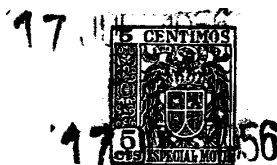


229861

P.- 14.862.

"V 147 Eye-drops"

229861



MEMORIA DESCRIPTIVA

para solicitar

P A T E N T E D E I N V E N C I O N

en

E S P A Ñ A

por VEINTE años

a nombre de BOOTS PURE DRUG COMPANY LIMITED, entidad británica, establecida en Station Street, Nottingham, Inglaterra, por:

"UN METODO PARA LA PRODUCCION DE UNA COMPOSICION PARA COLIRIOS  
ACUOSA, ESTABLE"

-----

Esta invención se refiere a un método para la producción de nuevas composiciones que resultan ser valiosas en el tratamiento de ciertas infecciones bacterianas que se presentan en medicina clínica.

5 La invención consiste en la producción de nuevas composiciones que son apropiadas para uso en la medicación de los ojos y que contienen una sal soluble en el agua de la p-sulfamidobenzamidina como ingrediente activo en un vehículo acuoso que contiene un agente espesante. Se ha visto que estas composiciones son valiosas en el tratamiento de una amplia gama de infecciones bacterianas de los ojos.

10



1956

**229 86 1**

Se ha encontrado que disolviendo una sal acuoso-soluble de la p-sulfamidobenzamidina en un vehículo acuoso que contenga un agente espesante y un agente tal como glicerina que se emplea para ajustar el tono de la solución, se produce una composición que es compatible con las secreciones naturales del ojo humano y que, por lo tanto, se puede usar como colirio, (gotas para los ojos).

Preferiblemente, el vehículo acuoso contiene también un agente bacteriostático.

Como agente espesante es preferible usar metilcelulosa o un derivado de ella en una concentración que se controla por la viscosidad particular requerida en la solución final, pero que, preferiblemente, es del orden de 0,5 por ciento peso/volumen. Por el uso de tales agentes espesantes además de la cantidad requerida de un agente tal como glicerina que se emplea para ajustar el tono de la solución, se producen composiciones que son compatibles con las secreciones naturales de los ojos, es decir, soluciones que al introducir las en el ojo no estimulan un aumento de la secreción natural. Esto es importante puesto que tal estimulación serviría para quitar la solución terapéutica, en forma de lágrimas, del ojo, por dilución y expulsión.

Los agentes bacteriostáticos que se emplean en las composiciones para colirios de la invención pueden ser cualquiera de los que se pueden emplear con seguridad en contacto con el ojo humano y que son compatibles con los agentes espesantes del tipo de la metilcelulosa y que son conocidos

17 56  
229861



5 en el arte. Sin embargo, nosotros preferimos usar un agente bacteriostático del tipo del amonio cuaternario, por ejemplo "Cetrimide, B.P." (mezcla de bromuros de alquil-amonio, preparada condensando bromuro de cetilo técnico con trimetilamina).

10 De acuerdo con esto, la presente invención comprende un método para la producción de una composición de colirio acuosa estable que consiste en disolver una sal soluble en el agua de p-sulfamidobenzamidina en un vehículo acuoso que contenga un agente espesante y un agente tal como glicerina para ajustar el tono de la solución. Preferiblemente, el vehículo acuoso contiene también un agente bacteriostático.

15 El pH de las composiciones para colirios de la invención es de particular importancia tanto desde el punto de vista de la posibilidad de irritación y otros efectos dañinos al ponerse en contacto con los ojos, como del de la estabilidad de las soluciones. Así, pues, hemos encontrado que en cuanto a la estabilidad el pH de las composiciones para colirios no debe ser mayor de 7,0 y preferiblemente debe ser menor de 7,0.

20 Si es necesario se puede añadir un ácido débil tal como el ácido bórico a la composición para regular el pH. El límite inferior de pH de las soluciones viene dictado por la consideración del posible efecto de las soluciones sobre el ojo humano. Así, se ha visto que las composiciones preparadas de acuerdo con la invención que tienen un pH tan bajo como de 25 4,0 se pueden emplear en una medicación sin ocasionar efectos perjudiciales en el ojo humano.



