



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21)(22) Заявка: 2011146058/14, 13.04.2010

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
13.04.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
14.04.2009 US 61/169,149

(43) Дата публикации заявки: 20.05.2013 Бюл. № 14

(45) Опубликовано: 27.02.2015 Бюл. № 6

(56) Список документов, цитированных в отчете о поиске: US 6,143,754, 07.11.2000. EA 6805 B1, 28.04.2006. CN 1980660 A, 13.06.2007, реф. WO 2008/079245 A2, 03.07.2008. SPITZ I.M. et al. The use of progesterone antagonists and progesterone receptor modulators in contraception// Steroids. 2000 Oct-Nov; 65(10-11):817-23, реф., найдено [31.10.2012] из Интернет www.pubmed.com. BASTIANELLI C. et al. Emergency (см. прод.)

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на национальной фазе: 14.11.2011

(86) Заявка РСТ:
EP 2010/054812 (13.04.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2010/119029 (21.10.2010)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(72) Автор(ы):

УЛЬМАНН Андре (FR),
ГЕЙНЕР Эрин (FR)

(73) Патентообладатель(и):

ЛАБОРАТУАР ХРА-ФАРМА (FR)

(54) СПОСОБ КОНТРАЦЕПЦИИ, ИСПОЛЬЗУЕМЫЙ ПО МЕРЕ НЕОБХОДИМОСТИ

(57) Реферат:

Изобретение относится к медицине, гинекологии, способам контрацепции по мере необходимости, экстренной контрацепции. Осуществляют пероральное введение улипристалацетата или его метаболита женщине через более чем 72 часа и до 120 часов после полового контакта в количестве от 20 до 30 мг. Возможно повторное введение по меньшей мере дважды в

месяц. Возможно введение в виде формы с мгновенным высвобождением, в форме таблетки. Способ обеспечивает высокую эффективность экстренной контрацепции даже при низких дозах и позднем введении препарата - до 120 часов после полового контакта в сравнении с эталонным препаратом левоноргестрел. 6 з.п. ф-лы.

(56) (продолжение):

contraception//Minerva Ginecol. 2006 Jun; 58(3):193-204, реф., найдено [31.10.2012] из Интернет
www.pubmed.com. MITCHELL D.CREININ et al. Progesterone receptor modulator for emergency
contraception: a randomized controlled trial// Obstet.Gynecol. 2006 Nov;108(5):1089-1097

R U 2 5 4 2 7 7 9 C 2

R U 2 5 4 2 7 7 9 C 2



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(19) **RU** (11) **2 542 779** (13) **C2**

(51) Int. Cl.

A61P 15/18 (2006.01)

A61K 31/56 (2006.01)

A61K 31/57 (2006.01)

A61K 9/20 (2006.01)

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21)(22) Application: **2011146058/14, 13.04.2010**

(24) Effective date for property rights:
13.04.2010

Priority:

(30) Convention priority:
14.04.2009 US 61/169,149

(43) Application published: **20.05.2013** Bull. № 14

(45) Date of publication: **27.02.2015** Bull. № 6

(85) Commencement of national phase: **14.11.2011**

(86) PCT application:
EP 2010/054812 (13.04.2010)

(87) PCT publication:
WO 2010/119029 (21.10.2010)

Mail address:

**129090, Moskva, ul. B. Spasskaja, 25, stroenie 3,
OOO "Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery"**

(72) Inventor(s):

**UL'MANN Andre (FR),
GEJNER Ehrin (FR)**

(73) Proprietor(s):

LABORATUAR KhRA-FARMA (FR)

(54) BIRTH CONTROL TECHNIQUE USED AS AND WHEN NECESSARY

(57) Abstract:

FIELD: medicine.

SUBSTANCE: invention refers to medicine, gynaecology, birth control techniques used as and when necessary, and emergency contraception. Ulipristal acetate or its metabolite is administered orally in a female no more than 72 hours to 120 hours after a sexual encounter in a dose of 20 to 30 mg. Another dose can be administered again at least twice a month. The preparation can be administered either in the form of

an immediate-release dosage form, in the form of a tablet.

EFFECT: method provides the high efficacy of emergency contraception even in low doses and late administration of the preparation - up to 120 hours after the sexual encounter as compared to a reference preparation of levonorgestrel.

7 cl

Настоящее изобретение относится к способам контрацепции, используемым по мере необходимости, женщины, в особенности женщин, которые не имеют регулярной сексуальной активности.

Уровень техники

5 Гормональную контрацепцию рассматривают на сегодняшний день как наиболее надежный способ обратимой контрацепции. Она требует непрерывного приема пилюль, как правило, ежедневного приема, вне зависимости от частоты половых контактов. Для женщин с нечастым половым контактом, однако, препараты, которые зависят от
10 полового акта и, таким образом, могут приниматься менее часто, с пониженным воздействием эффективных ингредиентов, могли бы быть более предпочтительными. Будучи признанной в течение длительного периода времени (Canzler et al., Zbl. Gynakol, 1984, 106: 1182-1191), потребность в такой контрацепции, используемой по мере необходимости, остается нереализованной (Aitken et al., Contraception, 2008, 78:S28-S35).

Собственно говоря, женщины создают такие способы сами из существующих
15 (имеющихся в наличии) продуктов. В Гане, в исследовании, проведенном в 2003 году, сообщалось, что женщины использовали таблетки норетиндрона, продаваемые на рынке для лечения различных гинекологических проблем, в качестве контрацептивного средства, применяемого перорально «по мере необходимости». Совсем недавно, анекдотичные доклады и данные, собранные коллегами в организации Family Health
20 International, показывают, что женщины в других частях Африки и где-либо еще преднамеренно используют контрацептивные пилюли для экстренной контрацепции таким же образом.

Несмотря на то что пероральные способы не обеспечивают защиту от передаваемых половым путем инфекций, исследования, проведенные несколько десятилетий назад,
25 показали, что различные дозы левоноргестрела, применяемые в качестве регулярно используемого посткоитального контрацептивного средства, могут обеспечивать защиту с эффективностью, сравнимой с общей эффективностью кондомов и других барьерных способов при обычном использовании (United Nations Development Programme/ United Nations Population Fund/ World Health Organization/ World Bank Special Programme
30 of Research, Development and Research Training in Human Reproduction, Task Force on Post-Ovulatory Methods of Fertility Regulation. Efficacy and side effects of immediate postcoital levonorgestrel used repeatedly for contraception. Contraception 2000; 61:303-8). Кроме того, было предложено оценивать, может ли повлиять на овуляторный процесс единичное вагинальное введение геля левоноргестрела до полового контакта (Brache et al.,
35 Contraception, 2007; 76:111-116).

Другие прогестативные препараты были использованы в качестве посткоитальной экстренной контрацепции. Экстренная контрацепция (ЕК) относится к дублирующим способам экстренной контрацептивной помощи, к которой женщина может прибегнуть в пределах первых нескольких дней после незащищенного полового контакта для
40 предотвращения нежелательной беременности. Например, доклинические исследования и первые клинические испытания с улипристал-ацетатом, разработанным компанией HRA Pharma для экстренной контрацепции, подтвердили, что однократная доза, составляющая 50 мг улипристал-ацетата, является безопасной и эффективной, когда ее вводят женщине, которая обращается к экстренной контрацепции в пределах 72
45 часов после незащищенного полового контакта (Creinin et al., 2006, Obstetrics and Gynecology, 108(5):1089-1097).

Краткое изложение сущности изобретения

Изобретение обеспечивает способ контрацепции, где способ включает введение по

мере необходимости прогестогенного средства или модулятора рецептора прогестерона женщине в пределах 72 часов до полового контакта, где введение может быть выполнено повторно, по меньшей мере однократно в неделю.

Изобретение также обеспечивает способ контрацепции, включающий введение по мере необходимости прогестогенного средства или модулятора рецептора прогестерона женщине в пределах 120 часов после полового контакта, предпочтительно по меньшей мере дважды в месяц.

