



(19)
Bundesrepublik Deutschland
Deutsches Patent- und Markenamt

(10) **DE 600 07 179 T2 2004.08.12**

(12) **Übersetzung der europäischen Patentschrift**

(97) **EP 1 276 477 B1**

(21) Deutsches Aktenzeichen: **600 07 179.0**

(86) PCT-Aktenzeichen: **PCT/GB00/03490**

(96) Europäisches Aktenzeichen: **00 958 873.2**

(87) PCT-Veröffentlichungs-Nr.: **WO 01/019359**

(86) PCT-Anmeldetag: **12.09.2000**

(87) Veröffentlichungstag
der PCT-Anmeldung: **22.03.2001**

(97) Erstveröffentlichung durch das EPA: **22.01.2003**

(97) Veröffentlichungstag
der Patenterteilung beim EPA: **10.12.2003**

(47) Veröffentlichungstag im Patentblatt: **12.08.2004**

(51) Int Cl.7: **A61K 31/195**
A61P 19/02

(30) Unionspriorität:
9921985 16.09.1999 GB

(73) Patentinhaber:
**Britannia Pharmaceuticals Ltd., Redhill, Surrey,
GB**

(74) Vertreter:
Dr. Weitzel & Partner, 89522 Heidenheim

(84) Benannte Vertragsstaaten:
**AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LI, LU, MC, NL, PT, SE**

(72) Erfinder:
**SHERWOOD, Paul, London W1N 2PA, GB;
DAVIES, Keith, David, West Wickham, Kent BR4
9DJ, GB**

(54) Bezeichnung: **PANTOTHENSÄURE-ENTHALTENDE ARZNEIMITTEL ZUR BEHANDLUNG VON ENTZÜNDLICHEN GELENKSERKRANKUNGEN**

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99 (1) Europäisches Patentübereinkommen).

Die Übersetzung ist gemäß Artikel II § 3 Abs. 1 IntPatÜG 1991 vom Patentinhaber eingereicht worden. Sie wurde vom Deutschen Patent- und Markenamt inhaltlich nicht geprüft.

Beschreibung

[0001] Diese Endung betrifft Medikamente und deren Verwendung in der Behandlung von Gelenkentzündungen und Gelenkschmerzen.

[0002] Schmerzen oder Beweglichkeitseinschränkungen in Gelenken sind häufige Erscheinungen, insbesondere bei älteren Personen oder bei Personen, die Schädigungen an Knorpeln, Knochenoberflächen oder Bändern (Ligamenta) erlitten haben.

[0003] Zu den Standardbehandlungen gehört die Verabreichung von Kortikosteroiden mittels Injektion in den Situs der Entzündung. Die Besserung ist allerdings meistens nur vorübergehend, und langfristige Anwendungen bringen eine Reihe von Kontraindikationen mit sich.

[0004] Pantothersäure, (manchmal auch als Vitamin B5 bezeichnet) und ihre Salze wurden als Diätergänzung und zur Behandlung von Bronchialasthma, Heuschnupfen, Sinusitis und Neurodermatitis angewendet.

[0005] CH 682803 offenbart die intramuskuläre Verabreichung von Pantothersäure für die Behandlung der Polyarthrit.

[0006] GB 1145623 offenbart die gleichzeitige Verwendung von α -Pantothersäure und Cystein für die Behandlung der Osteoarthritis.

[0007] Es hat sich nun herausgestellt, dass Pantothersäure wirksam in der Reduzierung von Entzündungen ist, wenn sie in den Bereich des betroffenen Gelenks injiziert wird.

[0008] Gemäß der vorliegenden Erfindung wird die Verwendung von Pantothersäure oder einem Derivat derselben in der Herstellung eines Medikaments geschaffen, das durch Injektion in den Bereich eines Gelenks zur Besserung von Entzündungen oder Schmerzen verabreicht wird.

[0009] Die Pantothersäure kann in Form eines Salzes, z. B. des Calciumsalzes, verwendet werden. Pantothersäure ist eine in Pflanzen- und Tiergeweben natürlich vorkommende Substanz. Eine besonders reichhaltige Quelle ist Gelee royale von Honigbienenwölkern. Sie kann in ihrem natürlichen Zustand oder als chemisch reines Material verwendet werden. Synthetische Zubereitungsmethoden umfassen jene, die in US-Patent Nr. 2,780,645; 2,845,456 und 2,934,428 beschrieben werden. Die freie Säure und ihre Salze sind wahlweise aktiv, und das rechtsdrehende Isomer wird bevorzugt.

