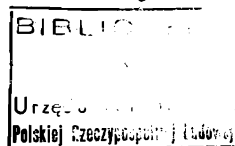


A61K 27/10



POLSKIEJ RZECZYPOSPOLITEJ LUDOWEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 44747

Kl. 30 h, 2/30

VEB Farbenfabrik Wolfen*)

Wolfen, Niemiecka Republika Demokratyczna

Sposób wytwarzania wstrzykiwanych dożylnie kombinowanych preparatów do zwalczania endopasożytów u zwierząt ssących

Patent trwa od dnia 5 sierpnia 1959 r.

Pierwszeństwo: 28 maja 1959 r. (Niemiecka Republika Demokratyczna).

Znane jest stosowanie organicznych estrów kwasu fosfonowego i (lub) fosforowego do zwalczania endopasożytów u zwierząt ssących. Należy do tego na przykład zwalczanie pasożytów gza, które umieszczają się pod skórą u krów. Prócz tego jak wiadomo, estry te przez rozpuszczenie w alkoholach, szczególnie wielowartościowych alkoholach, jak również ich estrach, które nie wywierają działania toksycznego na organizm zwierząt ciepłokrwistych mogą być stosowane podskórnie. Wstrzykiwania podskórne mogą jednak wywoływać opuchnięcia tkanki w miejscu wstrzyknięcia, jak również wywoływać inne przykre objawy, jak niepokój poddawanych zabiegom zwierząt itd. Przy stosowaniu podskórnym wymagane są znacznie wyższe dawki substancji biologicznie czynnej, niż przy wstrzykiwaniach dożylnych.

*) Właściciel patentu oświadczył, że współtwórcami wynalazku są dr Möhring, dr Wolf, prof. dr Profft, Lothar Zölch i Alfred Schubert.

Wstrzykiwań dożylnych wspomnianych roztworów estrów kwasu fosforowego lub fosfonowego nie można było jednak wprowadzać, ponieważ na podstawie przeprowadzonych doświadczeń stwierdzono tutaj jeszcze większą szkodliwość dla zwierząt, niż należało tego oczekiwać dotychczas. Również przez dodatek substancji o działaniu parasympatykolitycznym takiej jak atropina, można było te preparaty pod względem znanego działania jedynie nieznacznie polepszyć.

Stwierdzono, że kombinowane preparaty do wstrzykiwań dożylnych na bazie organicznych związków estrów kwasu fosfonowego i (lub) fosforowego i substancji o działaniu wagolitycznym stosowane do zwalczania endopasożytów u zwierząt ssących nie wywołują żadnych działań ubocznych, gdy do kombinacji obydwu związków dodaje się oksymów reaktywujących cholinoesterazę.

Do tych oksymów należy przede wszystkim oksym jodometylanu aldehydu pirydynowego,

jak również jego pochodne, na przykład dwuoksym dwubromku 1, 3-trójmetyleno-bis-(4-formylopirydynowego). Jako oksymy mogą być również używane oksym acetonu, jednooksym dwuacetylu i oksym furfuralu.

Przyswajalność preparatów kombinowanych otrzymanych sposobem według wynalazku wzrasta u zwierząt ssących dwukrotnie w stosunku do preparatów wspomnianych na wstępie. Dzięki temu można również wstrzykiwać preparaty dożylnie. Z drugiej strony na skutek korzystniejszej postaci aplikowania, dawkowanie może być zmniejszone bez uszczerbku działania owadobójczego. Dalsza korzyść z preparatów kombinowanych polega na tym, że są one same w sobie sterylne i dlatego nie wymagają sterylizacji.

Kombinowane stosowanie wyżej wspomnianych produktów stanowi zaprzeczenie dotychczasowego poglądu na działanie estrów kwasu fosfonowego ewentualnie fosforowego, według którego związki te powinny hamować działanie cholinoesterazy. Przez dodatek zgodnie z wynalazkiem, na przykład oksymu jodometylanu aldehydu pirydynowego, usuwa się jednak toksyczne działanie dla zwierząt ssących, a działa się jedynie na pasożyty, które mają być zabite.

Zamiast preparatu kombinowanego, który zawiera wyżej wspomniane substancje, można również zastosować kombinację dwóch preparatów, z których jeden zawiera organiczny związek fosforowy, a drugi atropinę i reaktory cholinoesterazy.

Przykład I. 0,5 g siarczanu atropiny, 5 g oksymu jodometylanu aldehydu pirydynowego i 500 g estru dwumetylowego kwasu β, β, β -trójchloro- α -oksyetylofosfonowego rozpuszcza się w 690 g glikolu polietylenowego w tempera-

turze 40–50°C i przesącza. Roztwór zlewa się do butelki i poddaje się sterylizacji. W ten sposób 1 litr roztworu zawiera 50% obj. estru kwasu fosfonowego, 0,5% obj. oksymu i 0,04% obj. siarczanu atropiny.

Przykład II. Odpowiednio do przykładu I 0,4 g siarczanu atropiny, 2 g oksymu dwubromku 1, 3-trójmetyleno-bis-(4-formylopirydynowego) i 500 g estru dwumetylowego kwasu β, β, β -trójchloro- α -oksyetylofosfonowego rozpuszcza się w 690 g poliglikolu i przesącza. Otrzymuje się 1 litr roztworu.

Przykład III. 0,4 g siarczanu atropiny, 2 g dwuoksymu dwubromku 1, 3-trójmetyleno-bis-(4-formylopirydynowego) i 500 g trójchlorofenylo-(2, 4, 5)-dwumetylo-tiofosforanu rozpuszcza się jak w przykładzie I i poddaje dalszej obróbce.

Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób wytwarzania wstrzykiwanych dożylnie kombinowanych preparatów do zwalczania endopasożytów u zwierząt ssących na podstawie organicznych estrów kwasu fosfonowego i (lub) fosforowego i wagolityku takiego, jak atropina, znamieny tym, że do kombinacji tych dwóch związków dodaje się oksymów reaktywujących cholinoesterazę.
2. Sposób według zastrz. 1, znamieny tym, że jako oksym stosuje się oksym jodometylanu aldehydu pirydynowego, lub jego pochodną.

VEB Farbenfabrik Wolfen

Zastępca: dr Andrzej Au.
rzecznik patentowy