В предпочтительном варианте осуществления, изобретение обеспечивает способ контрацепции, где способ включает введение по мере необходимости прогестогенного средства или модулятора рецептора прогестерона, такого как 17а-ацетокси-11b-[4-N,N-диметиламино-фенил]-19-норpregна-4,9-диен-3,20-дион (улипристал-ацетат) или его метаболит, женщине в пределах 72 часов до полового контакта, где введение может быть выполнено повторно, по меньшей мере однократно в неделю.

Изобретение также обеспечивает способ контрацепции, включающий введение по мере необходимости прогестогенного средства или модулятора рецептора прогестерона, такого как 17а-ацетокси-11b-[4-N,N-диметиламино-фенил]-19-норpregна-4,9-диен-3,20-дион (улипристал-ацетат) или его метаболит, женщине в пределах 120 часов после полового контакта, предпочтительно по меньшей мере дважды в месяц.

Подробное описание изобретения

Авторы изобретения изучили, мог бы улипристал-ацетат быть использован не только в качестве экстренного контрацептивного средства, но также в качестве регулярно принимаемого гормонального контрацептивного средства.

Для этой цели здоровые волонтеры-женщины с нормальным менструальным циклом получали 3 месяца непрерывное ежедневное введение улипристал-ацетата (2,5, 5 или 10 мг) или плацебо. Оценку гормонов яичника, развития фолликулов, гистологии эндометрия и особенностей менструального кровотечения проводили во время третьего месяца лечения. Одна пациентка (получала лечение посредством 10 мг улипристал-ацетата/день) пропустила 2 дня приема лекарственного средства в свой третий цикл лечения (дни 1 и 2) и еще не имела признака лютеальной активности или овуляции. Это побудило авторов изобретения подумать над тем, что улипристал-ацетат мог бы быть использован в качестве контрацептивного средства, которое могло бы приниматься по мере необходимости, а не каждый день как любая гормональная контрацептивная пиллюля.

На этой основе изобретение обеспечивает способ контрацепции по мере необходимости, где способ включает введение прогестогенного средства или модулятора рецептора прогестерона, такого как 17а-ацетокси-11b-[4-N,N-диметиламино-фенил]-19-норpregна-4,9-диен-3,20-дион (улипристал-ацетат) или его метаболит, женщине в пределах 72 часов до полового контакта и/или в пределах 120 часов после полового контакта.

Изобретение дополнительно обеспечивает способ контрацепции, где способ включает непрерывное введение прогестогенного средства или модулятора рецептора прогестерона, такого как улипристал-ацетат или его метаболит, женщине. В особенности, прогестогенное средство или модулятор рецептора прогестерона, такой как улипристал-ацетат или его метаболит, может быть введено менее чем один раз в день, во время менструального цикла. Предпочтительно, его вводят по меньшей мере однократно в неделю во время менструального цикла.

В более общем смысле, авторы изобретения предлагают применять прогестогенные средства или модуляторы рецепторов прогестерона для контрацепции по мере

необходимости.

Прогестогенные средства

Прогестогенные средства, также называемые как прогестины, могут представлять собой любое соединение, обладающее прогестагенной активностью.

Прогестогенные средства могут быть выбраны из прогестерона и его производных, таких как, например, сложные эфиры 17-гидрокси-прогестерона, сложные эфиры 19-нор-17-гидрокси-прогестерона, из 17 α -этинилтестостерона и его производных, 17 α -этинил-19-нор-тестостерона и его производных, норетиндрона, норетиндрон-ацетата, этинодиол-диацетата, дидрогестерона, медрокси-прогестерон-ацетата, норетинодрела, аллилэстренола, линоэстренола, фуингестанол-ацетата, медрогестона, норгестриенона, диметидерома, этистерона, ципротерон-ацетата, левоноргестрела, DL-норгестрела, D-17 α -ацетокси-13 β -этил-17 α -этинил-гон-4-ен-3-он-оксима, гестодена, дезогестрела, норгестимата, несторона и дроспиренона.

