



УКРАЇНА

(19) UA (11) 43337 (13) C2

(51) 7 A61K31/57, A61K31/565,  
A61P17/10МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІОПИС  
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ГОРМОНАЛЬНИЙ ЗАСІБ ДЛЯ ЛІКУВАННЯ ВУГРІВ

(21) 95125308

(22) 03 06 1994

(24) 17 12 2001

(31) P4321957 8-41

(32) 01 07 1993

(33) DE

(86) PCT/DE94/00629, 03 06 1994

(46) 17 12 2001, Бюл. № 11, 2001 р

(72) Ерліх Маріка, DE, Куль Герберт, DE

(73) ЕРЛІХ МАРИКА, DE, КУЛЬ ГЕРБЕРТ, DE

(56) DE, 4104385, A61K 31/565, 13 10 1992

(57) 1 Гормональное средство для лечения угрей, состоящее из двух пространственно раздельно размещенных в общей упаковке и предназначенных для последовательного во времени раздельного приема *per os* гормональных компонентов, которые по мере надобности разделены на несколько пространственно обособленных суточных доз в раздельно вскрываемых ячейках упаковки, причем первый гормональный компонент содержит в качестве гормонально действующего вещества по существу только эстрогенный препарат, который активирует глобулин, образующий комплексы с половыми гормонами (ГКПГ), а второй гормональный компонент содержит комбинацию эстрогенного и антиандрогенного препаратов, отличающееся тем, что общее количество суточных доз равно общему количеству суток в желаемом цикле, что первый гормональный компонент взят в количестве от 5 до 14, а второй - от 23 до 14 суточных доз и что количество суточных доз первого гормонального компонента меньше количества суточных доз второго гормонального компонента

2 Средство по п. 1, отличающееся тем, что по меньшей мере один эстрогенный препарат имеет вид по меньшей мере одного ингредиента, состоящего из этинилэстрадиола, местранола, другого синтетического эстрогена, а также по меньшей мере одного вышеуказанного гормонального ингредиента после отщепления защитной функ-

циональной группы от быстрорасщепляющегося гормонального комплекса

3 Средство по п. 1 или 2, отличающееся тем, что в первом и втором гормональном компонентах эстрогенные препараты идентичны по своему составу и/или эффективной дозе

4 Средство по п. 3, отличающееся тем, что первый и второй гормональные компоненты содержат в качестве эстрогенного препарата этинилэстрадиол в концентрации от 15 до 35 мкг для каждой суточной дозы

5 Средство по п. 1 или 2, или 3, отличающееся тем, что в качестве антиандрогенного препарата использован ципротеронацетат

6 Средство по п. 5, отличающееся тем, что суточная доза антиандрогенного препарата содержит около 1-2 мг ципротеронацетата

7 Средство по одному из пп. 1-4, отличающееся тем, что в качестве антиандрогенного препарата оно содержит хлормадинонацетат

8 Средство по п. 7, отличающееся тем, что суточная доза антиандрогенного препарата содержит около 1-3 мг хлормадинонацетата

9 Средство по одному из пп. 1-4, отличающееся тем, что в качестве антиандрогенного препарата оно содержит диеногест

10 Средство по п. 9, отличающееся тем, что суточная доза антиандрогенного препарата содержит около 1-3 мг диеногеста

11 Средство по одному из указанных пунктов, отличающееся тем, что общее количество суточных доз равно 28

12 Средство по одному из указанных пунктов, отличающееся тем, что максимальное общее количество суточных доз первого гормонального компонента не превышает 10

13 Средство по п. 9 или 10, отличающееся тем, что первый и второй гормональные компоненты взяты в количестве соответственно 7 и 21 суточных доз

Изобретение относится к гормональному средству для лечения угрей, состоящему из двух пространственно раздельно размещенных в общей упаковке и предназначенных для последова-

тельного во времени раздельного приема *per os* гормональных компонентов, которые по мере надобности разделены на несколько пространственно обособленных суточных доз в раздельно вск-

рываемых ячейках упаковки, причем первый гормональный компонент содержит в качестве гормонально действующего вещества по существу только эстрогенный препарат, который активирует глобулин, образующий комплексы с половыми гормонами (ГКПГ), а второй гормональный компонент содержит комбинацию эстрогенного и антиандрогенного препаратов

Уже давно известно гормональное средство выше указанного типа для лечения угрей, представляющее собой комбинированный препарат для лечения себореи, угрей и андрогенетической алопеции и - в легких формах - гирсутизма и содержащее в качестве антиандрогенного препарата 2 мг ципротеронацетата, а в качестве первого и второго гормональных компонентов 35 мкг эстрогенного препарата в виде этинилэстрадиола. Подобный описанному по лечебному эффекту комбинированный препарат содержит 2 мг хлормадинонацетата и 50 мкг местранола

Оба известных гормональных средства, будучи комбинированными препаратами, как они выше описаны, наряду с противоугревым действием проявляют еще и ингибирование овуляции. Хотя желательная длительность цикла составляет 28 суток, эти средства применяют на протяжении 21 суток, причем указанные 21 сутки завершаются семисуточной паузой, в которой исключен прием гормонов и в заключительной части которой за естественными месячными следует симулированное прерывание кровотечения

Вышеуказанное средство вполне пригодно для лечения угрей, однако желательно изготовить его так, чтобы эффективность стала еще большей