229 86 1

Las sales de la p-sulfamidobenzamidina que se pueden emplear en las composiciones de la invención son sales solubles en el agua formadas empleando por ejemplo ácidos minerales o ácidos alifáticos inferiores e incluyen el clorhidrato. La concentración de ingrediente activo que se puede emplear en las composiciones de la invención pueden variar de acuerdo con la medicación particular que se precise. Así, se ha encontrado conveniente emplear soluciones que contienen del orden de 5 % peso/volumen de ingrediente activo si bien el límite superior de concentración de ingrediente activo que se puede emplear está limitado únicamente por la solubilidad de la sal empleada.

Los siguientes ejemplos no limitativos ilustran las composiciones de la invención:

Ejemplo 1

Una solución apropiada para uso en forma de colirio se prepara a base de los ingredientes siguientes:

Clorhidrato de p-sulfamidobnezamidina:	5,0 partes en peso.
Glicerina B.P. (British Pharmacopaea)	1,5 " " volumen.
Metil-celulosa	0,5 " " peso.
"Cetrimide B.P."	0,01 " " "
Agua destilada hasta hacer	100 " " volumen.

Ejemplo 2.

Se prepara una solución apropiada para uso en forma de colirio que contiene los siguientes ingredientes:

Clorhidrato de p-sulfamidobenzamidina:	5,0 partes en peso.
Glicerina B.P.	1,5 partes en volumen
Acido bórico B.P.	0,5 partes en peso.
Metil-celulosa	0,5 partes en peso
"Cetrimide B.P."	0,01 partes en peso
Agua destilada hasta hacer	100 partes en peso.



229 861

Esta solicitud que corresponde a la presentada en Gran Bretaña el 19 de junio de 1.955, bajo el número 20907/55 se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto-Ley sobre Propiedad Industrial.

5

- N O T A -

Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta Patente de Invención en España por VEINTE años son los siguientes:

10 1. Un método para la producción de una composición para colirios acuosa, estable, que consiste en disolver una sal soluble en el agua de la p-sulfamidobenzamidina en un vehículo acuoso caracterizado porque el vehículo acuoso contiene un agente espesante y un agente para ajustar el tono de la solución.

15 2. Un método tal como se reivindica en la reivindicación 1, caracterizado porque la composición así producida tiene un valor del pH comprendido entre 4 y 7.

20 3. Un método tal como se reivindica en las reivindicaciones 1 ó 2, caracterizado porque el agente usado para ajustar el tono de la solución es glicerina.

4. Un método tal como se reivindica en la reivindicación 1, 2 ó 3, caracterizado porque se usa metil-celulosa o un derivado de ella como agente espesante en una concentración de 0,5 por ciento, peso/volumen.



229861

5. Un método tal como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones precedentes en el que la sal de la p-sulfamidobenzamidina usada en el clorhidrato (hidrocloruro).

5

6. Un método tal como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones precedentes caracterizado porque el vehículo acuoso contiene también un agente bacteriostático.

10

7. Un método tal como se reivindica en la reivindicación 6, caracterizado porque el agente bacteriostático usado es una mezcla de bromuros de alcohol-amonio, preparada condensando bromuro de cetilo con trimetilamina.

8. Un método tal como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones precedentes, caracterizado porque el vehículo acuoso contiene también un ácido débil.

15

9. Un método tal como se reivindica en la reivindicación 8, caracterizado porque el ácido usado es el ácido bórico.

10. Un método para la producción de una composición para colirios acuosa, estable, sustancialmente tal como se describe aquí.

20

11. Un método para la producción de una composición para colirios acuosa, estable.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y para los fines que se han especificado.

25

Esta Memoria consta de seis hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 17 JUL. 1956

P.A.  
Alberto de Elizaburu  
Per Podes