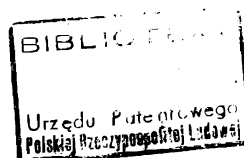


4 lutego 1928 r.

A64K 2R/14

URZĄD PATENTOWY



RZECZYPOSPOLITEJ POLSKIEJ

OPIŚ PATENTOWY

Nr 8121.

Kl. 30 h 3.

Chemische Fabrik auf Actien (vorm. E. Schering)
(Berlin, Niemcy).

Sposób otrzymywania środka przeciw chorobie morskiej.

Zgłoszono 14 lutego 1927 r.

Udzielono 6 grudnia 1927 r.

Pierwszeństwo: 26 lutego 1926 r. (Niemcy).

Według badań Eppinger'a i Hessa, odnoszących się do symptomatów pojawiających się przy chorobie morskiej, choroba ta polega przede wszystkim na podrażnieniu nerwu „Nervus vagus”. Z tego powodu nie brakowało najrozmaitszych prób mających na celu usunięcie mdłości, lub też uśmierzanie tych ostatnich zapomocą alkaloidów, paraliżujących nerw „vagus”.

W ten sposób Fischer i Pribram starali się przeciwdziałać skutecznie chorobie morskiej, stosując zastrzyki atropinowe. Jednakowoż trujące działanie atropiny nie pozwala na zastosowanie wystarczającej dozy, w szczególności w wypadku dawek nawewnętrznych lub zastrzyków, gdyż wywołują one szkodliwe uboczne działania.

Skonstatowano, że przez skombinowanie atropiny ze skopolaminą lub lepiej jeszcze hyoscyaminy ze skopolaminą, otrzymuje się środek leczniczy, pozwalający na całkiem pewne zwalczenie choroby morskiej, bez widocznych działań ubocznych. Działanie uśmierzające atropiny względnie hyoscyaminy potęguje się na nerw „vagus” znacznie działaniem uśmierzającym skopolaminy na nerw „vagus”.

Jednocześnie zachodzi fakt znihilowania centralnego działania drażniącego, wywołanego przez atropinę i hyoscyaminę, zapomocą centralnego działania uśmierzającego, wywołanego przez skopolaminę.

Działania te wzajemnie się znoszą lub

co najmniej znacznie wzajemnie osłabiają. I tak okazało się, że nadaje się tu kombinacja złożona z 10 $\frac{1}{4}$ — 20 części atropiny, względnie hyoscyaminy oraz 1 części skopolaminy. Alkaloidy te miesza się celowo pod postacią ich soli organicznych lub nieorganicznych, względnie takichże soli podwójnych przy jednoczesnem zastosowaniu odpowiednio dobranych środków rozcieńczających.

Jeżeli chce się otrzymać alkaloidy pod postacią dających się prasować tabletek, stosuje się odpowiednie środki wiążące i rozcieńczające. Działanie takich kombinacji w obydwóch kierunkach, to jest zarówno w kierunku uśmierzania nerwu „vagus”, jak i w kierunku centralnego uśmierzania, może być wzmocnione, jeżeli na miejsce optycznie nieczynnych alkaloidów, atropiny i skopolaminy użyte zostaną ich odmiany lewoskrętne (1-hioscyamina i 1-skopolamina). Najlepsze wyniki zostały osiągnięte przy zestawieniu kamforonianu 1-hioscyaminy i kamforonianu 1-skopolaminy, gdyż kwas kamforowy oraz jego pochodne, jak np. kwas bromo-kamforowy, wzmagają jeszcze bardziej działanie uśmierzające wymienionych alkaloidów na nerw „vagus”.

Na skutek zastosowania podobnego rodzaju zestawień osiąga się znaczne obniżenie nieprzyjemnych działań ubocznych niektórych składników wchodzących w skład wymienionych środków leczniczych. Dlatego też staje się możliwem stosowanie dostatecznie dużych dóz dla skutecznego przeciwdziałania objawom choroby morskiej oraz przyjmowanie nawewnątrz, tak jak i pod postacią zastrzyków odpowiednich zestawień tych środków. Środki te nadają się nie tylko przy zwalczaniu objawów mdłości, występujących w rozmaitych postaciach jak choroba morska, choroba kolejowa, nadają się też one w wypadkach wymiotów podczas ciąży, przy migrenach z wymiotami i tym podobnych.

Przykład I. 23,4 g siarczanu atropiny miesza się z 1,45 g bromo-wodorku skopolaminy, rozcieńcza 4000 g bromku kamforowego i dopełnia do 5000 g dodając środków rozcieńczających i wiążących. Z otrzymanej masy można otrzymać 10,000 tabletek po 0,5 g zawierających każda po 2 mg atropiny oraz po 0,1 mg skopolaminy.

Przykład II. 16,9 g kamforonianu 1-hioscyaminy, 1,66 g kamforonianu skopolaminy oraz 4000 g kwasu kamforowego, miesza się, dopełniając do 5000 g środkami rozcieńczającymi i wiążącymi.

Przykład III. 15,2 g kamforonianu 1-hioscyaminy, 2,62 g kamforonianu 1-hioscyamino - skopolaminy miesza się z 4000 g kwasu bromo - kamforowego i wreszcie dopełnia do 5000 g dodając środków wiążących. Można przygotować z tej mieszaniny 10,000 tabletek po 0,5 g zawierających każda po 1 mg 1-hioscyaminy i 0,1 mg 1-skopolaminy.

Przykład IV. 23,65 g kamforonianu 1-hioscyaminy, 2,45 g winianu hioscyamino-skopolaminowego miesza się z 4000 g kwasu kamforowego i dopełnia do 5000 g.

Przykład V. 1,69 g kamforonianu 1-hioscyaminy oraz 0,166 g kamforonianu 1-skopolaminy rozpuszcza się w 1000 g wody; 20 kropli takiego roztworu odpowiada 1 mg hioscyaminy i 0,1 mg skopolaminy.

Zastrzeżenia patentowe.

1. Sposób wytwarzania środków przeciw chorobie morskiej, znamienny tem, że kombinuje się hioscyaminę ze skopolaminą.
2. Sposób według zastrz. 1, znamienny tem, że używa się odmian lewoskrętnych tych alkaloidów.
3. Sposób według zastrz. 1 i 2, znamienny tem, że używa się alkaloidów pod postacią ich soli, względnie soli podwójnych.

4. Wykonanie sposobu według zastrz. 1 — 3, znamienne tem, że stosuje się połączenie kamforonianu 1-hioscyaminy z kamforonianem 1-skopolaminy.

5. Sposób według zastrz. 1 — 4, znamieny tem, że zestawienia dokonywuje się mniej więcej w stosunku 1 części skopolaminy na 10 — 20 części atropiny, względnie hioscyaminy.

6. Sposób według zastrz. 1 — 5, znamieny tem, że do zestawionych związków

dodaje się odpowiednich środków rozcieńczających stężających lub wiążących, i otrzymaną masę stosuje się w skompresowanej postaci.

Chemische Fabrik
auf Aktien
(vorm. E. Schering).
Zastępca: Inż. Cz. Raczyński,
rzecznik patentowy.