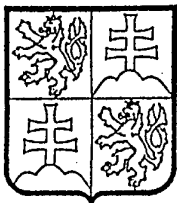


ČESKÁ A SLOVENSKÁ
FEDERATIVNÍ
REPUBLIKA
(19)



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

PATENTOVÝ SPIS

(11) Číslo dokumentu :

276 790

(21) Číslo přihlášky : 1478-90.A

(22) Přihlášeno : 27 03 90

(30) Prioritní data :

(40) Zveřejněno : 15 10 91

(47) Uděleno : 24 06 92

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku : 12 08 92

(13) Druh dokumentu : B6

(51) Int. Cl.⁵ :

A 61 K 31/557

//C 07 C 405/00

(A 61 K 31/557

A 61 K 31:055)

(73) Majitel patentu : LÉČIVA s. p., PRAHA

(72) Původce vynálezu : MRVOVÁ ZDENKA ing., DRNCOVÁ EVA ing.,
KUBELKA VLADISLAV RNDr. CSc.,
PALEČEK JAROSLAV doc. ing. CSc., PRAHA

(54) Název vynálezu : Injekční léková forma na bázi luteolyticky účinného
analogu prostaglandinu F2 alfa

(57) Anotace :

Řešení se týká injekční lékové formy pro veterinární použití, která obsahuje jako účinnou látku 100 až 300 µg opticky aktivního d-isomeru 16-3-chlorfenoxy-9α, 11α, 15-trihydroxy-17,18,19,20-tetranor-5-cis-13-trans prostadienové kyseliny (generický název cloprostenol), v acetátovém pufru s hodnotou pH 5,5 až 6,5 a 0,5 až 2,5 mg alkylchlorfenolu a vodu pro injekce do celkového objemu 2 ml. Injekční léková forma se užívá při synchronizaci hospodářských zvířat, indukci porodů u prasnic a léčení řady patologických stavů pohlavních orgánů u skotu.

Následující příklady provedení injekční formu podle vynálezu pouze dokládají, ale neomezuji.

Příklad 1

d-cloprostenol	7,5 g
kyselina octová	60,05 g
octan sodný	1 558,95 g
2-chlor-5-methyl-fenol	100,0 g
voda pro injekce	ad 100,0 l

Asi v 90 l vody pro injekce se rozpustí 2-chlor-5-methyl-fenol, octan sodný a kyselina octová. Úprava pH se provádí roztokem octanu sodného nebo kyselinou octovou, v rozmezí pH 5,5 až 6,5, s výhodou 5,9 až 6,1. Vodou pro injekce se doplní na požadovaný objem, tj. 100 l. Odebere se část tohoto roztoku (pufru) a ve zbylém objemu pufru se rozpustí účinná látka a doplní se na požadovaný objem pufru. Roztok se sterilizuje filtrací membránovým filtrem o velikosti pórů 0,2 μ a za aseptických podmínek se plní do ampulí nebo do lahviček.

Takto připravené injekce skladované při teplotě 10 až 25 °C chráněné před světlem mají použitelnost minimálně 2 roky.

Příklad 2

d-cloprostenol	5,0 g
kyselina octová	60,05 g
octan sodný	1 558,95 g
2-chlor-5-methyl-fenol	125,0 g
voda pro injekce	ad 100,0 l

Injekce připravené stejným způsobem jako je uvedeno v příkladu 1 a skladované při teplotě 10 až 25 °C, chráněné před světlem mají použitelnost minimálně 2 roky.

Příklad 3

d-cloprostenol	5,0 g
kyselina octová	60,05 g
octan sodný	1 558,95 g
2-chlor-5-methyl-fenol	25,0 g
voda pro injekce	ad 100,0 l

Injekce připravené stejným způsobem jako je uvedeno v příkladu 1 a skladované při teplotě 10 až 25 °C, chráněné před světlem mají použitelnost minimálně 2 roky.

Příklad 4

d-cloprostenol	15,0 g
kyselina octová	60,05 g
octan sodný	1 558,95 g
2-chlor-5-methyl-fenol	125,0 g
voda pro injekce	ad 100,0 l

Injekce připravené stejným způsobem jako je uvedeno v příkladu 1 a skladované při teplotě 10 až 25 °C, chráněné před světlem mají použitelnost minimálně 2 roky.

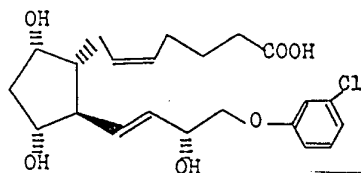
Příklad 5

d-cloprostenol	15,0 g
kyselina octová	60,05 g
octan sodný	1 558,95 g
2-chlor-5-methyl-fenol	25,0 g
voda pro injekce	ad 100,0 l

Injekce připravené stejným způsobem jako je uvedeno v příkladu 1 a skladované při teplotě 10 až 25 °C, chráněné před světlem mají použitelnost minimálně 2 roky.

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. Injekční léčivá forma na bázi luteolyticky účinného analogu prostaglandinu F_2 alfa, vyznačující se tím, že obsahuje 100 až 300 μg opticky aktivního d-isomeru 16-/3-chlorfenoxy-/9 α , 11 α , 15-trihydroxy-17,18,19,20-tetranor-5-cis-13-transprostadienové kyseliny (generický název cloprostenol) vzorce Ia



Ia

v acetátovém pufru s hodnotou pH 5,5 až 6,5 a 0,50 až 2,50 mg alkylchlorfenolu a vodu pro injekce do celkového objemu 2 ml.

2. Injekční léčivá forma podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje 125 až 175 μg opticky aktivního d-isomeru cloprostenolu vzorce I ve 2 ml injekčního roztoku.
3. Injekční léčivá forma podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako konzervační činidlo alkylchlorfenol obsahuje 2-chlor-5-methyl-fenol v množství 0,5 až 2,5 mg ve 2 ml injekčního roztoku.