettiin todistettavasti hedelmällisellä koiraskaniinilla. Astutuksen jälkeen jokaisen koekaniinin prosenttimääräinen tiineys ja kiinnittymisten lukumäärä tutkittiin. Tulokset on esitetty seuraavassa taulukossa II.

Taulukko II

Antamisen ja parittelun välinen aika, tunteja	Tiineys-prosentti*	Kiinnittymiset (keskiarvo $\pm$ standardivirhe)
0	0	0
1	0	0
4	0**	0
5	20	0,2 $\pm$ 0,2
6	0	0
7	40	4,6 $\pm$ 2,9
8	20**	1,2 $\pm$ 1,2
24	80	6,2 $\pm$ 2,4

* Viisi kaniinia käytettiin jokaista koetta varten, ellei muuta ole mainittu

** Kymmenen kaniinia käytettiin.

Nähdään, että tiineysprosentti ei merkityksellisesti suurene edes siinäkään tapauksessa, että astutus tapahtui useita tunteja sen jälkeen, kun keksinnön mukainen ehkäisyaineseos oli annettu.

Esimerkki III

Tämä esimerkki kuvaa emätinpuikon tyypillistä valmistetta, johon sisältyy sulfonoidun polystyreenin homopolymeraatin natriumsuolaa. Tarvittavat komponentit ovat:

	sadasosia
polyetyleeniglykolia 1000	91
polyetyleeniglykolia 300	2
metyyliiselluloosaa	2
sulfonoidun polystyreenin natrium- suolaa, molekyylipaino 500 000	5

Polyetyleeniglykoli 1000 sulatetaan ja sekoitetaan polyetyleeniglykolin 300 kanssa 66...70 °C:ssa. Tämän jälkeen metyyliiselluloosa ja sulfonoitu polystyreeni dispergoidaan lämpimään seokseen hitaasti sekoittaen, kunnes komponentit ovat perusteellisesti sekoittuneet. Seos jäädytetään noin 55 °C:een ja kaadetaan jäädytettyihin munanmuotoisiin muotteihin. Muotit sijoitetaan tämän jälkeen pakastimeen noin 2 tunniksi, minkä jälkeen puikot poistetaan ja ovat valmiita käyttöä tai päällystämistä ja varastointia varten.

Esimerkki IV

Tämä esimerkki kuvaa emätinpuikon toista valmistusta. Valmiste sisältää styreenin ja maleiinihappoanhydridin 90/100 paino-% sulfonoidun sekapolymeraatin suolaa, joka myös sisältää tuntuu siittiömyrkkyä.

	sadasosia
polyetyleeniglykolia 1000	80
polyetyleeniglykolia 4000	12
polyetyleeniglykolia 300	2

nonoksinoli-9:ää	1
styreenin ja maleiinihappoanhydridin	
sulfonoidun sekapolymeraatin natriumsuolaa,	
molekyyllipaino 3 000	3

Kiinteät polyetyleeniglykolikomponentit sulatetaan noin 66... 70 °C:ssa ja sekaan lisään polyetyleeniglykoli 300. Styreeni-kopolymeraatti ja nonoksinoli-9 dispergoidaan lämpimään seokseen hitaasti sekoittaen, kunnes komponentit ovat perusteellisesti sekoittuneet. Seos jäähdytetään noin 55 °C:een, ja sovelletaan esimerkin III mukaista menetelmää valmiiden emätinpuikkojen valmistamiseksi.

Yhteenvetona todetaan, että keksinnön ansiosta saadaan emätti-meen sijoitettava ehkäisyaineseos, joka on mukava käyttää ja joka on ehkäisevästi tehokas suhteellisen pitkiä aikoja antamisen jälkeen.

Patenttivaatimukset

1. Emättimeen sijoitettava ehkäisyaineseos, t u n n e t t u siitä, että se sisältää styreenin sulfonoidun homo- tai sekapolymeraatin suolaa ja farmaseuttisesti hyväksyttävää kantoainetta.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen seos, t u n n e t t u siitä, että sulfonoitu polymeeraatti on sulfonoidun styreenipolymeraatin natriumsuola, jonka keskimääräinen molekyylipaino on noin 3 000...1 000 000, ja substituutioaste on noin 0,7...1,3 ja sitä on läsnä noin 0,1...20 paino-% seosta.

