



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

240 093

(11) (B1)

- (61) Autorské osvědčení závislé na AO č. 149 C28
(23) Výstavní priorita
(22) Přihlášeno 27 06 84
(21) PV 4939-84

(51) Int. Cl. 4

A 61 K 37/34,
A 61 K 47/00

- (40) Zveřejněno 13 06 85
(45) Vydáno 01 07 87

(75)
Autor vynálezu

LUKÁČ JURAJ ing.;
ŠULCOVÁ MILADA PhMr., PRAHA

- (54) Stabilizovaný vodný injekční roztok
deamino¹, karba¹, O-methyltyrosin²-
oxytocinu

Řešení se týká stabilizovaného vodného injekčního roztoku deaminol, karba¹, O-methyltyrosin²-oxytocinu chráněného čs. AO č. 149 028, syntetického analogu oxy-
cinu, používaného klinicky v gynekologické praxi. Pro zvýšení rozpustnosti účinné látky obsahuje roztok přísadu 0,1 až 5,0 % hmot. vztaženo na celkovou hmotnost injekčního roztoku, s výhodou 1,5 % hmot. glycinu, popřípadě diglycinu i triglycinu. Navíc může obsahovat též desinfekční látku, například m-kresol nebo chlorbutanol.

Vynález se týká stabilizovaného vodného injekčního roztoku deamino¹, karba¹, O-methyltyrosin²-oxytocinu chráněného čs. A0 č. 149 028, zavedeného do klinické praxe, především v gynekologii.

Oproti přírodnímu hormonu má analog oxytocinu, připravený podle citovaného čs. A0, substituovanou molekulu. Působením proteolytických enzymů docházelo v organismu při metabolických pochodech k odštěpování této přidané části a tím klesala účinnost preparátu. Specifická aktivita a doba působení analogu oxytocinu byly totaž nepřímo úměrné a navíc se podstatně snížila rozpustnost proti původnímu oxytocinu.

Uvedené nevýhody odstraňuje stabilizovaný vodný injekční roztok deamino¹, karba¹, O-methyltyrosin²-oxytocinu chráněného čs. A0 149 028, vyznačující se tím, že jako zprostředkovadlo rozpouštění obsahuje glycin v množství 0,1 až 5,0 % hmot.vztaženo na celkovou hmotnost injekčního roztoku, s výhodou 1,5 % hmot., s případnou přísadou desinfekční látky, například m-kresolu nebo chlorbutanolu.

Na podkladě systematického výzkumu se tedy podařilo zásadně urychlit a zvýšit rozpustnost účinné látky pomocí vnitřních solí, například pomocí glycinu, diglycinu a triglycinu.

Následující příklady provedení stabilizovaný vodný injekční roztok podle vynálezu pouze dokládají, ale nijak neomezují.

Příklad 1

V 500 ml redestilované vody se rozpustí 10 g glycinu. Po rozpuštění se přidá 77 mg 100% analoga oxytocinu a zamíchá se. Zvlášť se rozpustí ve 200 ml redestilované vody při 60°C 1 000 mg m-kresolu. Po ochlazení na 25°C se tento roztok vlije do prvního roztoku a doplní se redestilovanou vodou na 1 000 ml.

Příklad 2

V 500 ml redestilované vody se rozpustí 15 g glycinu a po jeho rozpuštění se přidá 77 mg 100% analoga oxytocinu a zamíchá se. Zvlášť se ve 300 ml redestilované vody rozpustí 2 000 mg chlorbutanolu při 70°C. Po rozpuštění se roztok ochladí na 25°C, smíchá s předchozím roztokem a doplní redestilovanou vodou na celkový objem 1 000 ml.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

240 093

Stabilizovaný vodný injekční roztok deamino¹,karba¹,
O-methyltyrosin²-oxytocinu chráněného čs. AO č.149 028, vyznačující se tím, že jako zprostředkovadlo rozpouštění obsahuje glycin v množství 0,1 až 5,0 % hmot. vztaženo na celkovou hmotnost injekčního roztoku, s výhodou 1,5 % hmot., s případnou přísadou desinfekční látky, například m-kresolu nebo chlorbutanolu.