Из патентного описания DE-PS 4104385 известно также тормозящее овуляцию средство для гормональной контрацепции, состоящее из двух пространственно раздельно размещенных в общей упаковке и предназначенных для последовательного во времени раздельного приема *per os* гормональных компонентов, которые по мере необходимости разделены на несколько пространственно обособленных суточных доз в раздельно вскрываемых ячейках упаковки, причем первый гормональный компонент как гормональное действующее вещество по существу представляет собой эстрогенный препарат, который вызывает исключительно нарушение в созревании фолликулов, а второй гормональный компонент содержит комбинацию эстрогенного и по меньшей мере одного взятого в достаточной для торможения овуляции дозе гестационного препарата (гормона беременности), при этом общее количество суточных доз гормонов равно общему количеству суток в желаемом (менструальном) цикле, первый гормональный компонент взят в количестве от 5 до 14, а второй - от 23 до 14 суточных доз и количество суточных доз первого гормонального компонента меньше количества суточных доз второго гормонального компонента

При этом в качестве тормозящего овуляцию средства эстрогенный препарат может быть представлен, например, этинилэстрадиолом, а гестационный или антиандрогенный препарат - ципротерон- или хлормадинонацетатом

Для представленного выше тормозящего овуляцию средства характерно, что его прием происходит без пауз с постоянной дозировкой эстрогена, в связи с чем его концентрация оказывается равномерной

В основу изобретения положена задача путем дальнейшего усовершенствования подходящего средства для лечения угрей повысить эффективность терапии

Согласно изобретению эта задача решена тем, что общее количество суточных доз равно общему количеству суток в желаемом цикле, что первый гормональный компонент взят в количестве от 5 до 14, а второй - от 23 до 14 суточных доз и что количество суточных доз первого гормонального компонента меньше количества суточных доз второго гормонального компонента

При этом может быть предусмотрено, что по меньшей мере один эстрогенный препарат имеет вид по меньшей мере одного ингредиента, состоящего из этинилэстрадиола, местранола, другого синтетического эстрогена, а также по меньшей мере одного вышеуказанного гормонального ингредиента после отщепления защитной функциональной группы от быстросрасщепляющегося гормонального комплекса

Изобретением также предусмотрено, что в первом и втором гормональных компонентах эстрогенные препараты идентичны по своему составу и/или эффективной дозе

Изобретением также может быть предусмотрено, что первый и второй гормональные компоненты содержат в качестве эстрогенного препарата этинилэстрадиол в концентрации от 15 до 35 мкг в каждой суточной дозе

Далее, изобретение состоит в том, что в качестве антиандрогенного препарата использован ципротеронацетат

Изобретением также может быть предусмотрено, что суточная доза антиандрогенного препарата содержит около 1-2 мг ципротеронацетата

Еще одна форма выполнения изобретения отличается тем, что в качестве антиандрогенного препарата использован хлормадинонацетат

Изобретением также может быть предусмотрено, что суточная доза антиандрогенного препарата содержит около 1-3 мг хлормадинонацетата

Аналогично, изобретение состоит в том, что в качестве антиандрогенного препарата оно содержит диеногест

Может быть также предусмотрено, что суточная доза антиандрогенного препарата содержит около 1-3 мг диеногеста

Изобретением также может быть предусмотрено, что общее количество суточных доз равно 28

Аналогично, изобретением может быть предусмотрено, что максимальное общее количество суточных доз первого гормонального компонента не превышает 10

Изобретение состоит также в том, что первый и второй гормональные компоненты взяты в количестве соответственно 7 и 21 суточных доз

И, наконец, изобретение предусматривает применение гормонального средства согласно изобретению для лечения угрей

Изобретение основано на том поразительном результате, что эффективность лечения угрей удается повысить путем отказа от пауз в приеме лекарств и поддержания равномерной концентрации эстрогена, в особенности на основе этинилэстрадиола, при использовании тормозящего овуляцию средства в соответствии с патентом DE-PS 4104385 на всем протяжении (менструального) цикла, т.е. в течение 28 суток. Тем самым обеспечивается по существу постоянство концентрации ГКПГ, который блокирует свободный тестостерон, и соответственное повышение эффективности лечения угрей.

Действительно, при использовании средства согласно изобретению наблюдается торможение овуляции, соответствующее средству по патенту DE-PS 4104385, которое при определенных условиях может быть желательно. Аналогично, при использовании средства согласно изобретению наилучшим образом обеспечиваются и другие преимущества средства по патенту DE PS 4104385, обусловленные постоянством концентрации эстрогена при исключении пауз при приеме препарата.

Прочие признаки изобретения ясны из последующего описания, в котором приведены примеры выполнения.

#### Пример 1.

Для лечения угрей был применен комбинированный препарат, который содержал 7 суточных доз из соответствующего обстоятельству 20 мкг этинилэстрадиола и 21 суточной дозы из соответствующей обстоятельству смеси 20 мкг этинилэстрадиола и 2 мг ципротеронацетата. Это средство принималось в течение года и показало высокую активность в борьбе с угрями.

#### Пример 2.

Для лечения угрей был применен комбинированный препарат, который содержал 7 суточных доз из соответствующего обстоятельству 20 мкг этинилэстрадиола и 21 суточной дозы из соответствующей обстоятельству смеси 20 мкг этинилэстрадиола и 2 мг хлормадинонацетата. Его эффективность соответствовала указанной в примере 1.

#### Пример 3

В качестве средства для лечения угрей был применен комбинированный препарат, который содержал 7 суточных доз из соответствующего обстоятельству 20 мкг этинилэстрадиола и 21 суточной дозы из соответствующей обстоятельству смеси 20 мкг этинилэстрадиола и 2 мг диеногеста. Его эффективность соответствовала указанной в примерах 1 и 2.

Указанные в предшествующем описании и примерах признаки изобретения при его реализации могут быть существенными как порознь, так и в произвольных комбинациях и в различных формах выполнения.

---

Тираж 50 экз

Відкрите акціонерне товариство «Патент»

Україна, 88000, м. Ужгород, вул. Гагаріна, 101

(03122) 3 – 72 – 89 (03122) 2 – 57 – 03

---