

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 382 242**

51 Int. Cl.:
A61K 31/7004 (2006.01)
A61K 31/70 (2006.01)
A61K 31/702 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **02759484 .5**
96 Fecha de presentación: **29.08.2002**
97 Número de publicación de la solicitud: **1429786**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **23.06.2004**

54 Título: **Anticonceptivos de D-manosa.**

30 Prioridad:
29.08.2001 US 315661 P

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
06.06.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
06.06.2012

73 Titular/es:
BIO-TECH PHARMACAL, INC.
P.O. BOX 1927
FAYETTEVILLE, AR 79702, US

72 Inventor/es:
BENEDICT, Dale L. y
BENEDICT, Martha

74 Agente/Representante:
Espiell Volart, Eduardo María

ES 2 382 242 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Anticonceptivos de D-manosa.

La presente solicitud reivindica la prioridad según lo estipulado en 35 U.S.C., artículo 119(e), para la solicitud provisional de EE.UU. con n.º de serie 60/315.661, presentada el 29 de agosto de 2001.

5 CAMPO DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a la utilización de D-manosa para inhibir o impedir la unión de un espermatozoide y un óvulo en la concepción. La presencia de un exceso de manosa en un sistema reproductor inhibe la captación de espermatozoides.

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

10 La búsqueda de anticonceptivos eficaces que resulten baratos y no presenten efectos secundarios no deseados se lleva realizando desde hace tiempo. Se ha observado que existe un componente de unión de D-manosa en las superficies de los espermatozoides humanos. También se ha comprobado que la D-manosa resulta muy útil para aliviar el tracto urinario, infecciones y cistitis. La presente invención se refiere a la utilización de la administración de D-manosa a una mujer como un procedimiento para inhibir la concepción.

15 La presente invención proporciona un procedimiento para inhibir la concepción que comprende la administración de D-manosa a un sujeto femenino en una cantidad que resulte eficaz para inhibir la interacción entre un espermatozoide y un óvulo de dicho sujeto femenino, con la condición de que la etapa de administración de la D-manosa no consista en la administración de la D-manosa a dicho sujeto femenino por vía vaginal.

DESCRIPCIÓN DE UN MODO PREFERIDO DE REALIZACIÓN

20 La industria alimentaria ha utilizado ampliamente la D-manosa para tratar y prevenir las infecciones del tracto urinario mediante la inhibición de la adherencia de las bacterias a las membranas o paredes celulares. Las interacciones entre proteínas y D-manosa en el acrosoma de ratones, ratas, caballos, pollos, humanos y otros animales, parecen estar relacionadas con la adherencia del espermatozoide al óvulo. Se han llevado a cabo diversos estudios, unos indican que la D-manosa provoca una mayor adherencia del espermatozoide a los óvulos y otros que provoca una menor adherencia. En cualquier caso, la presente invención comprende la inhibición de la concepción al mismo tiempo que previene o alivia las infecciones del tracto urinario o la cistitis.

Se entiende que los expertos en la materia saben que una determinada cantidad de sílice evita que la D-manosa se compacte al exponerla a la humedad. Por tanto, resulta útil mezclar el sílice con D-manosa en polvo antes del encapsulado.

30 Se ha observado que la inseminación artificial en equinos a menudo produce endometriosis, que consiste en una dolorosa infección del útero. Para proteger contra la infección, el esperma equino se introdujo en una solución de manosa. Aunque se evitó la infección, también se observó que en los animales tratados no se produjo la concepción. Parece que la D-manosa, en las cantidades suficientes y en los momentos adecuados, evita la concepción (al menos, a veces) mediante la inhibición de la adhesión o unión del espermatozoide al óvulo a través del acrosoma del espermatozoide. En un modo de realización preferido, la presente invención comprende la administración oral, preferentemente en forma de cápsula, de D-manosa a un sujeto femenino con posibilidad de mantener relaciones sexuales en un futuro próximo. Una dosificación preferente para una hembra humana adulta comprendería la ingestión de aproximadamente tres (3) cápsulas, cada una con aproximadamente 420 miligramos de D-manosa, aproximadamente cada dos (2) horas, comenzando aproximadamente un día antes del coito. Ésta se puede reducir a aproximadamente 2-3 de dichas cápsulas aproximadamente una hora antes del coito y aproximadamente la misma dosis aproximadamente una hora después. También se puede usar el aerosol oral de una solución de D-manosa. Dichas dosificaciones y momentos de administración pueden variar considerablemente para resultar más eficaces. La dosis útil para una hembra humana adulta media oscilaría entre aproximadamente 1 gramo y aproximadamente 10 gramos de D-manosa al día. Las dosis útiles para otros animales se pueden determinar estableciendo la proporción relativa con respecto al peso del otro animal con respecto a la hembra humana adulta media. Se puede llevar a cabo la administración de D-manosa a animales domésticos o salvajes para inhibir el crecimiento de la población animal. Dicha administración puede ser en agua, sal o alimentos.

