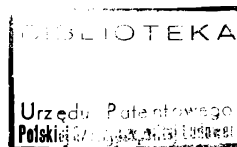


15 września 1925 r.

2

URZĄD PATENTOWY



A61k, 27/10

RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ OPIS PATENTOWY

Nr 1998.

Kl. 30 h 2.

-Gesellschaft für Chemische Industrie in Basel,
Société pour l'Industrie Chimique à Bâle
(Bazylea, Szwajcaria).

**Sposób przeprowadzenia nierozpuszczalnych lub trudnorozpuszczalnych w wodzie lekarstw
w stan nadający się do wkraplania i zastrzyków.**

Zgłoszono 17 maja 1924 r.

Udzielono 30 kwietnia 1925 r.

Pierwszeństwo: 14 lipca 1923 r. (Szwajcaria).

Wiadomo, iż stężony wodnisty uretan posiada własność silniejszego lub słabszego podnoszenia rozpuszczalności licznych związków nierozpuszczalnych lub trudnorozpuszczalnych. Roztwory jednak, otrzymywane w ten sposób, wykazują, o ile nie są same przez się zbyt rozcieńczone, własność tego rodzaju, iż rozpuszczona substancja przy dalszem rozcieńczaniu ponownie osiada. Udało się np. otrzymywać tym sposobem tylko 3%-owy roztwór kwasu dwuetylobarbiturowego, który można dowolnie rozcieńczać bez obawy wytrącenia. Dawniejszym tym sposobem nie udaje się jednak wytwarzać lekarstw w postaci na-

dającej się do spuszczenia ich kroplami w stężeniu używanem w praktyce.

Obecnie uczyniono wbrew wszelkim oczekiwaniom, spostrzeżenie, że można otrzymać nadające się do wkraplania i zastrzyków roztwory lekarstw nierozpuszczalnych lub trudnorozpuszczalnych bardziej stężone, jeżeli do rozpuszczania zastosować mieszaninę, składającą się z rozpuszczalnych w wodzie estrów kwasu karbaminoowego i moczników podstawionych alkilem lub alkilenem, niekiedy w obecności wody.

Najkorzystniejszym stosunkiem obu tych składników w mieszaninie okazał się stosunek 1:1, lecz można również stosować z

dobrym skutkiem mieszaniny o innym ustosunkowaniu składników.

Przykład 1. Po zmieszaniu 10 cz. etylomocznika, 10 cz. uretanu i 5 cz. wody otrzymujemy przy wydzieleniu się znacznej ilości ciepła płyn przeźroczysty, krzepnący dopiero w mieszaninie soli kuchennej i lodu. Płyn ten rozpuszcza 10% kwasu dwuallilobarbiturowego. Otrzymany roztwór nadaje się do zastrzyków; przy wkraplaniu go do wody kwas dwuallilobarbiturowy się nie wydziela; ponadto roztwór daje się sterylizować w temperaturze 100°.

Przykład 2. Skoro zamiast wzmiankowanego w przykładzie 1 etylomocznika zastosować, celem uzyskania rozpuszczalnika, metylomocznik, natenczas wytwarza się mieszanina płynna, która w temperaturze zwykłej rozpuszcza ponad 10% kwasu dwuallilobarbiturowego.

Przykład 3. W ten sam sposób, jak i kwas alkilobarbiturowy, udaje się uczynić łatwo rozpuszczalnym i kwas fenyloetylobarbiturowy, a to przez zmieszanie go z alkilo lub alkilenomocznikiem, uretanem i wodą. Jako rozpuszczalnik służy np. mieszanina równych części dwuallilomocznika i uretanu z 1/2 częścią wody, która już w temperaturze poniżej 0° rozpuszcza 10% kwasu fenyloetylobarbiturowego.

Przykład 4. Uretan można zastąpić innemi estrami kwasu karbaminowego. Mieszanina, składająca się z estru allilowego kwasu karbaminowego, as. dwuallimocznika i wody w stosunku 1:1:1, rozpuszcza w temperaturze zwykłej około 10% kwasu fenyloetylobarbiturowego i roztwór pod względem swych własności zachowuje się jak i roztwór otrzymany w przykładzie 1.

Przykład 5. Również i kwas dwuallilobarbiturowy rozpuszcza się w mieszaninie składającej się z 40% dwuallilomocznika 40% estru propylowego kwasu karbaminowego i 20% wody. Roztwór ten daje się również wkraplać i sterylizować.

Przykład 6. 4 cz. dwuizobutylomocz-

nika, 4 cz. estru etylowego kwasu karbaminowego i 2 cz. wody tworzą mieszaninę topiącą w temperaturze 0°, która w stanie ciekłym rozpuszcza np. kwas dwuallilobarbiturowy. Po ochłodzeniu poniżej 0° roztwór zestala się, nie wydzielając jednak kwasu dwuallilobarbiturowego, wskutek czego po stopieniu można natychmiast używać roztwór przeźroczysty.

Przykład 7. Mieszanina, składająca się z 40 cz. etylomocznika, 40 cz. uretanu i 20 cz. wody, rozpuszcza znaczne ilości kamfory. Osiągnięty w ten sposób 10% roztwór kamfory można ostudzić do 10° i kamfóra się nie wydzieli. W roztworze, w którym etylomocznik zastąpiono przez as. dwuallimocznik, w tych samych warunkach rozpuszcza się nawet ponad 20% kamfory.

Przykład 8. Chinina rozpuszcza się w temperaturze zwykłej w ilości ponad 20% w roztworze składającym się z 40% dwuallimocznika, 40% uretanu i 20% wody.

Przykład 9. Alkohol benzylowy miesza się z rozpuszczalnikiem użytym w przykładzie 8 w stosunku dowolnym.

Przykład 10. Roztwór składający się z 40 cz. sym. dwumetylomocznika, 4 cz. uretanu i 2 cz. wody miesza nie tworząc zmętnienia z taką objętością paraldehydu.

Przykład 11. W mieszaninie, składającej się z jednakowych ilości as. dwuallimocznika, uretanu i wody, rozpuszcza się w temperaturze pokojowej 10% olejku sandałowego. Przy wkraplaniu do wody roztwór pozostaje przeźroczystym. Oprócz substancyj przytoczonych powyżej, daje się również przeprowadzić zapomocą mieszaniny rozpuszczalnych w wodzie alkilo wzgl. alkilenoczników i uretanów w stan rozpuszczalny, nadający się do wkraplania i zastrzykiwania, cały szereg innych nierozpuszczalnych wzgl. trudnorozpuszczalnych ciał, np. pouzyna, teofilina, pyrazolon, jak dwumetyloamido - fenyloetylopyrazolon, estry kwasowe jak np. eter etylowy kwasu p-aminobenzoesowego i t. p. związki.

Zastrzeżenie patentowe.

Sposób przeprowadzenia nierozpuszczalnych lub trudno w wodzie rozpuszczalnych lekarstw w stan, nadający się do wkrapiania i zastrzykiwania, znamienny tem, że lekarstwa te rozpuszcza się w mieszaninie składającej się z rozpuszczalnych w wodzie substancyj alkilo- wzgl. alkileno-

mocznikowych, rozpuszczalnych w wodzie estrów kwasu karbaminowego, ewentualnie w obecności wody.

Gesellschaft für Chemische
Industrie in Basel,
Société pour l'Industrie Chi-
mique à Bâle.

Zastępca: M. Skrzypkowski,
rzecznik patentowy: