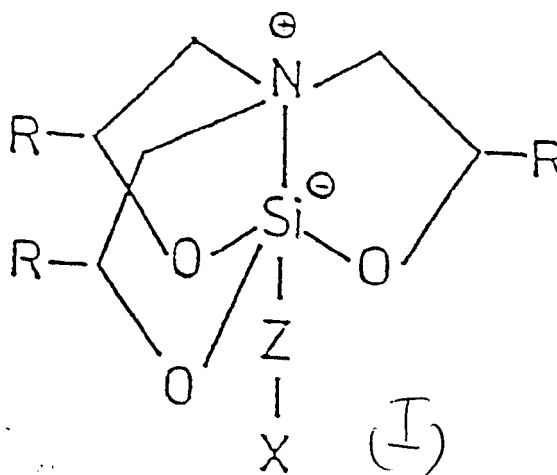


KIUVONAT

A találmány szerinti készítmény (I) általános képlettel szilatrán hatóanyagot tartalmaz,



~~képlet szerinti szilatrán hatóanyagot tartalmazza,~~

ahol

R = H vagy CH₃,

Z = egy adott esetben klórral szubsztituált, 1-3 szénatomot tartalmazó kétvegyértékű csoport, és

X = H, kis szénatomszámú alkil, aril, halogén, CF₃, CN, NH₂,

SH, CNS, R₁M, (R₂O)₂P(O), R₃C(O)M, ahol R₁ = alkil,

egyenesláncú vagy elágazó, 1-4 szénatommal, aril, aralkil, alkaril,

M = O, S, R₂ = metil, etil, R₃ = alkil, 1-4 szénatommal,

fluoralkil, 1-4 szénatommal, vagy aril.

9

P0400916

KÖZZÉTÉVE

A₂

Transzdermális terápia
Készítmény a gyapjú- és hajhullás megelőzésére és/vagy
kezelésére

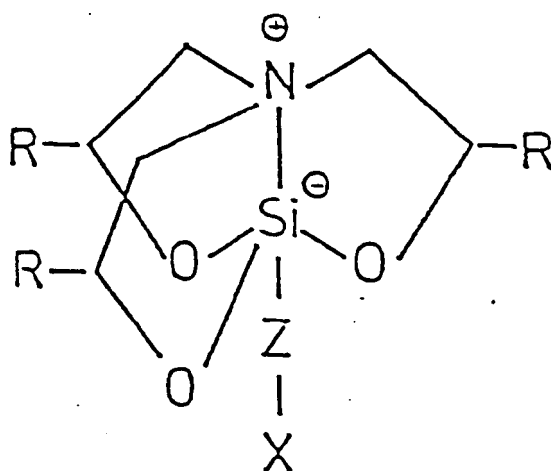
A találmány tárgya a gyapjú- és hajhullás megelőzésére és/vagy kezelésére szolgáló transzdermális terápiás rendszer (TTS).

A szubsztituált szilatránok hatékonysága gyapjú- és hajnövesztő szerként a 26 15 654 számú német szabadalmi leírásból ismert. Ebben különösen a felhasznált vegyület jó elviselhetőségét emelik ki. A leírás szerint az alkalmazás történhet a táplálékhoz való hozzáadás útján, ami különösen állatoknál indokolt, vagy pedig kenőcsökkel vagy szuszpenziókkal való bedörzsöléssel. Heti többszöri használat mellett a kezelési idő hónapokig tart. Mivel ennek során a páciens együttműködésével kapcsolatos igények nagyok, továbbá nehéz a ténylegesen bejuttatott hatóanyag mennyiségének ellenőrzése a kenőcs vagy szuszpenzió felvitelének ismeretes hátrányai miatt, a technika jelenlegi állását nem tekinthetjük kielégítőnek.

Ebből kiindulva a találmánynak az a feladata, hogy az alkalmazás új formáját hozza létre, amely kiküszöböli a szubsztituált szilatránok felhasználásának ismertett

hátrányait a gyapjú- és hajhullás megelőzésében és/vagy kezelésében.

Ezt a feladatot úgy oldjuk meg, hogy az alábbi képletnek megfelelő szubsztituált szilatránokat



tartalmazó készítményt egy transzdermális terápiás rendszer formájában állítjuk elő.

A fenti képletben

R = H vagy CH₃

Z = egy adott esetben klórral szubsztituált, 1-3 szénatomot tartalmazó kétvegyértékű csoport, és

X = H, kis szénatomszámú alkil, aril, halogén, CF₃, CN, NH₂,

SH, CNS, R₁M, (R₂O)₂P(O), R₃C(O)M, ahol

R_1 = alkil, egyenesláncú vagy elágazó, 1-4 szénatommal, aril,

aralkil, alkaril, $M = O, S$

R_2 = metil, etil, R_3 = alkil 1-4 szénatommal, fluoralkil 1-4

szénatommal, vagy aril.

A TTS terápiás rendszerek egy vagy több hatóanyagot tartalmaznak, amelyek előre meghatározott sebességgel egy adott időn át folyamatosan leadásra kerülnek egy kijelölt alkalmazási helyen (Heilmann, Therapeutische Systeme - Konzept und Realisation programmierter Arzneiverabreichung, [Terápiás rendszerek: a szabályozott gyógyszerleadás elve és megvalósítása], 4. kiadás, Ferdinand Enke Verlag Stuttgart, 1984, 26.o.).