3. Patenttivaatimuksen 2 mukainen seos, t u n n e t t u siitä, että sulfonoitu polymeeraatti on sulfonoitu polystyreeni, jonka keskimääräinen molekyylipaino on noin 70 000...500 000, ja substituutioaste on noin 0,9.

4. Patenttivaatimuksen 3 mukainen seos, t u n n e t t u siitä, että polymeeraatti on styreenin ja maleiinihappoanhydridin tai styreenin ja metakryylihapon tai styreenin ja metyyli-metakrylaatin sulfonoidun sekapolymeraatin suola.

5. Patenttivaatimuksen 3 mukainen seos, t u n n e t t u siitä, että seos sisältää siittiömyrkkyä nonoksinoli-9.

6. Menetelmä patenttivaatimuksen 1 mukaisen ehkäisyaineseoksen valmistamiseksi, t u n n e t t u siitä, että sulfonoitu polymeeraatti sekoitetaan tai dispergoidaan farmaseuttisesti hyväksyttävään kantoaineeseen.

7. Patenttivaatimuksen 6 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä, että käytetään noin 0,1...20 paino-% sulfonoitua polymeeraattia, ja tunnettu edelleen siitä, että kantoaineena on öljymäinen, vesipitoinen tai hienojakoinen kiinteä perusaine.

8. Patenttivaatimuksen 6 mukainen menetelmä, t u n n e t t u siitä, että seos on voiteena tai hyytelönä tai emätinpuikkona.

Patentkrav

1. Kontraktiv blandning för vaginal givning, k ä n n e t e c k n a d därav, att den innehåller ett salt av ett sulfonerat homo- eller kopolymerat av styren och en farmaceutiskt acceptabel bärare.

2. Blandning enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a d därav, att det sulfonerade polymeratet är natriumsaltet av ett sulfonerat styrenpolymerat med en medelmolekylvikt om ca 3 000...1 000 000 och en substitutionsgrad om ca 0,7...1,3, och är närvarande i en mängd om ca 0,1...20 vikts-% av blandningen.

3. Blandning enligt patentkravet 2, k ä n n e t e c k n a d därav, att det sulfonerade polymeratet är sulfonerad polystyren och har en medelmolekylvikt om ca 70 000...500 000 och en substitutionsgrad om ca 0,9.

4. Blandning enligt patentkravet 3, k ä n n e t e c k n a d därav, att polymeratet är ett salt av ett sulfonerat kopolymerat av styren och maleinsyraanhydrid eller av styren och metakrylsyra eller av styren och metylmetakrylat.

5. Blandning enligt patentkravet 3, k ä n n e t e c k n a d därav, att blandningen innehåller spermiciden nonoxinol-9.

6. Förfarande för framställning av den kontraktiva blandningen enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a t därav, att man blandar eller dispergerar det sulfonerade polymeratet i den farmaceutiskt acceptabla bäraren.

7. Förfarande enligt patentkravet 6, k ä n n e t e c k n a t därav, att man använder ca 0,1...20 vikts-% sulfonerat polymerat, och vidare kännetecknat därav, att bäraren är en oljeartad, vattenhaltig eller finfördelad fast bas.

8. Förfarande enligt patentkravet 6, k ä n n e t e c k n a t därav, att blandningen är i form av en kräm eller ett gelé eller en vaginasuppositorie.



Missing part

Viitejulkaisuja - Anförda publikationer

Julkisia suomalaisia patenttihakemuksia: - Offentliga finska patentansökningar

Hakemus-, kuulutus- ja patenttijulkaisuja: - Ansökningspublikationer,
utläggnings- och patentskrifter:FI

CH

DE

DK

FR

GB P-1576 016 (AGIK 31/795)NO

SE

US P-3862309 (AGIK 7/00), P-3961045 (AGIK
31/74)

EP

WO

Muita julkaisuja: - Andra publikationer:

Helena Tallis

Allekirjoitus