

(19) DEUTSCHE DEMOKRATISCHE REPUBLIK

PATENTSCHRIFT



Wirtschaftspatent

Erteilt gemäß § 5 Absatz 1 des Änderungsgesetzes
zum Patentgesetz

ISSN 0433-6461

(11)

1586 13

Int.Cl.³

3(51) A 61 K 31/505

AMT FÜR ERFINDUNGS- UND PATENTWESEN

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

(21) WP A 61 K/ 2293 383

(22) 20.04.81

(44) 26.01.83

- (71) AKADEMIE DER WISSENSCHAFTEN DER DDR, BERLIN;DD;
(72) VON JANTA-LIPINSKI, MARTIN, DR. RER. NAT. DIPL.-CHEM.;
BAERWOLFF, DIETER, DR. RER. NAT. DIPL.-CHEM.;
LANGEN, PETER, PROF. DR. RER. NAT. HABIL. DIPL.-BIOL.; HEIDER, HARALD, DIPL.-MED.; DD;
PRESBER, HANS W., DR. DIPL.-MED.; SCHROEDER, CORNELIA, DR. RER. NAT. DIPL.-CHEM.;
REEFSCHLAEGER, JUERGEN, DR. RER. NAT. DIPL.-CHEM.; DD;
(73) siehe (72)
(74) FZ F. MOLEKULARBIOLOGIE UND MEDIZIN, AG PAT.-, NEUERERW., 1115 BERLIN,
LINDENBERGER WEG 70/1

(54) VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG EINES VIROSTATISCHEN MITTELS

(57) Die Erfindung betrifft die Herstellung eines Mittels gegen Influenza- und Paramyxoviren. Das Ziel besteht darin, ein wirksames Mittel ohne Nebenwirkungen zu entwickeln. Die Herstellung des Mittels erfolgt durch Mischen von 0,1 bis 0,3 mg 1- β -D-Glucopyranosyl-6-fluorthymin in den üblichen Träger- und Zusatzstoffen bis zur Gesamtmenge von 1 g.

Heider

Dr. Schroeder

-/-

Dr. Presber

Dr. Reefschläger

Dr. v. Janta-Lipinski

Dr. Bärwolff

Prof. Dr. Langen

"Verfahren zur Herstellung eines virostatistischen Mittels"

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung eines Mittels gegen Influenza- und Paramyxoviren.

Anwendungsgebiet ist die pharmazeutische Industrie.

Charakteristik der bekannten technischen Lösungen

Influenza ist eine weitverbreitete, durch Viren verursachte Krankheit, die epidemieartig große Teile der Bevölkerung befallt. Zu ihrer Therapie werden Rimantadin und Amantadin angewendet. Sie besitzen den gleichen Wirkungsmechanismus, indem sie das intrazelluläre Uncoating der Virus-RNA und die Primärtranscription des viralen Genoms hemmen. Sie werden vorwiegend prophylaktisch eingesetzt und sind nur in den ersten 24 Stunden post infectionem wirksam.

Sie besitzen als Virostatica zwei entscheidende Nachteile:

- Zum einen zeigen sich Nebenwirkungen wie Unwohlsein und in schweren Fällen neurologische Störungen, zum anderen weisen 1980 isolierte Influenzastämme bereits eine natürliche Resistenz auf.

Ziel der Erfindung

Die Erfindung hat das Ziel, ein wirksames Mittel gegen Influenza- und Paramyxoviren herzustellen, das keine Nebenwirkungen hat.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Das erfindungsgemäße Mittel gegen Influenza- und Paramyxoviren ist dadurch gekennzeichnet, daß es 10 - 100 mg 1- β -D-Glucopyranosyl-6-fluorthymin in einem Gramm enthält. Die Herstellung erfolgt durch Mischung, wobei als Träger- und Zusatzstoffe Stärke, Talk, Mg-stearat, K-stearat, Stearinsäure, Paraffin, Cetylalkohol, Pectin, Saccharose, Gummi arabicum oder Dextrin Verwendung finden. Das Mittel wird bevorzugt in Tabletten- oder Drageeform eingesetzt.

Das erfindungsgemäße Mittel zeigt eine überraschend hohe Wirksamkeit gegen Influenza- und Paramyxoviren, Nebenwirkungen wurden dabei bisher nicht beobachtet.

Die Wirkung des Mittels soll anschließend an einem Beispiel näher erläutert werden.

Ausführungsbeispiel

Maß der Wirksamkeit ist die Virusvermehrung, gemessen als Virusertrag. Die Messung erfolgt als Hemmung der Reduktion der Hämadsorption. Im Testsystem werden Hühnerfibroblasten mit dem dem menschlichen Grippevirus eng verwandten Geflügelpestvirus bzw. Hong Kong 1/68-, PR 8-, A 2 KRASNODAR-, FM 1-, A/1/64-Virus versetzt. Nach Zusatz von 50 μ Mol 1- β -D-Glucopyranosyl-6-fluorthymin in 100 ml 0,1 % wäßriger DMSO-Lösung zum Testsystem wird eine 100 %ige Hemmung erzielt. Um diese Hemmwirkung zu erreichen, ist die dreifache Menge Amantadin notwendig.

229338 3

Erfindungsanspruch

Verfahren zur Herstellung eines virostatistischen Mittels, dadurch gekennzeichnet, daß 10 - 100 mg 1- β -D-Glucopyranosyl-6-fluorthymin mit den üblichen Träger- und Zusatzstoffen bis zur Gesamtmenge von 1 g vermischt werden.