El inventor contempla las bebidas refrescantes o alcohólicas con un suplemento de D-manosa útiles para reducir la posibilidad de la concepción.

50 Aunque en la actualidad se prefieren las cápsulas, es concebible que la D-manosa se utilice sencillamente en forma de un polvo que se añada a bebidas o alimentos. Las dosis se pueden complementar con una gelatina, ducha o crema intravaginal anticonceptiva, o similar, que contenga D-manosa. Lo importante es que el sujeto femenino adquiera una concentración interna de manosa que resulte eficaz para inhibir la interacción fertilizadora del espermatozoide con el óvulo.

- 5 Mientras el mecanismo exacto de este efecto anticonceptivo no está definido de manera completa, esto no resulta esencial para comprender o utilizar la presente invención. La presente invención comprende la inhibición efectiva de la interacción espermatozoide-óvulo para evitar o reducir la probabilidad de la concepción, mediante la presencia de una cantidad suficiente de D-manosa. Se cree que la D-manosa se une a lugares del espermatozoide que son utilizados por el espermatozoide en su interacción con el óvulo, de un modo que no lo hace el azúcar común, la sacarosa, y la mayoría de los demás azúcares que se utilizan comúnmente. Aunque la D-manosa se utiliza preferentemente en cápsulas, también se puede utilizar en forma de comprimidos o en polvo. Se pueden utilizar duchas que contengan D-manosa combinadas con D-manosa por vía oral para inhibir la interacción eficaz del espermatozoide y el óvulo. Las dosificaciones de D-manosa también se pueden utilizar para aumentar la eficacia de otros métodos anticonceptivos tales como: preservativos, diafragmas, píldoras de hormonas, etc. Se puede administrar tomada por separado con píldoras de hormonas o bien en píldoras que estén combinadas con píldoras de hormonas. Las duchas de D-manosa resultan un medio eficaz de administración de la D-manosa, particularmente si se usan dentro de un periodo de un día antes del coito hasta poco después del mismo. Las mujeres en edad fértil que no deseen quedarse embarazadas deberían tomar una dosis de mantenimiento constante de D-manosa.
- 10
- 15 Debido a que la D-manosa se une al espermatozoide de una manera que, a una determinada concentración, hace que el espermatozoide sea menos eficiente a la hora de penetrar en el óvulo, se produce una interacción sinérgica con otras aplicaciones anticonceptivas que también evitan la concepción impidiendo que el espermatozoide penetre en el óvulo.

REIVINDICACIONES

1. Un procedimiento para inhibir la concepción, que comprende la administración de D-manosa a un sujeto femenino en una cantidad que resulte eficaz para inhibir la interacción entre un espermatozoide y un óvulo de dicho sujeto femenino, con la condición de que la etapa de administración de la D-manosa no consista en la administración por vía vaginal de D-manosa a dicho sujeto femenino.
2. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que la D-manosa se administra en una cantidad de entre aproximadamente 1 gramo y aproximadamente 10 gramos al día.
3. El procedimiento de la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en el que la D-manosa se administra por vía oral.
4. El procedimiento de la reivindicación 3, en el que la D-manosa se encuentra en forma de una cápsula o comprimido.
5. El procedimiento de la reivindicación 4, en el que la D-manosa se administra dentro de un periodo de un día antes o un día después del coito y en el que la administración se efectúa por medio de la ingestión por parte del sujeto femenino de aproximadamente tres cápsulas, conteniendo cada cápsula aproximadamente 420 miligramos, de D-manosa aproximadamente cada dos horas, comenzando aproximadamente un día antes de dicho coito, y reduciéndose la ingestión a dos o tres de dichas cápsulas aproximadamente una hora antes del coito y aproximadamente la misma dosis aproximadamente una hora después.
6. El procedimiento de la reivindicación 3, en el que la D-manosa se encuentra en forma de un polvo poco cohesionado y se mezcla con un alimento o bebida.
7. El procedimiento de la reivindicación 3, en el que la D-manosa se encuentra en forma de aerosol oral de una solución de D-manosa.
8. El procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, que comprende además una ducha complementaria de D-manosa dentro de un periodo de un día antes o un día después del coito.
9. El procedimiento según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, que comprende además el uso de al menos un anticonceptivo seleccionado entre el grupo consistente en un preservativo, diafragma, píldora de hormonas, gelatina anticonceptiva, crema intravaginal y ducha, resultando la D-manosa y el anticonceptivo más eficaces que la D-manosa o el anticonceptivo utilizados por separado.
10. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que el sujeto femenino es un animal doméstico o salvaje.
11. El procedimiento de la reivindicación 1, en el que el sujeto femenino es humano.

DOCUMENTOS INDICADOS EN LA DESCRIPCIÓN

En la lista de documentos indicados por el solicitante se ha recogido exclusivamente para información del lector, y no es parte constituyente del documento de patente europeo. Ha sido recopilada con el mayor cuidado; sin embargo, la EPA no asume ninguna responsabilidad por posibles errores u omisiones.

5 Documentos de patente indicados en la descripción

- US 31566101 P [0001]