



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

196185

(11)

(B1)

/22/ Přihlášeno 07 06 78
/21/ /PV 3702-78/

(51) Int. Cl.³
A 61 K 31/00

(40) Zveřejněno 29 06 79

(45) Vydáno 15 06 82

(75)

Autor vynálezu

MALEEV ATANAS CHRISTOV prof. MUDr., KOTEV GEORGI NIKOLOV MUDr.
a KRASTANOV LULTSCHO NENOV MUDr., SOFIE /BLR/

(54) Profylaktický antidotický prostředek vůči toxickému vlivu organofosforových pesticidů

1

Předmětem vynálezu je profylaktický antidotický prostředek vůči toxickému vlivu organofosforových pesticidů.

Až dosud nejsou známy účinné preventivní profylaktické prostředky určené pro zemědělské pracovníky, kteří přicházejí do stálého styku s organofosforovými pesticidy. Dosavadní obvyklou praxí je používat masek a ochranných obleků podle hygienických předpisů pro pracovníky s vysoce toxickými látkami. Tato opatření se ve větším počtu případů ukazují jako neúčinná a vedou k výskytu otrav různého stupně. V tomto státě, tj. Bulharsku, neexistují žádné předpisy pro používání profylaktických prostředků pracovníky pracujícími s pesticidy. Ve světové praxi takovéto prostředky téměř neexistují.

Účelem vynálezu je poskytnout prostředek k předběžné orální aplikaci, určený k ochraně osob pracujících s vysoce toxickými organofosforovými pesticidy, používanými v zemědělské praxi, před otravou.

Prostředek podle vynálezu zahrnuje
-hyoscin-H-butylbromid v množství 10 až 15 mg /buscolisin/,
-hydrochlorid 3-(-H-piperidyl)-1-fenyl-1-cyklohexyl-1-propanolu v množství 6 až 12 mg /parkisan/,
-3-dimethylkarbamoxyfenyltrimethylamoniumbromid v množství 5 až 6 mg /neostigmin/ a
-hydrochlorid 1-(-1-fenyl-2-methylamino)-propanolu v množství 5 až 6 mg /effedrin/.

Uvedené dvě sloučeniny společně mají silné centrální a periferní M- a H-holinolytické vlastnosti a antagonizují toxické účinky organofosforových pesticidů.

2

Třetí složka prostředku podle vynálezu je reversním inhibitorem holinesterázy a zvyšuje antidotické účinky prvních dvou složek tím, že zabranuje holinesteráze ireversibilně inhibovat účinky organofosforových pesticidů. Čtvrtá složka je symfatomimetikem a má korekční účinky na vliv prvních dvou složek, podobný vlivu atropinu, aniž však snižuje jejich účinnost. Jako celek má prostředek podle vynálezu velmi výrazný preventivní účinek při styku s toxickými dávkami organofosforových pesticidů v časovém rozmezí 6 až 8 hodin od orální aplikace a při styku s jedem.

Při použití 1 dávky denně nedochází k žádným vedlejším účinkům, vyjma lehkého pocitu vyschllosti v ústech, a to jen v řídkých případech. Bere-li se prostředek podle vynálezu 2- až 3krát denně, mohou se objevit některé vedlejší příznaky, jako je vyschllost v ústech, mírné rozšíření zornice, poruchy akomodace oka atd., které však rychle zmizí, jakmile se prostředek přestane brát. K těmto účinkům dochází následkem atropinu podobnému působení složek prostředku. Jedna tableta prostředku podle vynálezu stačí při orální aplikaci chránit pracovníky před toxickými účinky organofosforových pesticidů po jeden pracovní den.

Prostředek podle vynálezu je blíže objasněn dále uvedeným příkladem.

P ř í k l a d

Prostředek podle vynálezu má toto složení:

- hyoscin-H-butylbromid 10 mg

- hydrochlorid 3-/H-piperidyl/-1-fenyl-
-1-cyklohexyl-1-propanolu 6 mg
- 3-dimethylkarbamoxifenyltriethylamonium-
bromid 5 mg
- hydrochlorid 1-/1-fenyl-2-methyl/aminopropanolu 6 mg

Při orální aplikaci pokusným zvířatům skýtá prostředek podle vynálezu bezpečnou preventivní ochranu před nebezpečným pů-

sobením zaručeně smrtící dávky /1 LD₁₀₀/ fosdinu, neguvonu a jiných organofosforových sloučenin; veškerá pokusná zvířata se opět přivedou k životu, došlo-li k otravě 6 hodin před aplikací prostředku podle vynálezu, při 100% uhynutí kontrolních zvířat. U lidí nevyvolává prostředek podle vynálezu, bere-li se jednou denně, žádné vedlejší účinky, vyjma vyschlosti v ústech, a to jen v řídkých případech.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

Profylaktický antidotický prostředek vůči toxickému vlivu organofosforových pesticidů, vyznačující se tím, že obsahuje hyoscín-H-butylbromid v množství 10 až 15 mg, hydrochlorid 3-/H-piperidyl/-1-fenyl-

-1-cyklohexyl-1-propanolu v množství 6 až 12 mg, 3-dimethylkarbamoxifenyltrimethylamoniumbromid v množství 5 až 6 mg a hydrochlorid 1-/1-fenyl-2-methyl/aminopropanolu v množství 5 až 6 mg.