E terápiás rendszereken belül a találmány szerint a transzdermális tapaszok egyebek között azért előnyösek, mert a szilatránok golyószerű molekula-alakjuk következtében alkalmasak a bőrön való áthatolásra.

A tapasz formájú TTS ismert a szakember számára. Alkatórészei általában egy át-nem-eresztő hátsóréteg, egy ahhoz kapcsolódó hatóanyagtartály, egyéb szabályozó mechanizmus híján a hatóanyag leadását vezérlő membrán, egy tapadást biztosító réteg a tapasznak a bőrhöz való rögzítésére és szükség esetén egy védőréteg, amely alkalmazás előtt

eltávolítandó. Ha a hatóanyagtartály maga is tapad, a TTS előállítható oly módon, hogy a hatóanyagot, a segédanyagot és a tapadást biztosító polimert megfelelő oldószerben homogén módon eloszlatjuk, az oldatot a hátsórétegre felkenjük, az oldószert eltávolítjuk és a készítményt védőréteggel látjuk el. A rétegek felvitelének sorrendje meg is fordítható.

Elvben a tartály olvadékból is előállítható.

A találmány szerint felhasználandó hatóanyagok előállítása a 25 22 982 számú német szabadalomban le van írva. Jó elviselhetősége miatt különösen előnyös az 1-(klórmetil)-szilatrán és az 1-(etoxi)-szilatrán.

A szilatrán-csoportba tartozó hatóanyagok közül legalább egynek a koncentrációja a tartályban 0,1-50 tömeg-%, előnyösen 3-25 tömeg-%, és különösen előnyösen 5-15 tömeg-%. Az egy tapaszban lévő adag a rétegvastagsággal és a tartály felületének méretével állítható be, és egyebek között a páciens életkora és bőrfelülete, továbbá a hajhullás típusa és mértéke alapján határozható meg.

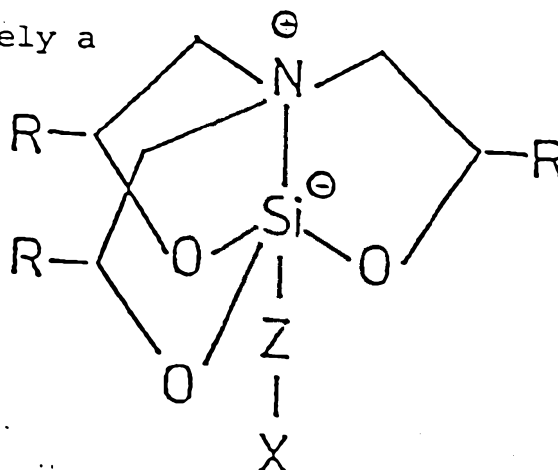
Állatoknál való felhasználás esetén hasonló megfontolások lehetnek irányadók.

A szilatrántartalmú TTS egy hosszabb időn át használható alkalmazási formá a gyapjú- és hajhullás megelőzésére és

kezelésére, amely lehetővé teszi egyetlen alkalmazás hatásidejének elnyújtását hetekre és hónapokra, és egyben biztosítja a hatóanyag kívánt adagolását. A szilatránok rendszerjellegű hatása ezenfelül elkerülhetővé teszi a lokális alkalmazást.

Szabadalmi igénypontok

1. Készítmény a gyapjú- vagy hajhullás megelőzésére és/vagy kezelésére, amely a



képlet szerinti szilatrán hatóanyagot tartalmazza, ahol

$R = H$ vagy CH_3 ,

Z = egy adott esetben klórral szubsztituált, 1-3 szénatomot tartalmazó kétvegyértékű csoport, és

$X = H$, kis szénatomszámú alkil, aril, halogén, CF_3 , CN , NH_2 ,

SH , CNS , R_1M , $(R_2O)_2P(O)$, $R_3C(O)M$, ahol $R_1 =$ alkil,

egyenesláncú vagy elágazó, 1-4 szénatommal, aril, aralkil, alkaril,

$M = O$, S , $R_2 =$ metil, etil, $R_3 =$ alkil, 1-4 szénatommal, fluoralkil, 1-4 szénatommal, vagy aril,

azzal jellemezve, hogy a készítmény transzdermális terápiás rendszer.

2. Az 1. igénypont szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy tapasz.

3. A 2. igénypont szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy a tapasz alkotórészei egy át-nem-eresztő hátsóréteg, egy azzal összekapcsolt hatóanyagtartály, egyéb szabályozó mechanizmus híján a hatóanyag leadását szabályozó membrán, a tapasznak a bőrhez való rögzítésére szolgáló tapadóréteg, és adott esetben egy a tapasz alkalmazása előtt eltávolítandó védőréteg.

4. Az 1.-3. igénypontok közül egy vagy több szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy az 0,1-50 tömeg-%, előnyösen 3-25 tömeg-%, és különösen előnyösen 5-15 tömeg-% hatóanyagot tartalmaz.

5. Az 1.-4. igénypontok közül egy vagy több szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy az hatóanyagként 1-(klórmetyl)-szilatránt tartalmaz.

6. Az 1.-4. igénypontok közül egy vagy több szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy az hatóanyagként 1-(etoxi)-szilatránt tartalmaz.

A képviselő:

ADVOPATENT
SZABADALMI ÉS VÉDJEJY IRODA
KARÁCSONYI BÉLA
szabadalmi ügyvivő

rajzi melléklet
NT