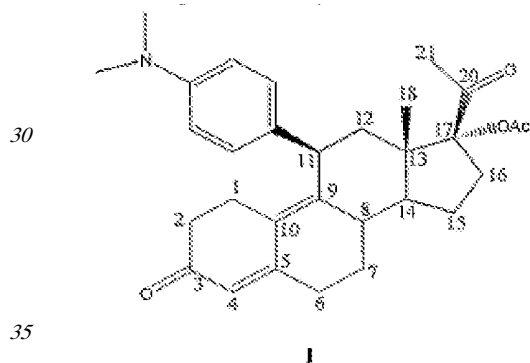
В предпочтительном варианте осуществления, следует понимать, что прогестогенное средство не комбинируют ни с каким другим гормональным контрацептивным средством, например с эстрогеном. В этом случае контрацептивное средство часто называют как контрацептивное средство «только-прогестин».

Модуляторы рецепторов прогестерона

Модуляторы рецепторов прогестерона для применения в настоящем изобретении могут быть выбраны, например, из улипристал-ацетата, мифепристона или из средства CDB-4124 или его активных метаболитов.

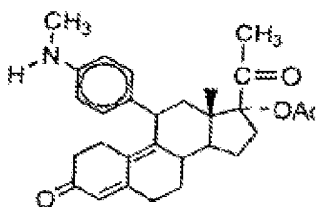
Предпочтительный модулятор рецепторов прогестерона представляет собой улипристал-ацетат.

Улипристал-ацетат, прежде называемый как CDB-2914, представляет собой 17 α -ацетокси-11 β -[4-N,N-диметиламино-фенил]-19-норpregна-4,9-диен-3,20-дион, представленный формулой I

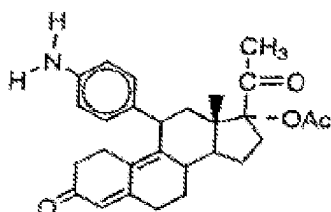


Он представляет собой общеизвестный стероид, более конкретно 19-норпрогестерон, который обладает антипрогестогенной и антиглюкокортикоидной активностью. Это соединение и способы его получения описаны в патентах: U.S. Patent Nos. 4954490, 5073548 и 5929262 и в международных заявках на патент: WO 2004/065405 и WO 2004/078709. Свойства этого соединения дополнительно описаны в публикациях: Blithe et al., 2003, Steroids, 68:1013-1017, и Gainer and Ulmann, 2003, Steroids, 68:1005-1011.

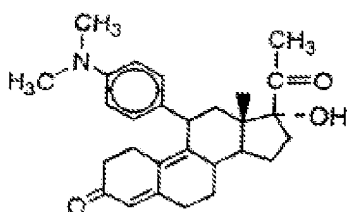
Метаболиты CDB-2914 включают соединения, описанные в публикации Attardi et al., Journal of Steroid Biochemistry & Molecular Biology, 2004, 88: 277-288, например, монодеметилированный CDB-2914 (CDB-3877); дидеметилированный CDB-2914 (CDB-3963); 17 α -гидрокси CDB-2914 (CDB-3236); производное CDB-2914 с ароматическим А-кольцом (CDB-4183).



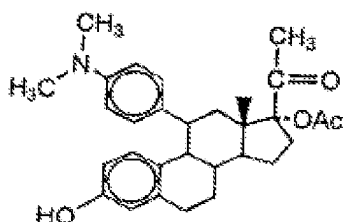
монодеметилованный CDB-2914



дидеметилилованный CDB-2914



17α-гидрокси CDB-2914



производное CDB-2914 с ароматическим А-кольцом

По мере необходимости

Субъект или пациент может представлять собой любую женщину. Изобретение обеспечивает «контрацепцию, применяемую по мере необходимости», что означает, что женщина может принять прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона, например улипристал-ацетат или его метаболит, в любой момент времени в том случае, когда это требуется, то есть когда половой контакт ожидается или недавно произошел. Предпочтительно, женщина не применяет никакой другой гормональный контрацептивный лекарственный препарат. В еще одном предпочтительном варианте осуществления, субъект не применяет никакую защиту (кондом, внутриматочное устройство, спермицид и так далее).

