

(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 53626 B1**
- (51) Cl. internationale : **A61K 31/4045; A61P 15/16; A61K 9/50; A61K 45/06**
- (43) Date de publication : **30.09.2024**
-
- (21) N° Dépôt : **53626**
- (22) Date de Dépôt : **22.03.2019**
- (30) Données de Priorité : **23.03.2018 EP 18305328**
- (71) Demandeur(s) : **PHARMAJOR INTERNATIONAL, 11 Rue Beck 1222 Luxembourg (LU)**
- (72) Inventeur(s) : **PERRIN, Philippe ; DROUPY, Stéphane ; EL GLAOU, Guillaume ; EL GLAOU, Mehdi ; AGATHON-MERIAU, Véronique**
- (74) Mandataire : **SABA & CO., TMP**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation :20182691.4
-
- (54) Titre : **PROCÉDÉS NON HORMONAUX DE CONTRACEPTION MASCULINE AVEC (R)-SILODOSIN**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne l'utilisation d'une composition dans une méthode de contraception non hormonale pour un sujet masculin, comprenant l'administration d'un antagoniste des récepteurs alpha-1-adrénrgiques ; la méthode de contraception comprenant une 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, et après une période initiale d'au moins deux jours consécutifs, la contraception n'est pas altérée par un retard de la prise quotidienne ultérieure. La présente invention concerne également le conditionnement 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 mettre en œuvre 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
5 comprenant :
 - un antagoniste de récepteur alpha-1-adrénergique, et
 - au moins un support pharmaceutiquement acceptable, dans laquelle la méthode de contraception comprend l'administration quotidienne par voie orale de ladite composition à peu près à la même heure
10 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 quotidienne ultérieure,
dans laquelle l'antagoniste de récepteur alpha-1-adrénergique est la
15 (*R*)-silodosine, et
dans laquelle la quantité de (*R*)-silodosine dans ladite composition va d'environ 4 à environ 30 mg.
2. La composition pour son utilisation selon la revendication **1**, dans laquelle, après la période initiale de jours consécutifs, la prise d'une dose suivante peut être retardée
20 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.
3. La composition pour son utilisation selon la revendication **1** ou la revendication **2**, 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
25 d'oligozoospermie sévère soutenant la méthode de contraception pendant 36 à 48 heures à partir de la dernière prise.

4. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications **1** à **3**, dans laquelle la méthode de contraception se poursuit pendant au moins huit jours.
- 5 5. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications **1** à **4**, dans laquelle la quantité de (*R*)-silodosine dans ladite composition va d'environ 4 à environ 20 mg.
6. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications **1** à **4**, dans laquelle la quantité de (*R*)-silodosine dans ladite composition est d'environ 4 mg, d'environ 6 mg, d'environ 8 mg, d'environ 10 mg, d'environ 10 12 mg, d'environ 16 mg, d'environ 20 mg, d'environ 24 mg, d'environ 26 mg, ou d'environ 30 mg.
7. La composition pour son utilisation selon la revendication **6**, dans laquelle la quantité de (*R*)-silodosine dans ladite composition est d'environ 12 mg.
8. La composition pour son utilisation selon la revendication **6**, dans laquelle la 15 quantité de (*R*)-silodosine dans ladite composition est d'environ 16 mg.
9. La composition pour son utilisation selon la revendication **6**, dans laquelle la quantité de (*R*)-silodosine dans ladite composition est d'environ 20 mg.
10. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications **1** à **9**, dans laquelle la (*R*)-silodosine est sous une forme polymorphe ou amorphe.
- 20 11. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications **1** à **10**, dans laquelle la contraception est réalisée indépendamment de la consommation alimentaire par le sujet masculin.
12. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications **1** à **11**, dans laquelle ladite administration orale quotidienne de ladite composition 25 n'altère pas la qualité de l'orgasme chez le sujet masculin.

13. La composition pour son utilisation selon l'une quelconque des revendications **1** à **12**, dans laquelle ladite composition est administrée de façon simultanée ou séquentielle avec une composition supplémentaire.
14. La composition pour son utilisation selon la revendication **13**, dans laquelle ladite
5 composition supplémentaire est une composition appropriée pour traiter la dysfonction érectile.
15. La composition pour son utilisation selon la revendication **14**, dans laquelle ladite composition supplémentaire comprend un inhibiteur de la phosphodiesterase-5.