



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2020134408, 22.03.2019

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:

23.03.2018 EP 18305328.9;

23.03.2018 US 62/763,129

(43) Дата публикации заявки: 29.04.2022 Бюл. № 13

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 23.10.2020

(86) Заявка РСТ:

EP 2019/057267 (22.03.2019)

(87) Публикация заявки РСТ:

WO 2019/180217 (26.09.2019)

Адрес для переписки:

143430, Московская обл., Нахабино, Советская,
28, кв. 59

(71) Заявитель(и):

ЛЯБОРАТУА МАЖЁ (FR)

(72) Автор(ы):

ЭЛЬ ГЛЯВИ, Гийём (FR),

ЭЛЬ ГЛЯВИ, Меди (FR),

ПЕРА, Филипп (FR),

ДРУПИ, Стефан (FR),

АГЕТОН-МЕРЬЕ, Вероник (FR)

(54) Применение композиции для негормональной контрацепции и упаковка

(57) Формула изобретения

1. Применение композиции для негормональной контрацепции для субъекта мужского пола, при этом указанная композиция является составом с пролонгированным высвобождением, включающим:

антагонист альфа-1-адренорецепторов и

минимум один фармацевтически приемлемый носитель,

причем контрацепция включает однократный суточный прием указанной композиции ежедневно приблизительно в одно и то же время, что инициирует длительную обратимую аспермию, азооспермию или тяжелую олигозооспермию у субъекта мужского пола, и после первоначального периода минимум в два последовательных дня задержка в приеме последующей однократной суточной дозы не влияет на контрацептивное действие, и антагонистом альфа-1-адренорецепторов является (R)-силодозин.

2. Применение по п. 1, где композиция принимается перорально.

3. Применение по п. 1 или 2, где после первоначального периода из последовательных дней задержка в приеме следующей дозы может составлять от 6 до 18 часов после времени последнего регулярного приема суточной дозы и состояние аспермии, азооспермии или тяжелой олигозооспермии у субъекта мужского пола поддерживается.

4. Применение по любому из пп. 1-3, где после первоначального периода из последовательных дней пропуск приема однократной суточной дозы не влияет на длительное состояние аспермии, азооспермии или тяжелой олигозооспермии, обеспечивая

эффективность метода контрацепции на протяжении от 36 до 48 часов со времени последнего приема.

5. Применение по любому из пп. 1-4, где метод контрацепции применяется на протяжении, по крайней мере, восьми дней.

6. Применение по любому из пп. 1-5, где количество антагониста альфа-1-адренорецепторов варьирует от около 0,1 до около 30 мг, предпочтительно от около 0,2 до около 20 мг.

7. Применение по любому из пп. 1-6, где (R)-силодозин имеет полиморфную или аморфную форму.

8. Применение по любому из пп. 1-7, где композиция включает, по крайней мере, одну частицу или состоит, по крайней мере, из одной частицы, предпочтительно, по крайней мере, из одной покрытой частицы, и средний диаметр частицы находится в диапазоне от 0,01 до 5 мм, предпочтительно от 0,1 до 2 мм.

9. Применение по п. 8, где частицы помещаются в капсулу, при этом каждая капсула заполняется частицами в количестве, достаточном для получения суточной дозы.

10. Применение по любому из пп. 1-9, где контрацептивное действие обеспечивается независимо от приема пищи субъектом мужского пола.

11. Применение по любому из пп. 1-10, где контрацепция с ежедневным приемом также включает одновременный или последовательный прием дополнительной композиции, подходящей для лечения эректильной дисфункции; предпочтительно такая дополнительная композиция содержит ингибитор фосфодиэстеразы-5.

12. Упаковка, содержащая, по крайней мере, 7, 14, 28, 56, 84 или от 168 до 365 единичных доз; или 10, 20, 30, 60, 90 или от 180 до 360 единичных доз композиции по любому из пп. 1-10, при этом единичная доза является суточной дозой.

13. Упаковка по п. 12, где композиция включает (R)-силодозин в количестве от около 0,1 до около 30 мг, предпочтительно, от около 0,2 до около 20 мг, и предпочтительно от 8 до 12 мг.

А
8
0
4
4
3
1
0
2
0
2
R
U

R
U
2
0
2
0
1
3
4
4
0
8
A