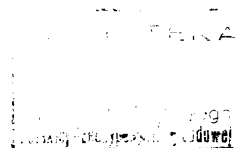


10 sierpnia 1929 r.

2



H61K 1500



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIŚ PATENTOWY

Nr 10146.

Kl. 30 h 3.

Firma E. Merck
(Darmstadt, Niemcy).

Sposób przyrządzania preparatów przeciw krzywicy.

Zgłoszono 24 lutego 1928 r.

Udzielono 9 marca 1929 r.

Pierwszeństwo: 8 marca 1927 r. dla zastrz. 1, 3, 4 (Niemcy).

Wiadomo, że można przyrządzić preparaty działające przeciw krzywicy tak, że wystawia się przeciwkrzywicową prowitaminę względnie środek, zawierający tę proitaminę na działanie aktywującego światła. Źródła światła, któremi dotychczas można było otrzymać aktywizację prowitaminy na witaminę są znamienne tem, że są bogate w promienie pozafioletkowe. Źródła światła, które w pozafioletkowej części widma nie posiadają żadnej lub nieznacznej emisji, nie można było dotychczas zużyć do aktywowania.

Obecnie udało się przeprowadzić aktywizację przeciwkrzywicowej prowitaminy na przeciwkrzywicową witaminę także

światłem o dłuższej fali, o ile przeprowadza się naświetlanie w obecności sensibilizatora. Ponieważ zasięg emisji zwykłych źródeł świetlnych leży wyłącznie albo prawie wyłącznie w widzialnej części widma, to zużytkowanie tej łatwo dostępnej energii świetlnej oznacza nadzwyczaj wielki efekt techniczny. Stwierdzono dalej, że aktywowanie światłem pozafioletkowym poprzez odpowiednie sensibilizatory doznaje znacznego przyspieszenia.

Opisane przykłady wykazują sposób zużycia nowego wynalazku i wielki postęp wobec dotychczas znanych. W żadnym przypadku nie może nastąpić za bardzo intensywne zetknięcie roztworu z tlenem.

Do prawidłowego przeprowadzania tego sposobu wystarcza, ogólnie, postarać się o to, by powietrze nie przechodziło przez roztwór; ewentualnie przeprowadza się azot przez roztwór. Dokładne stosunki łatwo odnaleźć każdorazowo przez próby z sensibilizatorem. Ilość sensibilizatora może wahać się w szerokich granicach. Już ślady powodują zauważalne działanie. Naturalnie nie obiera się ilości sensibilizatora nieproporcjonalnie wielkiej w stosunku do ilości substancji, która ma być przemieniona, ponieważ inaczej występują niepożądane reakcje poboczne.

Przykład I. 0,1% roztworu ergosteryny naświetla się w aparaturze kwarcowej źródłem świetlnym, które prawie wyłącznie wydaje promienie pozafioletkowe (światło iskrowo-magnezowe). Po siedmiu godzinach ergosteryna jest praktycznie przeprowadzona w przeciwkrzywicową witaminę; o ile doświadczenie to powtarza się w obecności 5% jodu (odnośnie do ergosteryny), to czas aktywowania skraca się na 2½ godziny przy poza tem równych warunkach.

Przykład II. Gdy 0,1% alkoholowy roztwór ergosteryny wystawia się w naczyniach szklanych na promienie zwykłego źródła świetlnego, np. 60 woltowej żarówki, to nie zachodzi żadne stwierdzalne aktywowanie prowitaminy. Gdy powtórzy się doświadczenie w tychże warunkach w obecności 5% erytrozyny (odnośnie do ergosteryny), ergosteryna po mniej więcej dwóch godzinach zostaje całkowicie zamieniona.

Przykład III. 0,2% roztwór ergosteryny w alkoholu zadaje się dwubromodwunitrofluoresceiną (5% użytej ergosteryny). Roztwór ten wystawia się na promienie zwykłych półwattowych żarówek, wykluczając dopływ powietrza. Najcelowiej osiąga się to przez zanurzenie żarówki w roztworze alkoholowym. Strumień azotu, przeprowadzany przez płyn podczas naświetlania, zastępuje mierzenie. Roztwór trzeba dalej podczas naświetlania chłodzić. Po

pewnym czasie roztwór zaczyna zmieniać kolor, a wypada przetwór dehydracji ergosteryny (ergopinakon) w postaci drobnych kryształków. Naświetlanie przeciąga się tak długo, aż czerwony kolor roztworu zanika całkowicie lub prawie całkowicie. Próba digitoninowa wykazuje, że 80 — 90% ergosteryny utraciła swą strącalność digitoninową. Trwanie naświetlania stosuje się zupełnie do intensywności źródła świetlnego, wynosi ono np. dla 200 wattowej żarówki na 2 litry roztworu 10 — 12 godzin. Po oddzieleniu osadu krystalicznego pobiera się z roztworu alkoholowego próbkę i odparowuje ją w próżni bez dostępu powietrza. Pozostała żywica rozpuszcza się zupełnie lub prawie całkowicie w eterze naftowym. O ile większe ilości żywicy nie są rozpuszczalne w eterze naftowym, to przyjąc trzeba, że naświetlanie odbyło się w niedostatecznym izolowaniu od powietrza. Część nierozpuszczalna w eterze naftowym jest bowiem przetworem utlenienia ergosteryny. Ilość ergosteryny przemienionej oznacza się z ciężaru rozpuszczalnej w eterze naftowym żywicy i z tego daje się obliczyć ile procent materiału wyjściowego zostało w całości przemienione. Główną część alkoholowego roztworu odparowuje się w obecności oleju (np. sezamowego) i tym sposobem otrzymuje się roztwór produktu przemiany w oleju.

Zastrzeżenia patentowe.

1. Sposób otrzymywania przetworów działających przeciw krzywicy, znamienny tem, że aktywujące naświetlanie przeciwkrzywicowej prowitaminy, przedewszystkiem ergosteryny albo substancyj zawierających prowitaminę albo ergosterynę, wykonuje się w obecności sensibilizatorów.

2. Sposób według zastrz. 1, znamienny tem, że jako sensibilizator stosuje się dwubromo-dwunitrofluoresceinę.

3. Sposób według zastrz. 1, znamienny

tem, że substancja, która ma być aktywowana, jest rozpuszczona w odpowiednim rozpuszczalniku, np. ergosteryna w alkoholu etylowym.

4. Sposób według zastrz. 1 lub 2, znamieny tem, że do naświetlania używa się

źródła światła, które nie wysyła promieni pozafiołkowych.

Firma E. Merck.

Zastępca: Dr. inż. M. Kryzan,
rzecznik patentowy.