

58 1  
36

**G. HOLLMANN RESTREPO**  
ABOGADOS LTDA.

54077

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Radicacion : 03021128 00000001  
Fecha (HMD): 2003-06-03 11:20:37  
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLEMEN  
Folios: 36

E. S. D.

Re: **Expediente No. 03021128**

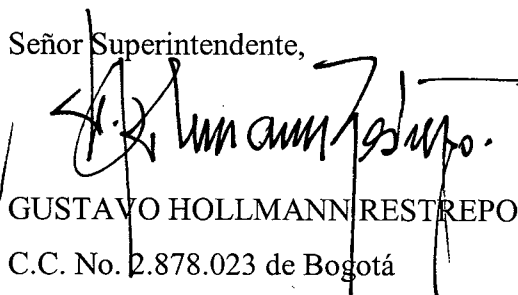
Solicitud de patente PCT fase nacional

Titular: SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT

Yo, GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO, vecino de Bogotá D.C., portador de la tarjeta profesional No. 5903, obrando como apoderado en este negocio, digo a usted que acompaño al presente memorial, para que sean agregados al expediente de la referencia los siguientes documentos:

1. Copia certificada de la solicitud de patente No. 100 45 380.5 presentada en Alemania el 14 de septiembre de 2000, con la carátula y Reivindicaciones traducidas al castellano, la cual ha servido de base para la Reivindicación de Prioridad de la solicitud de patente PCT/EP01/10207.
2. El documento de cesión otorgado por los inventores al solicitante de la patente, debidamente traducido y legalizado.
3. El recibo de tasas No. 37,357, correspondiente a la Reivindicación de Prioridad.

Señor Superintendente,

  
GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO

C.C. No. 2.878.023 de Bogotá

T.P. No. 5903

Ref 54077

51798 A

COLOMBIA

517

**DOCUMENTO DE CESIÓN  
ASSIGNMENT DOCUMENT**

P-Co-74.469

El suscrito,  
(I, the undersigned)

HERMANN KULMANN  
con domicilio en Berlin, Alemania  
(domiciled in)

declaro que soy el inventor de la invención que lleva el título  
(declare that I am the inventor of the invention titled)

CONTRACEPTION PROCESS AND ADMINISTRATION FORM FOR THE SAME  
MÉTODO DE ANTICONCEPCIÓN Y FORMA DE ADMINISTRACIÓN DEL MISMO

y que he cedido el derecho sobre esta invención en Colombia, junto con los privilegios  
(and that I have assigned our rights over this invention in Colombia, together with its  
privileges)

y anexidades a favor de  
(and attachments, to)

SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT  
Berlin, Alemania



Hermann Kulmann

Urkundenrolle-Nr. R 176/2003

Ich habe das Mitwirkungsverbot nach § 3 Abs. 1 Nr. 7 BeurkG erläutert. Meine Frage, ob eine Vorbefassung im Sinne der Vorschrift vorliege, wurde verneint.

Die vor mir geleistete Unterschrift

des Herrn Dr. Hermann **K u l m a n n**,  
geboren am 12. Mai 1959,  
geschäftsansässig in 13353 Berlin, Müllerstraße 178,

- von Person bekannt -

beglaubige ich.

Berlin, 31. März 2003

Notar

Kostenberechnung gem. §§ 141, 154 KostO

Geschäftswert: 12.000,00 €

|                                 |                       |
|---------------------------------|-----------------------|
| Beglaubigungsgebühr §§ 32, 45 I | 15,00 €               |
| Wegegebühr gem. § 58            | 15,00 €               |
| Schreibauslagen §§ 136, 152     | 1,00 €                |
| Postauslagen §§ 137, 152        | <u>1,44 €</u>         |
|                                 | 32,44 €               |
| 16 % Mehrwertsteuer             | <u>5,19 €</u>         |
|                                 | <u><u>37,63 €</u></u> |

Berlin, 31. März 2003

Notar

Apostille  
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

2. ist unterschrieben von Dimitri R e m p e n

3. in seiner Eigenschaft als Notar

4. sie ist versehen mit dem Siegel  
des Notars

Bestätigt

5. in Berlin

6. am 4. April 2003

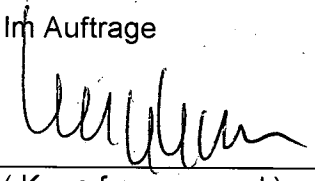
7. durch den Präsidenten des Landgerichts in Berlin

8. unter Nr. 9101 a E - F. 1011/2003

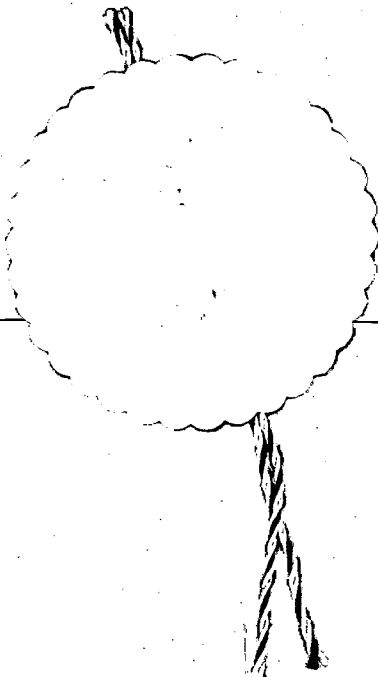
9. Siegel

10. Unterschrift

Im Auftrage

  
(Kupfernagel)

Vorsitzender Richter am Landgericht



Traducción oficial del Alemán de la notarización y la aposti-  
lla adjuntas al Documento de Cesión suscrito entre el inventor  
Hermann Kulmann y la compañía Schering Aktiengesellschaft do-  
miciliada en Berlín, Alemania.

---

Registro Notarial No. R 176/2003

Yo expliqué la prohibición de participación según el Artículo  
3 inciso 1 No. 3 de la Ley de Notarización. Mi pregunta acerca  
de un impedimento conforme a la mencionada disposición fue  
contestada negativamente.

Autentico la firma que aparece anteriormente, ejecutada en mi  
presencia por el

Señor Dr. Hermann Kulmann,  
nacido el 12 de Mayo de 1959,  
domicilio comercial en 13353 Berlín, Müllerstraße 178,  
quien es conocido personalmente por el suscrito Notario.

Berlín, 31 de Marzo del 2003

Dimitri Rempen, Notario en Berlín (firma)

Nota de gastos según Art. 141, 154 Disp. Impuestos

Valor del negocio: 12.000,00 EUROS

|                                     |             |
|-------------------------------------|-------------|
| Autenticación Art. 32, 45I          | 15,00 EUROS |
| Porte Artículo 58                   | 15,00 EUROS |
| Escritura Artículos 136, 152        | 1,00 EUROS  |
| Gastos de correo Artículos 137, 152 | 1,44 EUROS  |
| 16% Impuesto a las ventas           | 5,19 EUROS  |
| Total:                              | 37,63 EUROS |

Berlín, 31 de Marzo del 2003

Dimitri Rempen, Notario en Berlín  
(Firma y Sello Oficial)

**Apostilla**

(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por: Dimitri Rempen
3. En su calidad de: Notario
4. Y lleva el sello: del Notario

Confirmado

5. En: Berlín
6. El día: 4 de Abril del 2003
7. Por: El Presidente del Tribunal Regional, en Berlín
8. Bajo el No.: 9101 a E-F. 1011/2003
9. Sello: EL PRESIDENTE DEL TRIBUNAL REGIONAL EN BERLIN
10. Firma: Por encargo: Kupfernagel,  
Juez Presidente en el Tribunal Regional

  
**ADOLF WATZKE**  
**Traductor Oficial**  
Res. 2433 Minjusticia



**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung  
einer Patentanmeldung**

**Aktenzeichen:** 100 45 380.5

**Anmeldetag:** 14. September 2000

**Anmelder/Inhaber:** Schering Aktiengesellschaft, Berlin/DE

**Bezeichnung:** Verfahren zur Kontrazeption und dessen Darreichungsform

**IPC:** A 61 K 31/57

**Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.**

München, den 10. März 2003  
**Deutsches Patent- und Markenamt**  
**Der Präsident**  
Im Auftrag

  
Coost

8  
65

# BOEHMERT & BOEHMERT

## ANWALTSSOZietät

Boehmert & Boehmert • P.O.B. 10 71 27 • D-28071 Bremen

Deutsches Patent- und Markenamt  
Zweibrückenstr. 12

80297 München

DR.-ING. KARL BOEHMERT, PA (1899-1973)  
DIPL.-ING. ALBERT BOEHMERT, PA (1902-1993)  
WILHELM J. H. STAHLBERG, RA, Bremen  
DR.-ING. WALTER HOORMANN, PA\*, Bremen  
DIPL.-PHYS. DR. HEINZ GODDAR, PA\*, München  
DR.-ING. ROLAND LIESEGANG, PA\*, München  
WOLF-DIETER KUNTZE, RA, Bremen, Alicante  
DIPL.-PHYS. ROBERT MÜNZHUBER, PA (1933-1992)  
DR. LUDWIG KOUKER, RA, Bremen  
DR. (CHEM.) ANDREAS WINKLER, PA\*, Bremen  
MICHAELA HUTH-DIERIG, RA, München  
DIPL.-PHYS. DR. MARION TÖNHARDT, PA\*, Düsseldorf  
DR. ANDREAS EBERT-WEIDENFELLER, RA, Bremen  
DIPL.-ING. EVA LIESEGANG, PA\*, München  
DR. AXEL NORDEMANN, RA, Berlin  
DIPL.-PHYS. DR. DOROTHÉE WEBER-BRULS, PA\*, Frankfurt  
DIPL.-PHYS. DR. STEFAN SCHOHE, PA\*, München  
DR.-ING. MATTHIAS PHILIPP, PA\*, Bielefeld  
DR. JAN BERND NORDEMANN, LL.M., RA, Berlin

PROF. DR. WILHELM NORDEMANN, RA, BRB  
DIPL.-PHYS. EDUARD BAUMANN, PA\*, Höhenkirchen  
DR.-ING. GERALD KLÖPSCH, PA\*, Düsseldorf  
DIPL.-ING. HANS W. GROENING, PA\*, München  
DIPL.-ING. SIEGFRIED SCHIRMER, PA\*, Bielefeld  
DIPL.-PHYS. LORENZ HANEWINKEL, PA\*, Paderborn  
DIPL.-ING. DR. JAN TÖNNIES, PA, RA, Kiel  
DIPL.-PHYS. CHRISTIAN BIEHL, PA\*, Kiel  
MARTIN WIRTZ, RA, Düsseldorf  
DR. DETMAR SCHÄFER, RA, Bremen  
DIPL.-PHYS. DR.-ING. UWE MANASSE, PA\*, Bremen  
DR. CHRISTIAN CZYCHOWSKI, RA, Berlin  
DR. CARL-RICHARD HAARMANN, RA, München  
DIPL.-BIOL. DR. ARMIN K. BOHMANN, PA, München  
DIPL.-PHYS. DR. THOMAS L. BITTNER, PA\*, Berlin  
DR. VOLKER SCHMITZ, RA, München  
DR. FRIEDRICH NICOLAUS HEISE, RA, Potsdam  
DIPL.-PHYS. CHRISTIAN W. APPELT, PA, München  
DR. ANKE NORDEMANN-SCHIFFEL, RA\*, Potsdam  
KERSTIN MAUCH, LL.M., RA, Potsdam

In Zusammenarbeit mit/in cooperation with  
DIPL.-CHEM. DR. HANS ULRICH MAY, PA\*, München

PA - Patentanwalt/Patent Attorney  
RA - Rechtsanwalt/Attorney at Law  
\* - European Patent Attorney  
- Brandenburg, zugelassen am OLG Brandenburg  
- Maître en Droit  
Alle zugelassen zur Vertretung vor dem Europäischen Markenamt, Alicante  
Professional Representatives at the Community Trademark Office, Alicante

Ihr Zeichen  
Your ref.

Ihr Schreiben  
Your letter of

Unser Zeichen  
Our ref.

Bremen,

Neuanmeldung

S10083(M)

12. September 2000

Schering AG

Müllerstraße 170 – 178

13342 Berlin

### Verfahren zur Kontrazeption und dessen Darreichungsform

Verfahren zur hormonalen Kontrazeption, bei dem in einer Vielzahl von in zeitlich im wesentlichen unbegrenzter, ggf. mehrjähriger Abfolge aneinander anschließenden Einnahmeabschnitten, die jeweils aus mindestens einem Einnahmezyklus mit einer mehrtägigen, innerhalb des betreffenden Einnahmeabschnittes in der Dauer konstanten Einnahmephase und einer mehrtägigen Einnahmepause bestehen, in der/den (jeweiligen) Einnahmephasen pro Tag eine Tageseinheit mit mindestens einer kontrazeptiv wirkenden Hormonkomponente, wie Estrogen

- 4.90 -

Hollerallee 32 • D-28209 Bremen • P.O.B. 10 71 27 • D-28071 Bremen • Telefon +49-421-34090 • Telefax +49-421-3491768

MÜNCHEN • BREMEN • BERLIN • DÜSSELDORF • FRANKFURT • BIELEFELD • POTSDAM • BRANDENBURG • KIEL • PADERBORN • HÖHENKIRCHEN • ALICANTE

<http://www.boehmert.de>

e-mail: [postmaster@boehmert.de](mailto:postmaster@boehmert.de)

und/oder Gestagen, und in der/den (jeweiligen) Einnahmepause(n) entweder von jedweder Hormonkomponente freie Placebos verabreicht werden oder aber die jeweilige Einnahmepause gänzlich verabreichungsfrei bleibt und die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnitts mindestens 22 Tage beträgt, sowie eine Darreichungsform zur hormonalen Kontrazeption, insbesondere zur Durchführung des vorgenannten Verfahrens, mit einer Vielzahl von Verpackungseinheiten, die jeweils mindestens einen Satz von innerhalb eines aus jeweils einer Einnahmephase und einer angrenzenden Einnahmepause bestehenden Einnahmezyklus eines Einnahmeabschnittes, innerhalb dessen die Dauer der Einnahmephasen konstant ist, zu verabreichenden Tageseinheiten aufweisen, welche jeweils mindestens eine der Dauer der Einnahmephase(n) entsprechende Anzahl von Hormon-Tageseinheiten, jeweils mit einem Gehalt von mindestens einer kontrazeptiv wirkenden Hormonkomponente, wie Estrogen und/oder Gestagen, sowie ggf. eine der Dauer der betreffenden Einnahmepause(n) entsprechende Anzahl von Placebos umfassen, wobei die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten der dem ersten Einnahmeabschnitt folgenden Einnahmeabschnitte mindestens 22 Tage beträgt.

Orale Kontrazeptiva werden typischerweise über einen Zeitraum von 21 Tagen eingenommen. Dieser Einnahmephase folgt im allgemeinen eine Einnahmepause von 7 Tagen, die zu einer menstruellen Blutung (Abbruchblutung) führt. Dieses Einnahmeregime wurde um 1960 deshalb entwickelt, weil es dem natürlichen Zyklus weitgehend entspricht. Eine medizinische Begründung gibt es nicht.

