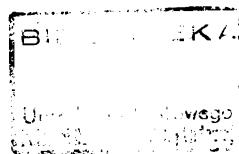


Warszawa, 15 września 1933 r.

2

URZĄD PATENTOWY



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIS PATENTOWY

Nr 18321.

Kl. 30 h, 2.

F. Hoffmann-La Roche & Co. Aktiengesellschaft
(Bazylea, Szwajcaria).

Sposób otrzymywania trwałych wodnych roztworów środków leczniczych.

Zgłoszono 1 lipca 1932 r.

Udzielono 24 kwietnia 1933 r.

Pierwszeństwo: 7 grudnia 1931 r. (Niemcy).

Stwierdzono, że przez zastosowanie pirydonów i piperydonów jako środków pośredniczących przy rozpuszczaniu, można trudnorozpuszczalne w wodzie środki lecznicze, jak alkaloidy, pochodne kwasu barbiturowego, kamforę i podobne związki przeprowadzić w stan trwałego roztworu wodnego.

Pirydony i piperydony nadają się również jako rozpuszczalniki dla tych środków leczniczych, ponieważ mogą być wstrzykiwane w stanie nierozcieńczonym, Tak można np. kamforę lub kwas barbiturowy rozpuszczać z łatwością w płynnych pirydonach względnie piperydonach. Celowo dobiera się stężenie tych roztworów tak, ażeby środki lecznicze nie wydzielały się przy rozcieńczeniu wodą.

W patencie niemieckim Nr 447161 opisany jest sposób sporządzania roztworów środków usypiających, który polega na tem, że się stosuje jako rozpuszczalniki estry lub etery wielowartościowych alkoholi. Jeżeli 10%-owy roztwór kwasu alyloizopropylbarbiturowego w eterze glicerynodwuetylowym, sporządzony według przykładu III-go, rozcieńcza się wodą, to wydziela się szybko środek usypiający. Przy stosowaniu tego samego sposobu do 10%-owego roztworu kwasu alkyloizopropylbarbiturowego w 1-metylo-2-piperydonie pozostaje roztwór ten po rozcieńczeniu wodą przezroczysty.

Opisane również w patencie niemieckim Nr 446290 roztwory kamfory nie mieszają się z wodą wbrew wskazówkom podanym

w opisie, 1%-owy roztwór kamfory w eterze dwuetylowym mętnieje po rozcieńczeniu wodą. Natomiast według wynalazku można 2%-owy roztwór kamfory w 1-metylo-2-piperydonie dowolnie wodą rozcieńczyć; roztwór pozostaje klarowny.

Pirydony lub piperydony mogą również być stosowane w mieszaninie z sobą lub z innymi środkami pośredniczącymi przy rozpuszczaniu.

Przykład I. Roztwór z 15-tu części chlorowodoru emetyny (D. A. B. 6) w 100 częściach 10%-owego 1-metylo-2-piperydonu pozostaje nawet po zaszczipieniu klarowny przy 0°C. Natomiast wydzielają się kryształki przy 0°C z 6%-owego roztworu chlorowodoru emetyny w wodzie.

Przykład II. 3 cz. wag. teofiliny rozpuszcza się w 100 cz. wag. 40%-owego wodnego roztworu 1-oksyetylo-2-pirydonu. Roztwór może być dalej rozcieńczony wodą, przyczem nie następuje wydzielanie się substancji.

Przykład III. 2,5 cz. wag. kamfory rozpuszcza się w 100 cz. wag. 1-metylo-2-piperydonu. Roztwór może być rozcieńczony wodą, przyczem nie następuje wydzielanie się substancji. Stężone roztwory kamfory

można otrzymać aż do 50%-owych roztworów; mieszają się z wodą nie w każdym stosunku.

Przykład IV. 10%-owy roztwór kwasu alyloizopropylobarbiturowego w 1-metylo-2-piperydonie daje się dowolnie wodą rozcieńczyć, przyczem nie następuje wydzielanie się substancji.

Przykład V. Roztwór 40 cz. 1-fenyl-2,3-dwumetylo-4-dwumetyloamino-5-pyrazolonu w 100 cz. 1-metylo-2-piperydonu można dowolnie rozcieńczać wodą, przyczem roztwór pozostaje klarowny.

Zastrzeżenie patentowe.

Sposób otrzymywania trwałych wodnych roztworów środków leczniczych, znamieny tem, że jako środki rozpuszczające lub pośredniczące przy rozpuszczaniu środków leczniczych stosuje się trudno-rozpuszczalne w wodzie pirydony lub piperydony.

F. Hoffmann - La Roche & Co.

Aktiengesellschaft.

Zastępca: Inż. Cz. Raczyński,
rzecznik patentowy.