Женщина может захотеть применять прогестогенное средство или модулятор рецептора прогестерона, например улипристал-ацетат или его метаболит, в качестве регулярно используемого контрацептивного средства в том случае, когда ее половая активность становится более регулярной. Предпочтительно введение затем выполняют повторно, по меньшей мере однократно в неделю, предпочтительно однократно в неделю или четыре раза в течение менструального цикла, или дважды в течение менструального цикла, или три раза в течение менструального цикла. Термин «выполняют повторно» означает то, что одну единицу дозирования прогестогенного

средства или модулятора рецептора прогестерона, например, улипристал-ацетата или его метаболита, вводят дважды или более в течение менструального цикла.

В любом случае, женщина всегда применяет прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона, например улипристал-ацетат или его метаболит, по мере необходимости, а не на ежедневной основе, и предпочтительно не более чем десять дней подряд, предпочтительно не более чем девять, восемь, семь, шесть, пять, четыре, три или два дня подряд. Предпочтительно прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона, например улипристал-ацетат или его метаболит, не вводят более чем четыре дня, три или два дня подряд.

Пути введения

Прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона, например улипристал-ацетат или его метаболит, может быть введено любым удобным путем, включая пероральный, буккальный, сублингвальный, парентеральный, трансдермальный, вагинальный, ректальный пути и так далее.

Для краткого рассмотрения способов настоящего изобретения в отношении доставки лекарственного средства смотри публикацию Langer, Science 249:1527-1533 (1990), которая включена в этот документ путем ссылки. Способы получения вводимых соединений известны или очевидны для специалистов в данной области и описаны более подробно, например, в книге Remington's Pharmaceutical Science, 17th Ed., Mack Publishing Company, Easton, Pa. (1985), которая включена в этот документ путем ссылки и которая в дальнейшем в этом документе называется как «Remington».

Одноразовые стандартные дозировки составов с мгновенным высвобождением являются предпочтительными.

Для твердых композиций могут быть использованы обычно применяемые нетоксичные твердые носители, которые включают, например, фармацевтические категории маннита, лактозы, крахмала, стеарата магния, сахарина натрия, талька, целлюлозы, глюкозы, сахарозы. Для перорального введения фармацевтически приемлемую нетоксичную композицию получают путем внедрения любого из обычно применяемых эксципиентов, таких как те носители, которые перечислены выше.

Пероральные твердые лекарственные формы предпочтительно представляют собой прессованные таблетки или капсулы. Прессованные таблетки могут содержать разбавители для увеличения объема прогестогенного средства или модулятора рецепторов прогестерона для того, чтобы иметь возможность производить прессованную таблетку практически осуществимого размера. Связующие вещества, которые представляют собой вещества, которые придают когезионные качества порошковым веществам, также могут быть необходимы. Могут быть использованы повидон, крахмал, желатин, сахара, такие как лактоза или декстроза, и природные и синтетические камеди. Разрыхлители, как правило, являются необходимыми в таблетках для облегчения распадаемости таблетки. Разрыхлители включают крахмалы, глины, целлюлозы, альгины, камеди и сшитые полимеры. Наконец, небольшие количества веществ, называемых как скользящие вещества и регуляторы сыпучести (глитанты), включают в таблетки для предотвращения адгезии материала таблетки к поверхностям в технологическом процессе и для улучшения характеристик сыпучести порошкового материала в ходе изготовления. Коллоидный диоксид кремния является наиболее часто применяемым в качестве регулятора сыпучести, а соединения, такие как тальк, стеарат магния или стеариновые кислоты, являются наиболее часто используемыми в качестве скользящих веществ. Методики получения и изготовления прессованных таблеток хорошо известны специалистам в данной области (см. Remington).

Капсулы представляют собой твердые лекарственные формы, в которых предпочтительно используется либо твердая, либо мягкая желатиновая оболочка в качестве контейнера для смеси прогестогенного средства или модулятора рецепторов прогестерона и инертных ингредиентов. Методики получения и изготовления твердых желатиновых и мягких упругих капсул хорошо известны специалистам в данной области (см. Remington).

Буккальные или сублингвальные формы или устройства также являются полезными.