In den vergangenen 20 Jahren wurden wiederholt Versuche mit längeren Einnahmepausen durchgeführt. Dabei wurde demonstriert, daß die Anzahl der Abbruchblutungen reduziert werden kann. In zwei Langzeitstudien, beschrieben von N. B. Loudon et al. in einem Artikel "Acceptability of an oral contraceptive that reduces the frequency of menstruation: the tri-cycle pill regimen", British Medical Journal, 1977, 2, Seiten 487 – 490, beziehungsweise von A.-C. Cachrimanidou et al. in einem Artikel "Long-interval treatment regimen with a desogestrel-containing oral contraceptive", erschienen in Contraception 1993: 48, Seiten 205 – 216, wurden zum einen ein Regime: Einnahme über 84 Tage, gefolgt von einer Pause von 6

10  
69

Tagen, und zum anderen: Einnahme über 63, gefolgt von einer Pause von 7 Tagen, geprüft. Bei diesen Versuchen wurde festgestellt, daß die kontrazeptive Sicherheit nicht eingeschränkt wird; es wird sogar vermutet, daß Einnahmefehler wie z. B. vergessene Tabletten einen geringeren Einfluß haben als bei konventionellen Regimes. Gleichzeitig wurde aber festgestellt, daß die Anzahl unerwünschter Schmier- und Durchbruchblutungen durch die verlängerte Einnahmephase erhöht wird. Dies gilt auch für Kurzzeitstudien, wie sie z. B. von W. S. de Voogd in einem Artikel "Postponement of withdrawal bleeding with a monophasic oral contraceptive containing desogestrel and ethinylestradiol", erschienen in Contraception 44, Nr. 2, August 1991, Seiten 107 - 112 beschrieben wurde. Die Häufigkeit von Schmier- und Durchbruchblutungen war bei Frauen, die im Rahmen der Studien mit der Einnahme von oralen Kontrazeptiva begonnen hatten, größer als bei denen, die unmittelbar zuvor orale Kontrazeptiva eingenommen hatten. Die Häufigkeit dieser unerwarteten Blutungen war während der ersten Einnahmephase besonders hoch und nahm dann im Laufe der Zeit ab.

Der Erfindung liegt die Aufgabe zugrunde, das gattungsgemäße Verfahren und die gattungsgemäße Darreichungsform zur oralen Kontrazeption dahingehend weiterzubilden, daß bei zuverlässiger kontrazeptiver Sicherheit die Anzahl der Abbruchblutungen reduziert wird.

Erfindungsgemäß wird diese Aufgabe in Weiterbildung des Verfahrens der gattungsgemäßen Art dadurch gelöst, daß die Dauer der Einnahmephase(n) kürzer ist als im letzten Einnahmeabschnitt; und daß die Dauer der Einnahmephase(n) in jedwedem einem nachfolgenden Einnahmeabschnitt vorangehenden Einnahmeabschnitt kürzer ist als in dem jeweils nachfolgenden Einnahmeabschnitt.

Dabei kann vorgesehen sein, daß der letzte Einnahmeabschnitt spätestens mit dem zehnten Einnahmezyklus beginnt.

Die Erfindung schlägt auch vor, daß in mindestens einem Einnahmeabschnitt die (jeweilige) Einnahmephase der (jeweiligen) Einnahmepause vorangeht.

Es kann vorgesehen sein, daß in mindestens einem Einnahmeabschnitt die (jeweilige) Einnahmepause der (jeweiligen) Einnahmephase vorgeht.

Bei dem erfindungsgemäßen Verfahren kann auch so vorgegangen werden, daß die Dauer mindestens einer der Einnahmepausen 4 – 10 Tage beträgt.

Ferner kann vorgesehen sein, daß die Dauer mindestens einer der Einnahmepausen 7 Tage beträgt.

Die Erfindung schlägt auch vor, daß die Dauer der Einnahmepausen ab dem letzten Einnahmeabschnitt einschließlich konstant bleibt.

Das erfindungsgemäße Verfahren kann auch so ausgestaltet sein, daß die Dauer der Einnahmepausen ab dem ersten Einnahmeabschnitt einschließlich konstant bleibt.

Dabei kann vorgesehen sein, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 40 Tage beträgt.

Dabei kann auch so vorgegangen werden, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 45 Tage beträgt.

Die Erfindung schlägt auch vor, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 50 Tage beträgt.

Dabei kann vorgesehen sein, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 60 Tage beträgt.

Die Erfindung sieht gegebenenfalls auch vor, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 70 Tage beträgt.

Nach der Erfindung kann ferner so vorgegangen werden, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 80 Tage beträgt.

Dabei kann vorgesehen sein, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 90 Tage beträgt.

Die Erfindung sieht auch gegebenenfalls vor, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 100 Tage beträgt.

Dabei kann vorgesehen sein, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 110 Tage beträgt.

Beim erfindungsgemäßen Verfahren kann auch vorgesehen sein, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes höchstens 150 Tage beträgt.

Es kann auch vorgesehen sein, daß als Hormonkomponente(n) Chlormadinonacetat mit einer Dosierung pro Tageseinheit von 0,5 mg bis 3 mg einschließlich, Cyprotheronacetat von 1 mg bis 3 mg einschließlich, Desogestrel von 0,05 mg bis 0,2 mg einschließlich, Dienogest von 1 mg bis 3 mg einschließlich, Gestoden von 0,035 mg bis 0,1 mg einschließlich, Levonorgestrel von 0,025 mg bis 0,5 mg einschließlich, Lynestrenol von 0,25 mg bis 3 mg einschließlich, Medroxyprogesteronacetat von 75 mg bis 200 mg einschließlich, Norethisteron von 0,175 mg bis 1,5 mg einschließlich, Norgestimat von 0,1 mg bis 0,3 mg einschließlich, Norgestrel von 0,015 mg bis 0,75 mg einschließlich, Norethisteronacetat von 0,25 mg bis 3 mg einschließlich, Norestisteronenanthat von 100 mg bis 300 mg einschließlich, Drospironon von 1,5 mg bis 4 mg einschließlich, Ethinylestradiol von 10 µg bis 50 µg einschließlich, Mestranol von 25 µg bis 50 µg einschließlich und/oder Estradiol (als Vertreter des natürlichen Estragens) von 0,25 mg bis 6 mg einschließlich verwendet werden.

Schließlich kann auch so vorgegangen werden, daß die Dosierung der Hormonkomponenten von Einnahmeabschnitt zu Einnahmeabschnitt sukzessive erniedrigt wird.

Die erfindungsgemäße Darreichungsform, insbesondere zur Durchführung des vorgenannten Verfahrens, zeigt sich in Weiterbildung der gattungsgemäßen Darreichungsform dadurch aus, daß die Anzahl der Hormontageseinheiten in jedweder einem nachfolgenden Einnahmeabschnitt vorangehenden Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit kleiner ist als in der dem jeweils nachfolgenden Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit.

Dabei kann vorgesehen sein, daß der letzte Einnahmeabschnitt spätestens mit dem zehnten Einnahmezyklus beginnt.

Dabei kann auch so vorgegangen werden, daß in mindestens einem Einnahmeabschnitt die (jeweilige) Einnahmephase der (jeweiligen) Einnahmepause vorangeht.

Die Erfindung schlägt auch vor, daß in mindestens einem Einnahmeabschnitt die (jeweilige) Einnahmepause der (jeweiligen) Einnahmephase vorangeht.

Dabei kann vorgesehen sein, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 40 beträgt.

Es kann auch so vorgegangen werden, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 45 beträgt.

Dabei kann vorgesehen sein, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 50 beträgt.

Die erfindungsgemäße Darreichungsform kann auch dadurch gekennzeichnet sein, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 60 beträgt.

Dabei kann vorgesehen sein, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 70 beträgt.

Die Erfindung schlägt auch vor, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 80 beträgt.

Dabei kann vorgesehen sein, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 90 beträgt.

Es kann auch vorgesehen sein, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 100 beträgt.

Die Erfindung schlägt auch gegebenenfalls auch vor, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 110 beträgt.

Die erfindungsgemäße Darreichungsform kann auch so ausgestaltet sein, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheiten höchstens 150 beträgt.

