[19]中华人民共和国国家知识产权局

[51]Int. Cl[7]
A61K 31/21
A61F 6/04

[12]发明专利申请公开说明书

[21]申请号 99803716.8

[43]公开日 2001年4月25日

[11]公开号 CN 1292691A

[22]申请日 1999.1.28 [21]申请号 99803716.8
[30]优先权
[32]1998.1.30 [33]GB [31]9802078.7
[86]国际申请 PCT/GB99/00288 1999.1.28
[87]国际公布 WO99/38506 英 1999.8.5
[85]进入国家阶段日期 2000.9.6
[71]申请人 富图拉医药有限公司
地址 英国汉普郡
[72]发明人 科林·A·肯普
[74]专利代理机构 柳沈知识产权律师事务所
代理人 巫肖南

权利要求书1页 说明书3页 附图页数0页

[54]发明名称 用于治疗勃起机能障碍的制剂

[57]摘要

三硝酸甘油酯和羊毛脂的组合在制备治疗男性勃起机能障碍的组合物中的用途，和用于男性美容治疗的方法。

ISSN1008-4274

知识产权出版社出版

权 利 要 求 书

1.化合物的组合在制备治疗男性勃起机能障碍的组合物中的用途，所述化合物的组合含有三硝酸甘油酯和羊毛脂。

2.用于改善男性身体外观的美容治疗方法，其包括向阴茎施用含有有效量的三硝酸甘油酯和羊毛脂的组合物，使得所述组合物渗透阴茎体的皮肤中。

3.一种治疗男性勃起机能障碍的方法，其包括向阴茎施用含有有效量的三硝酸甘油酯和羊毛脂的组合物，使得所述组合物渗透阴茎体的皮肤中。

4.三硝酸甘油酯和羊毛脂组合作为美容产品的用途。

5.根据权利要求 1 或 4 的用途或权利要求 2 或 3 的美容治疗方法，其中三硝酸甘油酯以细碎的微粒形式吸附在固体稳定剂上。

7.根据权利要求 6 的用途和方法，其中三硝酸甘油酯以按重量计 5-20 % 的浓度吸附在乳糖上。

8.根据上述任一权利要求的用途或方法，其中三硝酸甘油酯以按重量计最多 5 % 的浓度存在。

9.根据上述任一权利要求的用途或方法，其中所述组合物还含有物理稳定剂。

10.根据权利要求 9 的用途或方法，其中所述组合物还含有水。

11.根据上述任一权利要求的用途或方法，其中所述组合物主要由 10 % 重量三硝酸甘油酯(10 %，在乳糖中)、44 %(重量)羊毛脂、21 %(重量)白石蜡 B.P.和 25 %(重量)软化水组成。

12.根据权利要求 1 中的组合物与阴茎套结合的用途。

13.权利要求 1 中定义的组合物和阴茎套的结合。

说　明　书

用于治疗勃起机能障碍的制剂

本发明涉及用于局部施用于男性性器官，尤其用于治疗勃起机能障碍的制剂。

勃起机能障碍是男性普遍的问题，虽然通常不公开讨论。在通常情况下它不被认为是易于治疗的医学症状，在很大程度上这是由精神状况引起的或至少是在最初经历后由于失去信心而加剧的，所述最初经历可能是由于疲劳或过度饮食或饮酒导致的。然而，对于受害者所产生的心理上的损害其结果是严重的，在许多情况下破坏正常的受精过程，以致如果需要生育就必须采用人工授精方法。已经建议了克服该问题的方法，包括外科移植变硬装置，如 GB-A-1476804 、 US5242391 和其它专利中所述。已经建议了化学治疗方法，它需要在性交前直接注射血管扩张药组合物，注射在阴茎体上或附近。没有一种方法是有吸引力的，两种方法都会导致部分使用的患者的反感或痛苦。 US-A-5059603 和 US-A-4801587 建议了含有血管扩张药的组合物的局部应用。 US-A-5059603 建议使用包括在有助于活性组分通过阴茎皮肤吸收的载体中的血管扩张药和血管收缩药的组合的组合物，选择活性组分使得血管扩张药比血管收缩药更迅速地起作用，因而由血管扩张药的作用而引起的阴茎的勃起由于血管收缩药的作用而持续。适用于该组合物的所述血管扩张药包括硝酸甘油、罂粟碱、肼苯酞嗪、硝普化钠和苯氧苄胺等。血管收缩药包括咖啡因、 3-(2-氨基乙基)吲哚衍生物和肾上腺素。 US-A-4801587 建议软膏形式的组合物，其包括在基质中与作为皮肤吸收剂的二甲基亚砜混合的选自罂粟碱、肼苯酞嗪、硝普化钠、苯氧苄胺和芬妥胺的血管扩张药。在 US-A-5059603 中二甲基亚砜也被建议用作相同用途。