Для парентерального введения жидкие стандартные дозированные лекарственные формы приготавливают с использованием соединений и стерильной среды для лекарства, где вода является предпочтительной. Прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона, в зависимости от используемой среды для лекарства и от используемой концентрации, может быть либо суспендировано, либо растворено в среде для лекарства. При приготовлении растворов соединение может быть растворено в воде для инъекции и подвергнуто фильтрации и стерилизации до заливки в подходящую пробирку или ампулу и до герметизации. Преимущественно вспомогательные средства, такие как местное обезболивающее средство, консервант и вещества, способствующие образованию буферного раствора, могут быть растворены в среде для лекарства. Для усиления стабильности композиция может быть заморожена после заливания в пробирку, а вода может быть удалена под вакуумом. Сухой лиофилизированный порошок затем герметизируют в пробирке и в комплекте с ней поставляют дополнительную пробирку с водой для инъекции для восстановления жидкости (раствора, суспензии) перед применением. Парентеральные суспензии могут быть приготовлены практически аналогичным способом за исключением того, что соединения суспендируют в среде для лекарства вместо того, чтобы их растворять, и стерилизация не может быть выполнена посредством фильтрации. Соединение может быть стерилизовано воздействием этиленоксида перед суспендированием в стерильной среде для лекарства. Преимущественно в композицию включают поверхностно-активное вещество или смачивающее вещество для содействия однородному распределению прогестогенного средства или модулятора рецепторов прогестерона.

Кроме того, для доставки прогестогенного средства или модулятора рецепторов прогестерона может быть применен суппозиторий или пессарий. Активное соединение может быть внедрено в любую из известных основ для суппозитория известными в данной области способами. Примеры таких основ включают масло какао, полиэтиленгликоли (карбоваксы), полиэтиленсорбитмоностеарат и смеси этих соединений с другими совместимыми веществами для модифицирования температуры плавления или скорости растворения. Эти суппозитории могут весить от приблизительно 1 до 2,5 грамм.

Трансдермальные системы доставки, включающие вещество, способствующее проникновению внутрь, и герметичную основу трансдермальной системы, находят применение для доставки прогестогенного средства или модулятора рецепторов прогестерона. Примеры веществ, способствующих проникновению внутрь, включают диметилсульфоксид, диметилацетамид и диметилформамид. Чрезкожные гели могут быть преимущественными тоже. Примеры таких гелей описаны, например, в патенте U.S. Patent 5904931.

Прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона может быть введено вагинальным путем, например в форме геля или вагинального устройства.

В другом варианте осуществления, способ изобретения включает введение по мере необходимости влагалищного устройства, такого как контрацептивное влагалищное

кольцо, которое высвобождает прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона, женщине в пределах 24 часов до или после полового контакта.

Контрацептивное влагалищное кольцо обычно содержит синтетический полимер, который может представлять собой силиконовый эластомер или несиликоновую смолу.

5 В конкретном варианте осуществления, кольцо содержит полимерную сердцевину, окруженную внешним полимерным слоем, содержащим прогестогенное средство или модулятор рецептора прогестерона. В конкретном варианте осуществления, кольцо является таким же, как кольцо, описанное в международной патентной заявке WO 2006/010097.

10 Предпочтительно контрацептивное влагалищное кольцо удаляют в пределах 12 часов после полового контакта. Наиболее предпочтительно контрацептивное влагалищное кольцо оставляют на месте в течение минимум 6-12 часов.

Пероральный путь является предпочтительным. В сравнении с пероральными путями другие пути введения могут быть подходящими с использованием уровней в крови для
15 обеспечения клинического успеха.

Дозировки

Одноразовая стандартная дозировка прогестогенного средства или модулятора рецепторов прогестерона, например улипристал-ацетата или его метаболита, может находиться между 10 и 40 мг, предпочтительно 20 мг или 30 мг. Предпочтительно
20 одноразовая стандартная дозировка прогестогенного средства или модулятора рецепторов прогестерона, например улипристал-ацетата или его метаболита, представляет собой такую дозировку, которая должна быть введена перорально.

