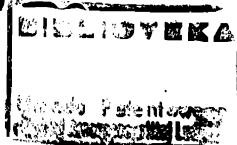




A61k 29/10

POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ
OPIS PATENTOWY



Nr 42948

Kl. 30 h, 2/30

VEB Farbenfabrik Wolfen

Wolfen, Niemiecka Republika Demokratyczna

**Sposób wytwarzania roztworu organicznych środków
leczniczych, zwłaszcza amidopiryny**

Patent trwa od dnia 23 lutego 1957 r.

Organiczne środki lecznicze, na przykład dwumetyloaminofenylo-dwumetylopirazonon, są trudno rozpuszczalne w rozpuszczalnikach obojętnych. Dlatego też nie szczędzono wysiłków w celu wynalezienia dla nich odpowiednich rozpuszczalników albo środków ułatwiających ich rozpuszczanie.

Roztwory otrzymywane za pomocą znanych dotychczas środków posiadają jednak odczyn kwaśny albo zasadowy, tak, że nie nadają się do stosowania pozajelitowego.

Znane środki ułatwiające rozpuszczanie działają również mniej lub więcej farmakodynamicznie.

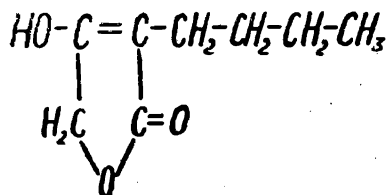
Zadaniem wynalazku było wynalezienie sposobu wytwarzania roztworów organicznych środków leczniczych, zwłaszcza amidopiryny za pomocą środka, możliwie obojętnego farmakodynamicznie, ułatwiającego rozpuszczanie.

Stwierdzono, że może otrzymać obojętne, wodne roztwory organicznych środków leczniczych, nadające się do stosowania pozajelitowego, jeżeli jako rozpuszczalnik dla tych leków zastosuje się wodne roztwory α , β' -dwupodstawionych butenolidów, w których jeden z dwóch wprowadzonych do szkieletu butenolidu podstawników posiada zdolność tworzenia soli. Szczególnie nadaje się do tego grupa hydroksylowa. Drugim podstawnikiem może być dowolna reszta alkilowa, aryłowa lub alkiloaryłowa, szczególnie dobrze nadaje się reszta butylowa lub benzylowa.

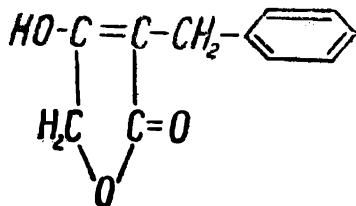
Według wynalazku środki ułatwiające rozpuszczalność stosuje się w postaci wodnych roztworów soli sodowych dwuetanolaminy lub dwuetyloaminoetanolu.

Środkiem ułatwiającym rozpuszczanie o wyjątkowym działaniu okazały się sole takich

związków jak α -n-butylo- β -hydroksy- $\Delta^{\alpha, \beta}$ -butenolid o wzorze strukturalnym:



oraz α -benzylo- β -hydroksy- $\Delta^{\alpha, \beta}$ -butenolid o wzorze strukturalnym:



Substancje te są w wysokim stopniu nietrujące i wykazują odwracalne działanie depresyjne.

Roztwór amidopiryny otrzymany sposobem według wynalazku wykazuje silniejsze działanie znieczulające, przeciwgorączkowe i przeciwflogistyczne, aniżeli sama amidopiryna. Poza tym roztwór ten nie wywołuje zatrzymywania wody, pobudza wydzielanie moczu a ponadto jest dobrze znoszony miejscowo.

Środek ułatwiający rozpuszczanie nie wpływa ujemnie na obraz krwi jak to czynią znane roztwory amidopiryny i jest ogólnie lepiej przyswajalny niż te ostatnie. Koncentracja jonów wodorowych w roztworze według wynalazku nie przekracza wartości 7,2

Przykład. W 700 częściach wagowych wody rozpuszcza się 150 części wagowych α -n-butylo- β -hydroksy- $\Delta^{\alpha, \beta}$ -butenolidu w postaci soli sodowej. Do tego roztworu dodaje się 150 części wagowych dwumetyloaminofenylo-dwumetylopirazolonu, który całkowicie przechodzi do roztworu. PH roztworu wynosi 7,1.

Zastrzeżenie patentowe

Sposób wytwarzania roztworu organicznych środków leczniczych, zwłaszcza amidopiryny, znamienny tym, że jako rozpuszczalnik tych środków stosuje się wodne roztwory α, β -dwupodstawionych $\Delta^{\alpha, \beta}$ -butenolidów, w których jeden podstawnik jest zdolny do tworzenia soli, zaś drugi podstawnik stanowi dowolną resztę alkilową, arylową lub aryloalkilową, na przykład α -n-butylo- β -hydroksy- $\Delta^{\alpha, \beta}$ -butenolid albo α -benzylo- β -hydroksy- $\Delta^{\alpha, \beta}$ -butenolid.

VEB Farbenfabrik Wolfen

Zastępca: Dr Andrzej Au
rzecznik patentowy