我们现在发现硝酸甘油(三硝酸甘油酯)可作为血管扩张药在局部施用于阴茎的组合物中与不含已知是有毒物质的血管收缩药或二甲基亚砜的载体物质结合使用，因而该组合物能有效治疗勃起机能障碍。

根据本发明的一个方面，其提供了在制备治疗男性勃起机能障碍的组合物中化合物组合的用途，所述化合物组合含有三硝酸甘油酯和羊毛脂。

根据本发明的另一方面，提供了一种治疗男性勃起机能障碍的方法，其包括向阴茎施用含有有效量的三硝酸甘油酯和羊毛脂的组合物，使得所述组合物渗透阴茎体的皮肤中。

在性交前使用本发明的方法导致阴茎勃起，它不仅能够进行随后的性交，而且向受治疗的男性提供作为性伴侣的能力重新树立信心的精神状况，并可向其它伴侣提供减轻任何有关其刺激她的伴侣达到性唤起状态能力的缺少自信的感觉。因此，本发明的方法是获得精神安宁的特定状态的措施或是提高或促进性要求或性信心的方法，在提高亲密性欲活动环境中男性解剖学的外观方面具有美容附加作用。

在另一方面，本发明还包括三硝酸甘油酯和羊毛脂在治疗男性的勃起机能障碍中的用途。

三硝酸甘油酯根据例如在治疗心绞痛方面它确定的效用用作血管扩张药，但至今没有认识到其与羊毛脂简单地组合可提供男性勃起机能障碍的有效治疗。

三硝酸甘油酯本身是爆炸性物质。为用于本发明中，它优选以细碎的微粒形式吸附在固体稳定剂上，所述微粒是亚微米尺寸范围以使得它们能够通过皮肤。优选的稳定剂化合物是乳糖，在其上面三硝酸甘油酯可以按重量计 5-20 %，例如按重量计 10 % 的浓度吸附。三硝酸甘油酯优选以按重量计占总制剂的最多 5 % 的浓度存在，按重量计 1 %-2 % 的浓度通常是足够有效的。

羊毛脂用作润滑剂或增湿剂，同时提高皮肤吸收。已知它是无毒的，对于本发明应使用医用级的，例如“ Medilan ”(商标)。

本发明的组合物优选还包括物理稳定剂，例如石蜡乳油；所述组合物还选择性地含有其它组分，例如香料和/或色素。石蜡乳油，例如白石蜡 B.P.(White Soft Paraffin B. P.)增进了组合物在皮肤上的稳定性，还用作防水剂和润滑剂。

本发明的组合物还包括水以调节整体粘度或活性组分的稠度和浓度至所需程度，考虑到易于使用，所述组合物应是在乳状液中的活性成分的物理稳定悬浮液的形式，它有足够低的粘度以便易于施用和在正常体温下在阴茎皮肤上扩散。

本发明使用的组合物的一个实例在下面给出：

组分	重量%
三硝酸甘油酯(10 %，在乳糖中)	10
羊毛脂(“ Medilan ”)	44
白石蜡 B.P.(White Soft Paraffin B. P.)	21
软化水	25

在使用中，两克上述白色乳液形式的制剂施用于阴茎头和阴茎体，轻轻地按摩进入皮肤。效果是产生阴茎勃起，持续约 45 分钟。产生勃起的效果可通过触觉、听觉和/或视觉的其它刺激提高。

所述制剂可与阴茎套结合使用，其中将所述制剂施用于阴茎，在达到勃起后用手带上阴茎套。与制剂结合使用的阴茎套优选是非乳胶类型的，例如由聚氨酯制成的。