Es kann auch vorgesehen sein, daß die Hormon-Tageseinheiten jeweils Chlormadinonacetat von 0,5 bis 3 mg einschließlich, Cyprotheronacetat von 1 mg bis 3 mg einschließlich, Deso-

gestrel von 0,05 mg bis 0,2 mg einschließlich, Dienogest von 1 mg bis 3 mg einschließlich, Gestoden von 0,035 mg bis 0,1 mg einschließlich, Levonorgestrel von 0,025 mg bis 0,5 mg einschließlich, Lynestrenol von 0,25 bis 3 mg einschließlich, Medroxyprogesteronacetat von 75 bis 200 mg einschließlich, Norethisteron von 0,175 bis 1,5 mg einschließlich, Norgestimat von 0,1 bis 0,3 mg einschließlich, Norgestrel von 0,015 mg bis 0,75 mg einschließlich, Norethisteronacetat von 0,25 bis 3 mg einschließlich, Norestisteronnanthrat von 100 mg bis 300 mg einschließlich, Drospironon von 1,5 mg bis 4 mg einschließlich, Ethinylestradiol von 10 µg bis 50 µg einschließlich, Mestranol von 25 µg bis 50 µg einschließlich und /oder Estradiol (als Vertreter des natürlichen Estrogens) von 0,25 mg bis 6 mg einschließlich aufweisen.

Bei der erfindungsgemäßen Darreichungsform kann auch vorgesehen sein, daß mindestens eine der Verpackungseinheiten pro Einnahmepause Placebos in der der Dauer der jeweiligen Einnahmepause entsprechenden Anzahl aufweist.

Schließlich kann auch vorgesehen sein, daß die Dosierung der Hormonkomponente(n) von Einnahmeabschnitt zu Einnahmeabschnitt sukzessive erniedrigt ist.

Der Erfindung liegt die überraschende Erkenntnis zugrunde, daß es gelingt, die gestellte Aufgabe zu lösen, indem die Einnahmephasen von Einnahmeabschnitt zu Einnahmeabschnitt sukzessive verlängert werden. Die Anzahl der zu Beginn auftretenden Schmier- und Durchbruchblutungen wird im Vergleich zu solchen Regimes verringert, bei denen von Beginn an die Einnahmephase länger als 21 oder auch 24 Tage ist. Die erfindungsgemäßen Regimes eignen sich besonders für Erstanwenderinnen von oralen Kontrazeptiva, welche die Anzahl der Abbruchblutungen reduzieren wollen.

Die Darreichung der Dosierungseinheiten erfolgt so, daß die Dosierungseinheiten als Einnahmezyklus gebündelt werden. Soll die Applikation beispielsweise mit Tabletten erfolgen, so können die Tabletten für einen Einnahmezyklus mit einem Blister dargereicht werden. Der oder die Bündel, die für einen Einnahmeabschnitt benötigt werden, werden in einer Packung angeboten. Die Packungen für verschiedene Einnahmeabschnitte sind deutlich als solche ge-

16  
23

kennzeichnet. Da die Anzahl der Einnahmezyklen des letzten Einnahmeabschnitts a priori unbekannt ist, muß sich die Anzahl der enthaltenen Bündel nach Gründen richten, die nicht durch das Verfahren vorgegeben sind.

Natürlich können auch andere Applikationsformen angewendet werden. Dabei können bei oraler Applikation anstelle von Tabletten Kapseln etc. verwendet werden. Transdermale Applikationsmöglichkeiten umfassen Pflaster, Cremes, Gele, etc. Auch Implantate sowie hormonbeladene IUDs sind anwendbar, jeweils selbstverständlich unter entsprechender Anpassung der Dosierung.

- Das erfindungsgemäße Verfahren zur Kontrazeption bei Frauen ist in mindestens zwei Einnahmeabschnitte gegliedert. Bis auf den letzten Einnahmeabschnitt ist die Dauer aller Abschnitte vorgegeben. Die Dauer des letzten Einnahmeabschnitts ist durch das erfindungsgemäße Verfahren nicht festgelegt. Das Einnahmeregime kann vielmehr von der Anwenderin des erfindungsgemäßen Verfahrens beliebig ausgedehnt werden.

Jeder Einnahmeabschnitt besteht aus exakt einem Einnahmezyklus oder einer Folge von unmittelbar aneinander anschließenden Einnahmezyklen. Ein Einnahmezyklus setzt sich aus einer Einnahmephase und einer Einnahmepause zusammen, welche der Einnahmephase unmittelbar folgt, oder dieser unmittelbar vorangeht. Während der Einnahmephase werden pro Tag eine Kombination von z. B. einem Estrogen und einem Gestagen, ein Gestagen allein oder auch eine andere geeignete Substanz oder Substanzkombinationen angewendet. Während der Einnahmepause erfolgt eine derartige Einnahme nicht, wobei aber Placebos vorgesehen sein können. Alle Einnahmephasen desselben Einnahmeabschnittes haben dieselbe Dauer. Dies gilt auch für die Einnahmepausen. Die Dauer der Einnahmephasen verlängert sich von Einnahmeabschnitt zu Einnahmeabschnitt, wobei dies aber für die Einnahmepausen nicht unbedingt gilt.

Nachstehend wird die Erfindung anhand von Ausführungsbeispielen im Einzelnen erläutert.

In den Beispielen bezeichnet "E" eine Einnahmephase und "P" eine Einnahmepause. Die unmittelbar darauf folgende Zahl gibt die Dauer in Tagen an. Die Einnahmeabschnitte sind durch Unterstreichungen verdeutlicht. Die Fortsetzungspunkte "..." stehen für die beliebige Wiederholung der Einnahmezyklen des letzten Einnahmeabschnitts. Die unbestimmte Anzahl der Einnahmezyklen des letzten Abschnitts ist mit dem Zeichen "#" dargestellt.

#### Beispiel 1

Einnahmeregime: E21 P7 E42 P7 E42 P7 ...

Es sind 2 Einnahmeabschnitte vorgesehen, die Anzahl der Einnahmezyklen beträgt 1-#. Die Hormon-Tageseinheiten enthalten jeweils 3 mg Drospirenon und 20 µg Ethinylestradiol.

#### Beispiel 2

Einnahmeregime: E21 P5 E21 P5 E49 P7 E49 P7 ...

Es sind 2 Einnahmeabschnitte vorgesehen, die Anzahl der Einnahmezyklen beträgt 2-#. Die Hormon-Tageseinheiten enthalten jeweils 3 mg Drospirenon und 30 µg Ethinylestradiol.

#### Beispiel 3

Einnahmeregime: E24 P4 E24 P4 E24 P4 E48 P6 E48 P6 E48 P6 E48 P6 ...

Es sind 2 Einnahmeabschnitte vorgesehen, die Anzahl der Einnahmezyklen beträgt 3-#. Die Hormon-Tageseinheiten enthalten jeweils 0,075 mg Gestoden und 20 µg Ethinylestradiol.

#### Beispiel 4

Einnahmeregime: E21 P7 E49 P7 E77 P7 E77 P7 ...

Es sind 3 Einnahmeabschnitte vorgesehen, die Anzahl der Einnahmezyklen beträgt 1-1-#. Die Hormon-Tageseinheiten enthalten jeweils 0,075 mg Gestoden und 30 µg Ethinylestradiol.

#### Beispiel 5

Einnahmeregime: E20 P5 E40 P5 E40 P5 E60 P5 E60 P5 ...

Es sind 3 Einnahmeabschnitte vorgesehen, die Anzahl der Einnahmezyklen beträgt 1-2-#. Die Hormon-Tageseinheiten enthalten jeweils 0,15 mg Levonorgestrel und 20 µg Ethinylestradiol.

#### Beispiel 6

Einnahmeregime: E30 P6 E30 P6 E30 P6 E60 P6 E60 P6 E90 P6 E90 P6 ...

Es sind 3 Einnahmeabschnitte vorgesehen, die Anzahl der Einnahmezyklen beträgt 3-2-#. Die Hormon-Tageseinheiten enthalten jeweils 0,15 mg Levonorgestrel und 30 µg Ethinylestradiol.

#### Beispiel 7

Einnahmeregime: E21 P4 E42 P5 E63 P6 E84 P7 E84 P7 ...

Es sind 4 Einnahmeabschnitte vorgesehen, die Anzahl der Einnahmezyklen beträgt 1-1-1-#. Die Hormon-Tageseinheiten enthalten jeweils 2 mg Cyprotheronacetat und 35 µg Ethinylestradiol.

#### Beispiel 8

Einnahmeregime: E21 P7 E49 P7 E77 P7 E105 P7 E105 P7 ...

Es sind 4 Einnahmeabschnitte vorgesehen, die Anzahl der Einnahmezyklen beträgt 1-1-1-#. Die Hormon-Tageseinheiten enthalten jeweils 0,03 mg Norgestrel.

#### Beispiel 9

Einnahmeregime: E24 P4 E72 P6 E72 P6 E96 P7 E120 P7 E120 P7 ...

Es sind 4 Einnahmeabschnitte vorgesehen, die Anzahl der Einnahmezyklen beträgt 1-2-1-#. Die Hormon-Tageseinheiten enthalten jeweils 0,075 mg Gestoden und 20 µg Ethinylestradiol.

#### Beispiel 10

Bei einer Darreichungsform mit E21 P7 E49 P7 E77 P7 E77 P7 ... werden Tabletten mit einer Estrogen/Gestagen-Kombination verabreicht, die mit Blistern als Verpackungseinheiten dargestellt werden. Hierzu werden drei verschiedene Verpackungseinheiten angeboten.

Verpackungseinheit 1 enthält einen Blister mit 21 Tabletten der Estrogen/Gestagen-Kombination, Verpackungseinheit 2 enthält einen Blister mit 49 Tabletten der Estrogen/Gestagen-Kombination, Verpackungseinheit 3 enthält drei Blister mit je 77 Tabletten der Estrogen/Gestagen-Kombination.

Die in der vorstehenden Beschreibung und den Ansprüchen offenbarten Merkmale können sowohl einzeln als auch in beliebiger Kombination für die Verwirklichung der Erfindung in ihren verschiedenen Ausführungsformen wesentlich sein.

20  
77

# BOEHMERT & BOEHMERT

## ANWALTSSOZIELTÄT

Boehmert & Boehmert • P.O.B. 10 71 27 • D-28071 Bremen

Deutsches Patent- und Markenamt  
Zweibrückenstr. 12

80297 München

DR.-ING. KARL BOEHMERT, PA (1899-1973)  
DIPL.-ING. ALBERT BOEHMERT, PA (1902-1993)  
WILHELM J. H. STAHLBERG, RA, Bremen  
DR.-ING. WALTER HOORMANN, PA\*, Bremen  
DIPL.-PHYS. DR. HEINZ GODDAR, PA\*, München  
DR.-ING. ROLAND LIESEGANG, PA\*, München  
WOLF-DIETER KUNTZE, RA, Bremen, Alicante  
DIPL.-PHYS. ROBERT MÜNZHUBER, PA (1933-1992)  
DR. LUDWIG KOUKER, RA, Bremen  
DR. (CHEM.) ANDREAS WINKLER, PA\*, Bremen  
MICHAELA HUTH-DIERIG, RA, München  
DIPL.-PHYS. DR. MARION TÖNHARDT, PA\*, Düsseldorf  
DR. ANDREAS EBERT-WEIDENFELLER, RA, Bremen  
DIPL.-ING. EVA LIESEGANG, PA\*, München  
DR. AXEL NORDEMANN, RA, Berlin  
DIPL.-PHYS. DR. DOROTHÉE WEBER-BRULS, PA\*, Frankfurt  
DIPL.-PHYS. DR. STEFAN SCHOHE, PA\*, München  
DR.-ING. MATTHIAS PHILIPP, PA\*, Bielefeld  
DR. JAN BERND NORDEMANN, LL.M., RA, Berlin

PA - Patentanwalt/Patent Attorney  
RA - Rechtsanwalt/Attorney at Law  
\* - European Patent Attorney  
- Brandenburg, zugelassen am OLG Brandenburg  
o - Maître en Droit  
Alle zugelassen zur Vertretung vor dem Europäischen Markenamt, Alicante  
Professional Representative at the Community Trademark Office, Alicante

PROF. DR. WILHELM NORDEMANN, RA, BRB  
DIPL.-PHYS. EDUARD BAUMANN, PA\*, Höfenkirchen  
DR.-ING. GERALD KLÖPSCH, PA\*, Düsseldorf  
DIPL.-ING. HANS W. GROENING, PA\*, München  
DIPL.-ING. SIEGFRIED SCHIRMER, PA\*, Bielefeld  
DIPL.-PHYS. LORENZ HANWINKEL, PA\*, Paderborn  
DIPL.-ING. DR. JAN TÖNNIES, PA, RA, Kiel  
DIPL.-PHYS. CHRISTIAN BIEHL, PA\*, Kiel  
MARTIN WIRTZ, RA, Düsseldorf  
DR. DETMAR SCHÄFER, RA, Bremen  
DIPL.-PHYS. DR.-ING. UWE MANASSE, PA\*, Bremen  
DR. CHRISTIAN CZYCHOWSKI, RA, Berlin  
DR. CARL-RICHARD HAARMANN, RA, München  
DIPL.-BIOL. DR. ARMIN K. BOHMANN, PA, München  
DIPL.-PHYS. DR. THOMAS L. BITTNER, PA\*, Berlin  
DR. VOLKER SCHMITZ, RA, München  
DR. FRIEDRICH NICOLAUS HEISE, RA, Potsdam  
DIPL.-PHYS. CHRISTIAN W. APPELT, PA, München  
DR. ANKE NORDEMANN-SCHIFFEL, RA\*, Potsdam  
KERSTIN MAUCH, LL.M., RA, Potsdam

In Zusammenarbeit mit/in cooperation with  
DIPL.-CHEM. DR. HANS ULRICH MAY, PA\*, München

Ihr Zeichen  
Your ref.

Ihr Schreiben  
Your letter of

Unser Zeichen  
Our ref.

Bremen,

Neuanmeldung

S10083(M)

12. September 2000

Schering AG  
Müllerstraße 170 - 178  
13342 Berlin

Verfahren zur Kontrazeption und dessen Darreichungsform

### Ansprüche

1. Verfahren zur hormonalen Kontrazeption, bei dem in einer Vielzahl von in zeitlich im wesentlichen unbegrenzter, ggf. mehrjähriger Abfolge aneinander anschließenden Einnahmeabschnitten, die jeweils aus mindestens einem Einnahmezyklus mit einer mehrtägigen, innerhalb des betreffenden Einnahmeabschnittes in der Dauer konstanten Einnahme-

- 4.90 -

Hollerallee 32 • D-28209 Bremen • P.O.B. 10 71 27 • D-28071 Bremen • Telefon +49-421-34090 • Telefax +49-421-3491768

MÜNCHEN - BREMEN - BERLIN - DÜSSELDORF - FRANKFURT - BIELEFELD - POTSDAM - BRANDENBURG - KIEL - PADERBORN - HÖHENKIRCHEN - ALICANTE

<http://www.boehmert.de>

e-mail: [postmaster@boehmert.de](mailto:postmaster@boehmert.de)

phase und einer mehrtägigen Einnahmepause bestehen, in der/den (jeweiligen) Einnahme-  
phase(n) pro Tag eine Tageseinheit mit mindestens einer kontrazeptiv wirkenden Hor-  
monkomponente, wie Estrogen und/oder Gestagen, und in der/den (jeweiligen) Einnah-  
mepause(n) entweder von jedweder Hormonkomponente freie Placebos verabreicht wer-  
den oder aber die jeweilige Einnahmepause gänzlich verabreichungsfrei bleibt und die  
Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnitts mindestens 22  
Tage beträgt, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) in jedweden  
einem nachfolgenden Einnahmeabschnitt vorangehenden Einnahmeabschnitt kürzer ist als  
in dem jeweils nachfolgenden Einnahmeabschnitt.