Режим введения дозы

В первом варианте осуществления изобретения, прогестогенное средство или
25 модулятор рецепторов прогестерона, например улипристал-ацетат или его метаболит, может быть введено в пределах 72 часов до полового контакта, предпочтительно в пределах 48 часов до полового контакта, более предпочтительно в пределах 24 часов до полового контакта, еще более предпочтительно в пределах 12 часов до полового контакта.

30 Во втором варианте осуществления изобретения, прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона, например улипристал-ацетат или его метаболит, может быть введено в пределах 120 часов после полового контакта, предпочтительно в пределах 72 часов после полового контакта, более предпочтительно в пределах 48 часов после полового контакта, еще более предпочтительно в пределах 24 часов после
35 полового контакта, даже более предпочтительно в пределах 12 часов после полового контакта.

В предпочтительном варианте осуществления, введение выполняют повторно, по меньшей мере дважды в месяц, предпочтительно три раза в месяц или однократно в неделю.

40 Для достижения оптимальной эффективности два варианта осуществления могут быть скомбинированы, то есть прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона, например улипристал-ацетат или его метаболит, может быть введено в пределах 72 часов до полового контакта, и та же самая женщина также может принять прогестогенное средство или модулятор рецепторов прогестерона, например улипристал-
45 ацетат или его метаболит, в пределах 120 часов после полового контакта.

Следующий пример предоставляется лишь с целью иллюстрации, и не для ограничения.

Пример: Многократный прием внутрь улипристал-ацетата в пределах менструального

цикла

Несколько женщин получали улипристал-ацетат (30 мг) после заявленного полового контакта, дважды в течение менструального цикла.

Беременность не была зафиксирована.

5

10

15

Пациент	1 ^й прием	2 ^й прием
Женщина 1	Половой контакт: 11 Декабря, 2007 г. 06:00* Прием Улипристал-ацетата: 13 Декабря, 2007 г. 11:25	Половой контакт: 14 Декабря, 2007 г. 21:00 Прием Улипристал-ацетата: 14 Декабря, 2007 г. 14:37
Женщина 2	Половой контакт: 12 Декабря, 2007 г. 05:00 Прием Улипристал-ацетата: 14 Декабря, 2007 г. 11:05	Половой контакт: 15 Декабря, 2007 г. 23:00 Прием Улипристал-ацетата: 18 Декабря, 2007 г. 10:45
Женщина 3	Половой контакт: 15 Декабря, 2007 г. 06:00 Прием Улипристал-ацетата: 17 Декабря, 2007 г. 11:40	Половой контакт: 15 Декабря, 2007 г. 22:00 Прием Улипристал-ацетата: 18 Декабря, 2007 г. 11:15
Женщина 4	Половой контакт: 14 Декабря, 2007 г. 01:00 Прием Улипристал-ацетата: 17 Декабря, 2007 г. 12:20	Половой контакт: 07 Декабря, 2007 г. 20:00 Прием Улипристал-ацетата: 12 Декабря, 2007 г. 10:58
Женщина 5	Половой контакт: 5 Ноября, 2007 г. 06:00 Прием Улипристал-ацетата: 08 Ноября, 2007 г. 15:30	Половой контакт: 2 Ноября, 2007 г. 08:00 Прием Улипристал-ацетата: 5 Ноября, 2007 г. 15:00
*время выражено в 24-часовом формате		

Формула изобретения

20

1. Способ контрацепции, включающий пероральное введение улипристал-ацетата или его метаболита женщине через более чем 72 часа и до 120 часов после полового контакта в количестве от 20 до 30 мг.

2. Способ по п. 1, где способ выполняют повторно, по меньшей мере дважды в месяц.

3. Способ по п. 1, где улипристал-ацетат или его метаболит вводят в дозировке 30 мг.

25

4. Способ по п. 1, где улипристал-ацетат или его метаболит вводят в дозировке 20 мг.

5. Способ по п. 1, где улипристал-ацетат или его метаболит вводят в виде формы с мгновенным высвобождением.

30

6. Способ по п. 1, где улипристал-ацетат или его метаболит вводят в форме таблетки.

7. Способ по п. 1, где указанный способ является способом экстренной контрацепции.

35

40

45