[0010] Herkömmlicherweise wird ein Medikament durch Lösen des Wirkstoffes, d. h. der Pantothersäure oder eines Derivats, in einem geeigneten Lösemittel, z. B. Wasser, und Injizieren der Lösung in das betroffene Gelenk präpariert. Die Erstbehandlung kann einige Schmerzen verursachen, und es kann deshalb wünschenswert sein, gleichzeitig oder kurz vor der Injektion der Pantothersäure gemeinsam ein Lokalanästhetikum, z. B. Lignocain, zu verabreichen.

[0011] Es können auch andere physiologisch wirksame Materialien gemeinsam verabreicht werden, z.

B. Cystein oder Glucosamin.

[0012] Es kann auch wünschenswert sein, im gleichen Behandlungsregime ein oberflächenaktives Phospholipid (SAPL) zu verabreichen, wie beispielsweise Dipalmitoyl-Phosphatidylcholin (DPPC) oder Phosphatidyl-Glycerol (PG). Vorzugsweise wird eine Mischung aus DPPC und PG verwendet. Eine bevorzugte proteinfreie SAPL-Zusammensetzung aus einer Mischung von DPPC und PG ist bei Britannia Pharmaceuticals Ltd. in Brighton Road, Redhill unter dem Markennamen „Alec“ erhältlich. Von SAPLs wie „Alec“ wird angenommen, dass sie in Gelenken als Schmiermittel aktiv sind und teilweise die Funktion der Synovialflüssigkeit zu übernehmen.

[0013] Die Medikamente dieser Erfindung können in der Behandlung unterschiedlicher Krankheiten in Verbindung mit Entzündungen oder Beweglichkeitseinschränkungen von Gelenken verwendet werden. Beispiele sind der Tennisellbogen, die Bursitis praepatellaris, fibröse Schultersteife, Knie- und Hüftgelenkentzündungen sowie Rückenschmerzen in Verbindung mit Entzündungen oder einer eingeschränkten Beweglichkeit der Rückenwirbel.

[0014] Eine typische Dosis ist etwa 2 ml einer wässrigen Lösung von etwa 500 mg des Säuresalzes. Das Medikament wird direkt in den Situs des entzündeten Gelenks injiziert. Wünschenswert ist im Allgemeinen ein Injektionsprogramm, bei dem Dosierungen ähnlich der oben angezeigten in Intervallen von wenigen Tagen bis zu etwa einer Woche gegeben werden. Reduzierte Entzündungen und erhöhte Beweglichkeit sind in der Regel etwa eine Woche nach der Erstinjektion feststellbar.

Patentansprüche

1. Verwendung von Pantothersäure oder eines daraus abgeleiteten Derivats für die Herstellung eines Medikaments, das zur Linderung einer Entzündung oder von Schmerzen mittels Injektion im Bereich eines entzündeten oder schmerzenden Gelenks verabreicht wird.

2. Verwendung nach Anspruch 1, wobei das Derivat ein Salz der Pantothersäure ist.

3. Verwendung nach Anspruch 2, wobei das Salz Calciumsalz ist.

4. Verwendung nach einem der vorangehenden Ansprüche, wobei das Medikament eine wässrige Lösung der Pantothersäure oder eines Derivats derselben umfasst.

5. Verwendung nach einem der vorangehenden Ansprüche, wobei das Medikament gemeinsam mit einer Lokalanästhesie zu verabreichen ist.

6. Verwendung nach einem der vorangehenden Ansprüche, wobei das Medikament gemeinsam mit

Zystein oder Glucosamin zu verabreichen ist.

7. Verwendung nach einem der vorangehenden Ansprüche, wobei das Medikament gemeinsam mit einem oberflächenaktiven Phospholipid (SAPL) zu verabreichen ist.

8. Verwendung nach Anspruch 7, wobei das SAPL Dipalmitoylphosphatidylcholin enthält.

9. Verwendung nach Anspruch 7 oder 8, wobei das SAPL Phosphatidylglycerin enthält.

10. Verwendung nach einem der Ansprüche 1 bis 9, bei der das Gelenk von einer Beeinträchtigung betroffen ist, die ausgewählt ist aus Tennisellenbogen, Bursitis praepatellaris, fibröse Schultersteife, Kniegelenks- und Hüftgelenksentzündung sowie Rückenschmerzen in Verbindung mit einer Entzündung oder eingeschränkter Bewegung in den Rückenwirbeln.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen