

ČESKOSLOVENSKÁ
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(19)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

250555

(11)

(B1)

(22) Přihlášeno 16 03 84
(21) (PV 1901-84)

(40) Zveřejněno 18 09 86

(45) Vydáno 15 07 88

(51) Int. Cl.⁴
A 61 K 31/60

[75]

Autor vynálezu

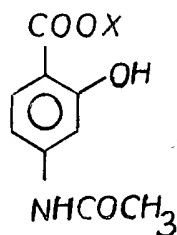
KALINA ČESTMÍR MUDr. CSc., PONERT JIŘÍ prom. biol. ing. DrSc.,
POTÁČOVÁ MILOSLAVA, JARÝ JIŘÍ prof. ing. DrSc., PRAHA

(54) Protinádorový prostředek

1

2

Protinádorový prostředek je tvořen sloučeninou kyseliny N-acetyl-p-aminosalicylové vzorce



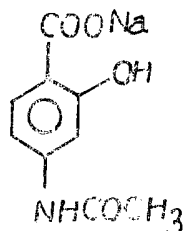
kde X je anorganický nebo organický kation.

Protinádorový prostředek je netoxický a je významný pro léčbu, zejména sarkomu.

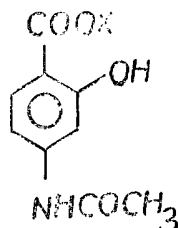
Vynález se týká protinádorového prostředku.

Při chemoterapii nádorů jsou dosud užívány sloučeniny, které jsou málo účinné nebo působí toxicky i na zdravé tkáně, což je jejich závažným nedostatkem.

Jak vyplývá z následujícího příkladu, použití sloučeniny vzorce



je založeno na objevení nové vlastnosti, a to jejího protinádorového účinku při současné netoxičnosti. Podstatou vynálezu je netoxický prostředek proti zhoubným nádorům, který je tvořen sloučeninou vzorce

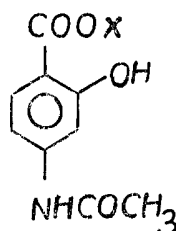


kde

X je anorganický nebo organický kation.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

Protinádorový prostředek, zejména proti sarkomu, vyznačený tím, že je tvořen sloučeninou kyseliny N-acetyl-p-aminosalicylové vzorce



Pro praktické využití je důležité, že sloučenina je netoxická. Při léčení nádorových onemocnění jsou tedy vyloučeny nežádoucí vedlejší účinky, k nimž dochází při užití běžných cytostatik, která bývají toxická.

Prostředek podle vynálezu se objasňuje v dále uvedeném příkladu:

U sodné soli kyseliny N-acetyl-para-aminosalicylové byla autory vynálezu objevena protinádorová účinnost. Zkoušeny byly in vivo dávky do 500 mg/kg.

Při užití metodiky podle Pujmana V. (Voprosy onkologii 1, No. 4, 93, 1955) bylo autory zjištěno, že sodná sůl kyseliny N-acetyl-para-aminosalicylové v dávkách 150 mg/kg a 300 mg/kg brzdí leukom Le o 16%. Při použití metodiky podle Larionova L. V. [Chimioterapija zlokačestvennyh opucholej Moskva, Medicina, 1962] bylo autory zjištěno, že při dávce 300 mg/kg je brzděn růst nádoru v případě sarkomu S-180 o 87 %.

Přitom je sodná sůl kyseliny N-acetyl-para-aminosalicylové netoxická, o čemž svědčí následující údaje. Akutní toxicita sloučeniny ve fyziologickém roztoku byla testována intravenózně na myších — je nižší než 0,5 g/kg tělesné hmotnosti. Chronická toxicita byla testována perorálně na krysách při denních dávkách 0,5 g/kg tělesné hmotnosti podávaných po dobu 10 dnů a při denních dávkách 1 g/kg tělesné hmotnosti podávaných po dobu 10 dnů. Proti kontrolní skupině, jak v případě samic, tak v případě samců, nebyly zjištěny rozdíly, což svědčí o netoxičnosti i při vysokých denních dávkách opakovaně podávaných.

kde X je anorganický nebo organický netoxický kation, například Na.