

## (12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 47027 B1**
- (51) Cl. internationale : **A61K 31/4045; A61K 45/06;  
A61P 15/16; A61K 9/50;  
A61K 9/22**
- (43) Date de publication : **31.08.2020**
- 
- (21) N° Dépôt : **47027**
- (22) Date de Dépôt : **22.03.2019**
- (30) Données de Priorité : **23.03.2018 EP 18305328**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/EP2019/057267 22.03.2019**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation:EP19714150.0
- (71) Demandeur(s) : **Laboratoires Major, 6 rue Copernic 75116 Paris (FR)**
- (72) Inventeur(s) : **PERRIN, Philippe ; EL GLAOU, Guillaume ; EL GLAOU, Medhi ; DROUPY, Stéphane ; AGATHON-MERIAU, Véronique**
- (74) Mandataire : **MOROCCO INTELLECTUAL PROPERTY SERVICES**
- 
- (54) Titre : **COMPOSITIONS ET PROCÉDÉS NON HORMONAUX POUR LA CONTRACEPTION MASCULINE AVEC (R)-SILODOSIN**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne l'utilisation d'une composition dans un procédé de contraception non hormonale pour un sujet masculin, comprenant l'administration d'un antagoniste d'alpha-1-adrénorécepteur; le procédé de contraception comprenant une administration quotidienne unique de ladite composition environ au même moment chaque jour, le déclenchement d'une asperme réversible continue, d'une azoospermie ou d'une oligozoospermie sévère chez le sujet masculin, et, après une période initiale d'au moins deux jours consécutifs, la contraception n'est pas affectée par un retard de l'ingestion quotidienne unique suivante. La présente invention concerne également l'emballage comprenant 7, 14, 28, 56, 84 ou 168 à 365 doses unitaires; ou 10, 20, 30, 60, 90, ou 180 à 360 doses uniques de la composition à utiliser selon la présente invention.

## REVENDICATIONS

1. Composition pour son utilisation dans une méthode de contraception non hormonale pour un sujet masculin, dans laquelle ladite composition est une formulation à libération prolongée comprenant :
  - un antagoniste de récepteur alpha-1-adrénérique ; et
  - au moins un support pharmaceutiquement acceptable,dans lequel la méthode de contraception comprend l'administration une fois par jour de ladite composition à peu près à la même heure chaque jour, déclenchant une aspermie réversible continue, une azoospermie ou une oligozoospermie sévère chez le sujet masculin,  
dans laquelle après une période initiale d'au moins deux jours consécutifs, la contraception n'est pas altérée par un retard de la prise ultérieure une fois par jour, dans laquelle l'antagoniste de récepteur alpha-1-adrénérique est la (R)-silodosine.
2. La composition pour son utilisation selon la revendication 1, dans laquelle la composition est administrée par voie orale.
3. La composition pour son utilisation selon la revendication 1 ou la revendication 2, dans laquelle, après la période initiale de jours consécutifs, la prise d'une dose suivante peut être retardée de 6 à 18 heures après la dernière dose quotidienne régulière, et l'état d'aspermie, d'azoospermie ou une oligozoospermie sévère est maintenue chez le sujet masculin.
4. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 3, dans laquelle après la période initiale de jours consécutifs, le fait de ne pas prendre une dose quotidienne n'affecte pas l'état continu d'aspermie, d'azoospermie ou d'oligozoospermie sévère soutenant la méthode de contraception pendant 36 à 48 heures comme de la dernière prise.

5. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 4, dans laquelle la méthode de contraception se poursuit pendant au moins huit jours.
- 5 6. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 5, dans laquelle l'antagoniste des récepteurs alpha-1-adrénrgiques est en une quantité allant d'environ 0,1 à environ 30 mg, de préférence d'environ 0,2 à environ 20 mg.
7. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 6, dans laquelle la (R)-silodosine est sous une forme polymorphe ou amorphe.
- 10 8. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 7, dans laquelle la composition comprend ou consiste en au moins une particule, de préférence au moins une particule enrobée, et le diamètre moyen des particules est dans la plage de 0,01 à 5 mm, de préférence de 0,1 à 2 mm.
- 15 9. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 8, dans laquelle les particules sont englobées dans une capsule, chaque capsule étant remplie de particules en un nombre suffisant pour atteindre la dose quotidienne.
- 20 10. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 9, dans laquelle la contraception est réalisée indépendamment de la consommation alimentaire par le sujet masculin.
- 25 11. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 10, dans laquelle le procédé de contraception à administration quotidienne comprend en outre une administration simultanée ou séquentielle d'une composition supplémentaire appropriée pour traiter la dysfonction érectile ; de préférence, la composition supplémentaire comprend un inhibiteur de la phosphodiésterase-5.
12. Emballage comprenant au moins 7, 14, 28, 56, 84 ou 168 à 365 doses unitaires ; ou 10, 20, 30, 60, 90 ou 180 à 360 doses unitaires de la composition décrite dans

l'une quelconque des revendications 1 à 12, chaque dose unitaire étant une dose quotidienne.

- 5      **13.** Emballage selon la revendication 12, dans lequel la composition comprend un antagoniste des alpha-1-adrénorécepteurs en une quantité allant d'environ 0,1 à environ 30 mg, de préférence d'environ 0,2 à environ 20 mg, de préférence l'antagoniste des alpha-1-adrénorécepteurs est / j-silodosine en une quantité de 8 à 12 mg.