2. Verfahren nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der letzte Einnahmeabschnitt  
spätestens mit dem zehnten Einnahmezyklus beginnt.
3. Verfahren nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß in mindestens einem  
Einnahmeabschnitt die (jeweilige) Einnahmephase der (jeweiligen) Einnahmepause vor-  
angeht.
4. Verfahren nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß in mindestens einem  
Einnahmeabschnitt die (jeweilige) Einnahmepause der (jeweiligen) Einnahmephase vor-  
geht.
5. Verfahren nach einem der vorangehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die  
Dauer mindestens einer der Einnahmepausen 4 – 10 Tage beträgt.
6. Verfahren nach Anspruch 5, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer mindestens einer der  
Einnahmepausen 7 Tage beträgt.
7. Verfahren nach einem der vorangehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die  
Dauer der Einnahmepausen im letzten Einnahmeabschnitt konstant ist.

BOEHMERT & BOEHMERT

- 3 -

8. Verfahren nach Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmepausen ab dem ersten Einnahmeabschnitt einschließlich konstant ist.
9. Verfahren nach einem der vorangehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 40 Tage beträgt.
10. Verfahren nach Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 45 Tage beträgt.
11. Verfahren nach Anspruch 9 oder 10, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 50 Tage beträgt.
12. Verfahren nach einem der Ansprüche 9 bis 11, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 60 Tage beträgt.
13. Verfahren nach einem der Ansprüche 9 bis 12, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 70 Tage beträgt.
14. Verfahren nach einem der Ansprüche 9 bis 13, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 80 Tage beträgt.
15. Verfahren nach einem der Ansprüche 9 bis 14, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 90 Tage beträgt.

16. Verfahren nach einem der Ansprüche 9 bis 15, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 100 Tage beträgt.
17. Verfahren nach einem der Ansprüche 9 bis 16, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes mindestens 110 Tage beträgt.
18. Verfahren nach einem der Ansprüche 9 bis 17, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnittes höchstens 150 Tage beträgt.
19. Verfahren nach einem der vorangehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß als Hormonkomponente(n) Chlormadinonacetat mit einer Dosierung pro Tageseinheit von 0,5 mg bis 3 mg einschließlich, Cyprotheronacetat von 1 mg bis 3 mg einschließlich, Desogestrel von 0,05 mg bis 0,2 mg einschließlich, Dienogest von 1 mg bis 3 mg einschließlich, Gestoden von 0,035 mg bis 0,1 mg einschließlich, Levonorgestrel von 0,025 mg bis 0,5 mg einschließlich, Lynestrenol von 0,25 mg bis 3 mg einschließlich, Medroxyprogesteronacetat von 75 mg bis 200 mg einschließlich, Norethisteron von 0,175 mg bis 1,5 mg einschließlich, Norgestimat von 0,1 mg bis 0,3 mg einschließlich, Norgestrel von 0,015 mg bis 0,75 mg einschließlich, Norethisteronacetat von 0,25 mg bis 3 mg einschließlich, Norestisteronnanthrat von 100 mg bis 300 mg einschließlich, Drospirinon von 1,5 mg bis 4 mg einschließlich, Ethinylestradiol von 10 µg bis 50 µg einschließlich, Mestranol von 25 µg bis 50 µg einschließlich und/oder Estradiol (als Vertreter des natürlichen Estrogens) von 0,25 mg bis 4 mg einschließlich verwendet werden.
20. Verfahren nach einem der vorangehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Dosierung der Hormonkomponente(n) von Einnahmeabschnitt zu Einnahmeabschnitt sukzessive erniedrigt wird.

21. Darreichungsform zur hormonalen Kontrazeption, insbesondere zur Durchführung des Verfahrens nach einem der vorangehenden Ansprüche, mit einer Vielzahl von Verpackungseinheiten, die jeweils mindestens einen Satz von innerhalb eines aus jeweils einer Einnahmeperiode und einer angrenzenden Einnahmepause bestehenden Einnahmezyklus eines Einnahmeabschnittes, innerhalb dessen die Dauer der Einnahmeperioden konstant ist, zu verabreichenden Tageseinheiten aufweisen, welche jeweils mindestens eine der Dauer der Einnahmeperiode(n) entsprechende Anzahl von Hormon-Tageseinheiten, jeweils mit einem Gehalt von mindestens einer kontrazeptiv wirkenden Hormonkomponente, wie Estrogen und/oder Gestagen, sowie ggf. eine der Dauer der betreffenden Einnahmepause(n) entsprechende Anzahl von Placebos umfassen, wobei die Dauer der Einnahmeperiode(n) mindestens des letzten der dem ersten Einnahmeabschnitt folgenden Einnahmeabschnitte mindestens 22 Tage beträgt, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormontageseinheiten in jedweder einem nachfolgenden Einnahmeabschnitt vorangehenden Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit kleiner ist als in der dem jeweils nachfolgenden Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit.
22. Darreichungsform nach Anspruch 21, dadurch gekennzeichnet, daß der letzte Einnahmeabschnitt spätestens mit dem zehnten Einnahmezyklus beginnt.
23. Darreichungsform nach Anspruch 21 oder 22, dadurch gekennzeichnet, daß in mindestens einem Einnahmeabschnitt die (jeweilige) Einnahmeperiode der (jeweiligen) Einnahmepause vorangeht.
24. Darreichungsform nach Anspruch 21 oder 22, dadurch gekennzeichnet, daß in mindestens einem Einnahmeabschnitt die (jeweilige) Einnahmepause der (jeweiligen) Einnahmeperiode vorangeht.
25. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 21 bis 24, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmeperiode der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 40 beträgt.

26. Darreichungsform nach Anspruch 25, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 45 beträgt.
27. Darreichungsform nach Anspruch 25 oder 26, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 50 beträgt.
28. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 25 bis 27, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 60 beträgt.
29. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 25 bis 28, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 70 beträgt.
30. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 25 bis 29, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 80 beträgt.
31. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 25 bis 30, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 90 beträgt.
32. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 25 bis 31, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmephase der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 100 beträgt.

33. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 25 bis 32, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmeperiode der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit mindestens 110 beträgt.
34. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 25 bis 33, dadurch gekennzeichnet, daß die Anzahl der Hormon-Tageseinheiten pro Einnahmeperiode der dem letzten Einnahmeabschnitt entsprechenden Verpackungseinheit höchstens 150 beträgt.
35. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 21 bis 34, dadurch gekennzeichnet, daß die Hormon-Tageseinheiten jeweils Chlormadinonacetat von 0,5 mg bis 3 mg einschließlich, Cyprotheronacetat von 1 mg bis 3 mg einschließlich, Desogestrel von 0,05 mg bis 0,2 mg einschließlich, Dienogest von 1 mg bis 3 mg einschließlich, Gestoden von 0,035 mg bis 0,1 mg einschließlich, Levonorgestrel von 0,025 mg bis 0,5 mg einschließlich, Lynestrenol von 0,25 mg bis 3 mg einschließlich, Medroxyprogesteronacetat von 75 mg bis 200 mg einschließlich, Norethisteron von 0,175 mg bis 1,5 mg einschließlich, Norgestimat von 0,1 mg bis 0,3 mg einschließlich, Norgestrel von 0,015 mg bis 0,75 mg einschließlich, Norethisteronacetat von 0,25 mg bis 3 mg einschließlich, Norestisteronnanthrat von 100 mg bis 300 mg einschließlich, Drospirinon von 1,5 mg bis 4 mg einschließlich, Ethinylestradiol von 10 µg bis 50 µg einschließlich, Mestranol von 25 µg bis 50 µg einschließlich und/oder Estradiol (als Vertreter des natürlichen Estrogens) von 0,25 mg bis 6 mg einschließlich aufweisen.
36. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 21 bis 34, dadurch gekennzeichnet, daß mindestens eine der Verpackungseinheiten pro Einnahmepause Placebos in der der Dauer der jeweiligen Einnahmepause entsprechenden Anzahl aufweist.
37. Darreichungsform nach einem der Ansprüche 21 bis 36, dadurch gekennzeichnet, daß die Dosierung der Hormonkomponente(n) von Einnahmeabschnitt zu Einnahmeabschnitt sukzessive erniedrigt ist.

### Zusammenfassung

Verfahren zur hormonalen Kontrazeption, bei dem in einer Vielzahl von in zeitlich im wesentlichen unbegrenzter, ggf. mehrjähriger Abfolge aneinander anschließenden Einnahmeabschnitte, die jeweils aus mindestens einem Einnahmezyklus mit einer mehrtägigen, innerhalb des betreffenden Einnahmezyklus in der Dauer konstanten Einnahmephase und einer mehrtägigen Einnahmepause bestehen, in der/den (jeweiligen) Einnahmephase(n) pro Tag eine Tageseinheit mit mindestens einer kontrazeptiv wirkenden Hormonkomponente, wie Estrogen und/oder Gestagen, und in der/den jeweiligen Einnahmepause(n) entweder von jedweder Hormonkomponente freie Placebos verabreicht werden oder aber die jeweilige Einnahmepause gänzlich verabreichungsfrei bleibt und die Dauer der Einnahmephase(n) mindestens des letzten Einnahmeabschnitts mindestens 22 Tage beträgt, dadurch gekennzeichnet, daß die Dauer der Einnahmephase(n) in jedwedem einem nachfolgenden Einnahmeabschnitt vorangehenden Einnahmeabschnitt kürzer ist als in dem jeweils nachfolgenden Einnahmeabschnitt, sowie Darreichungsform zur hormonalen Kontrazeption, insbesondere zu dessen Durchführung.

J-4072 25 85

**REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA**

**Certificación de Prioridad**  
**sobre la presentación de una solicitud de patente**

No. de referencia: 100 45 380.5

Fecha de solicitud: 14 de Septiembre del 2000

Solicitante/Propietario: Schering Aktiengesellschaft,  
Berlín/Alemania

Título: Método de anticoncepción y forma  
de administración del mismo

Clas. Int. de Patentes: A 61 K 31/57

Los documentos adjuntos son una copia fiel y exacta de los documentos originales de esta solicitud de patente

Munich, 10 de Marzo del 2003

Oficina Alemana de Patentes y Marcas

El Presidente

Por encargo: Joost

(Firma y Sello Oficial)

### Reivindicaciones

1. Método de anticoncepción hormonal, en el que en una pluralidad de secuencias temporales esencialmente ilimitadas y eventualmente de varios años de períodos de ingestión seguidos entre sí, cada uno de los cuales consiste en al menos un ciclo de ingestión con una fase de ingestión de duración constante de varios días dentro del correspondiente período de ingestión y una pausa de ingestión de varios días, en cada una de las fases de ingestión se administra por día una unidad diaria con por lo menos un componente hormonal de efecto anticonceptivo, como por ejemplo estrógeno y/o gestágeno, y en la(s) correspondiente(s) pausa(s) de ingestión o bien se administran placebo que no contienen ningún componente hormonal o bien la correspondiente pausa de ingestión se deja completamente libre de ingestión, y la duración de la(s) pausa(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de mínimo 22 días,

método caracterizado porque la duración de la(s) fase(s) de ingestión en todo período de ingestión anterior a un siguiente período de ingestión es menor que el respectivo siguiente período de ingestión.

2. Método de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por el hecho de que el último período de ingestión comienza a más tardar con el décimo ciclo de ingestión.

3. Método de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, caracterizado por el hecho de que en por lo menos un período de ingestión la (correspondiente) fase de ingestión precede a la (correspondiente) pausa de ingestión.

4. Método de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, caracterizado por el hecho de que en por lo menos un período de ingestión la (correspondiente) pausa de ingestión precede a la (correspondiente) fase de ingestión.

5. Método de acuerdo con una de las anteriores reivindicaciones, caracterizado por el hecho de que la duración de por lo menos una de las pausas de ingestión es de 4 - 10 días.

6. Método de acuerdo con la reivindicación 5, caracterizado por el hecho de que la duración de por lo menos una de las pausas de ingestión es de 7 días.

7. Método de acuerdo con una de las anteriores reivindicaciones, caracterizado por el hecho de que la duración de las pausas de ingestión en el último período de ingestión es constante.

8. Método de acuerdo con la reivindicación 7, caracterizado por el hecho de que la duración de las pausas de ingestión a partir del primer período de ingestión inclusive es constante.

9. Método de acuerdo con una de las anteriores reivindicaciones, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de por lo menos 40 días.

10. Método de acuerdo con la reivindicación 9, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de por lo menos 45 días.

11. Método de acuerdo con la reivindicación 9 o 10, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de por lo menos 50 días.

12. Método de acuerdo con la reivindicación 9 a 11, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de por lo menos 60 días.

13. Método de acuerdo con la reivindicación 9 a 12, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de in-

gestión de por lo menos el último período de ingestión es de por lo menos 70 días.

14. Método de acuerdo con la reivindicación 9 a 13, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de por lo menos 80 días.

15. Método de acuerdo con la reivindicación 9 a 14, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de por lo menos 90 días.

16. Método de acuerdo con la reivindicación 9 a 15, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de por lo menos 100 días.

17. Método de acuerdo con la reivindicación 9 a 16, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de por lo menos 110 días.

18. Método de acuerdo con la reivindicación 9 a 17, caracterizado por el hecho de que la duración de la(s) fase(s) de ingestión de por lo menos el último período de ingestión es de máximo 150 días.

19. Método de acuerdo con una de las anteriores reivindicaciones, caracterizado por el hecho de que como componente(s) hormonales se usan Chlormadinonacetato con una dosificación por unidad diaria de 0,5 mg hasta 3 mg inclusive, Cyprotheronacetato de 1 mg hasta 3 mg inclusive, Desogestrel de 0,05 mg hasta 0,2 mg inclusive, Dienogest de 1 mg hasta 3 mg inclusive, Gestoden de 0,035 mg hasta 0,1 mg inclusive, Levonorgestrel de 0,025 mg hasta 0,5 mg inclusive, Lynestrenol de 0,25 mg hasta 3 mg inclusive, Medroxiprogesteronacetato de 75 mg hasta 200 mg inclusive, Norethisteron de 0,175 mg hasta 1,5 mg

inclusive, Norgestimat de 0,1 mg hasta 0,3 mg inclusive, Norgestrel de 0,015 mg hasta 0,75 mg inclusive, Norethisteronacetato de 0,25 mg hasta 3 mg inclusive, Norethisteronenantato de 100 mg hasta 300 mg inclusive, Drosperinon de 1,5 mg hasta 4 mg inclusive, Ethinylstradiol de 10 µg hasta 50 µg inclusive, Mestranol de 25 µg hasta 50 µg inclusive y/o Estradiol (como representante del estrógeno natural) de 0,25 mg hasta 4 mg inclusive.

20. Método de acuerdo con una de las anteriores reivindicaciones, caracterizado por el hecho de que la dosificación del o de los componentes hormonales se reduce sucesivamente de período de ingestión a período de ingestión.

21. Forma de administración para la anticoncepción hormonal, en particular mediante la realización del método de acuerdo con una de las anteriores reivindicaciones, con una multiplicidad de unidades de empaque, cada una de las cuales presenta por lo menos un grupo de unidades diarias que se han de administrar dentro de un ciclo de ingestión de un período de ingestión, consistiendo cada ciclo de ingestión en una fase de ingestión y una pausa de ingestión y siendo la duración de las fases de ingestión constante, cada una de las unidades de empaque comprende por lo menos un número de unidades hormonales diarias correspondiente a la duración de la(s) fase(s) de ingestión, en cada caso con un contenido de por lo menos un componente hormonal de efecto anticonceptivo como por ejemplo estrógeno y/o gestágeno y eventualmente un número de placebos correspondiente a la duración de la(s) respectiva(s) pausa(s) de ingestión, para lo cual la duración de la(s) pausa(s) de ingestión de por lo menos el último de los períodos de ingestión siguiente al primer período de ingestión es de por lo menos 22 días,

forma de administración caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales en una unidad de empaque correspondiente a un período de ingestión anterior a un si-

guiente período de ingestión es menor que en la unidad de empaque del correspondiente siguiente período de ingestión.

22. Forma de ingestión de acuerdo con la reivindicación 21, caracterizada por el hecho de que el último período de ingestión comienza a más tardar con el décimo ciclo de ingestión.

23. Forma de ingestión de acuerdo con la reivindicación 21 o 22, caracterizada por el hecho de que en por lo menos un período de ingestión de (correspondiente) fase de ingestión precede a la (correspondiente) pausa de ingestión.

24. Forma de administración de acuerdo con la reivindicación 21 o 22, caracterizada por el hecho de que en por lo menos un período de ingestión la (correspondiente) pausa de ingestión precede a la (correspondiente) fase de ingestión.

25. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 21 a 24, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 40.

26. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 25, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 45.

27. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 25 o 26, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 50.

28. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 25 a 27, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la

unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 60.

29. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 25 a 28, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 70.

30. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 25 a 29, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 80.

31. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 25 a 30, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 90.

32. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 25 a 31, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 100.

33. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 25 a 32, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 110.

34. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 25 a 33, caracterizada por el hecho de que el número de unidades diarias hormonales por fase de ingestión de la unidad de empaque correspondiente al último período de ingestión es de por lo menos 150.

35. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 21 a 34, caracterizada por el hecho de que cada una de las unidades diarias hormonales presentan Chlormadinonacetato de 0,5 mg hasta 3 mg inclusive, Cyprotheronacetato de 1 mg hasta 3 mg inclusive, Desogestrel de 0,05 mg hasta 0,2 mg inclusive, Dienogest de 1 mg hasta 3 mg inclusive, Gestoden de 0,035 mg hasta 0,1 mg inclusive, Levonorgestrel de 0,025 mg hasta 0,5 mg inclusive, Lynestrenol de 0,25 mg hasta 3 mg inclusive, Medroxiprogesteronacetato de 75 mg hasta 200 mg inclusive, Norethisteron de 0,175 mg hasta 1,5 mg inclusive, Norgestimat de 0,1 mg hasta 0,3 mg inclusive, Norgestrel de 0,015 mg hasta 0,75 mg inclusive, Norethisteronacetato de 0,25 mg hasta 3 mg inclusive, Norethisteronenantato de 100 mg hasta 300 mg inclusive, Drospironon de 1,5 mg hasta 4 mg inclusive, Ethinylstradiol de 10 µg hasta 50 µg inclusive, Mestranol de 25 µg hasta 50 µg inclusive y/o Estradiol (como representante del estrógeno natural) de 0,25 mg hasta 4 mg inclusive.

36. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 21 a 34, caracterizada por el hecho de que por lo menos una de las unidades de empaque presenta por pausa de ingestión un número de placebos correspondiente a la duración de la respectiva pausa de ingestión.

37. Forma de administración de acuerdo con una de las reivindicaciones 21 a 36, caracterizada por el hecho de que la dosificación del (o de los) componente(s) hormonal(es) se reduce sucesivamente de período de ingestión a período de ingestión.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO  
Radicación : 03021128 00000001 Folios: 36  
Fecha (ARD): 2003-06-03 11:20:37  
Trámite : 011 PCT-PATENT 3/9 FASE MARC 329 COMPLETADA

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 03 - 37,357  
FECHA : MAYO 27 DE 2003

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE     | TIPO PAGO    | BANCO         | CUENTA      | No. PAGO | FECHA PAGO | Vr. PAGO     |
|-----------------|--------------|---------------|-------------|----------|------------|--------------|
| GUSTAVO HOLLMAN | CONSIGNACION | BANCO POPULAR | 050-00110-6 | 11724165 | 27/05/2003 | 1,983,000.00 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| CANT. | RENTISTICO              | CONCEPTO                             | TOTAL CONCEPTO |
|-------|-------------------------|--------------------------------------|----------------|
| 1     | 50005-01-01 SOLICITUDES | 82 INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EN NU | 112,000.00     |
|       |                         | TOTAL :                              | \$ 112,000.00  |

SON: CIENTO DOCE MIL PESOS

Ref 54077

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. \_\_\_\_\_



No. 03-021128- -00001-0000

Fecha: 2003-06-03 11:20:37

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra. 11 PATENTEIYII

Eve: 379 FASENACIONALII

Act. 329 CTOINFORMACION

Folios: 36

94

## REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

|                                                                                                              |                           | USUARIO | RADICADOR |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------|---------|-----------|
| <b>PATENTE DE INVENCION</b>                                                                                  | <b>MODELO DE UTILIDAD</b> | (X)     | (X)       |
| - Indicación de que se solicita la concesión de una patente.                                                 |                           | ( )     | (X)       |
| - Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.                      |                           | ( )     | (X)       |
| - Descripción de la invención.                                                                               |                           | ( )     | ( )       |
| - Dibujos de ser estos pertinentes.                                                                          |                           | ( )     | (X)       |
| - Comprobante de Pago de las tasas establecidas.                                                             |                           |         |           |
| <b>COMPLETA</b> (X)                                                                                          | <b>INCOMPLETA</b> ( )     |         |           |
| <b>DISEÑO INDUSTRIAL</b> ( )                                                                                 |                           |         |           |
| - Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial                                             |                           | ( )     | ( )       |
| - Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.                         |                           | ( )     | ( )       |
| - Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño. |                           | ( )     | ( )       |
| - Comprobante de pago de las tasas establecidas                                                              |                           | ( )     | ( )       |
| <b>COMPLETA</b> ( )                                                                                          | <b>INCOMPLETA</b> ( )     |         |           |
| <b>ESQUEMA DE TRAZADO</b> ( )                                                                                |                           |         |           |
| - Indicación de que solicita el registro de un Esquema de trazado.                                           |                           | ( )     | ( )       |
| - Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.                         |                           | ( )     | ( )       |
| - Representación gráfica del esquema de trazado                                                              |                           | ( )     | ( )       |
| - Comprobante de pago de las tasas establecidas.                                                             |                           | ( )     | ( )       |
| <b>COMPLETA</b> ( )                                                                                          | <b>INCOMPLETA</b> ( )     |         |           |

*Edson Norcino*  
Firma Responsable:

12-03-2003

Fecha:

ACCION: Consultar Siguiente Anterior Ir al detalle Primero ... |

|Seleccionar un(os) Registros

|-----

|SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

SISTEMA DE REGISTRO

| Fecha 04/09/2003

|-----

| MANTENIMIENTO DE PROTOCOLOS

|Numero : 605

|Fecha : 15/01/1974

|Conferido: SCHERINGAKTIENGESSELLSCHAFT

|

|Pais : DE ALEMANIA

|Ciudad : 355 BERGKAMEN

|Represent: S Sustituir : S Desistir : S

|No. Radicacion : Clase: Seev: Seac:

|-----

|scencia Codigo Ctr

Nombre

| 1 111 GOMEZ PRYOR FANNY LUCIA

| 2 111 A PRYOR VARON HERNANDO

| 3 126 CASTILLO PINEDA PEDRO

| Encontrados (1/1) registro(s)

+-----##

95