

AÑO

236901
Expediente núm.



REGISTRO DE LA PROPIEDAD INDUSTRIAL

236901

PATENTE DE

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se acompaña a la solicitud de

una **PATENTE DE** Invención por 20 años, en España

a favor de

..... Colirios llorens, de nacionalidad
española domiciliado en Barcelona

calle de Urgel núm. 2

por:

PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE UN COLIRIO A BASE DEL ACETATO

9- α -FLUORHIDROCORTISONA Y NEOMICINA

Nº 2470

Agente Sr. Agudo



236901

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

a favor de

COLIRIOS LLORENS, S.A., de nacionalidad española, residente en
Barcelona, por:

"PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE UN COLIRIO A BASE DEL ACETATO
9- α -FLUORHIDROCORTISONA Y NEOMICINA".

Memoria descriptiva

Esta preparación farmacéutica de indicación en oftalmología
asocia, básicamente, la neomicina, a la que son muy sensibles cier-
tos microorganismos, tales como los Gram-negativos, y el Acetato
9- α -fluorhidrocortisona, de gran potencia, que lo hace imprescin-
dible en el arsenal del oftalmólogo.

La composición completa del colirio es la siguiente: Acetato 9-
 α -fluorhidrocortisona, 1 mgr.; Neomicina, 10 mgr., Polioxietilen
sorbitán mono-oleato, 0'2 c.c.; Suero isotónico, c.s. para 1 c.c.

236901



10 El problema a resolver para llegar a la formula final declarada era el de la disolución de los esteroides. El procedimiento de disolución utilizado ha permitido resolver el problema que hasta ahora se había presentado y que habia impedido la obtención de composiciones de utilización en oftalmología.

15 La preparación de estos compuestos por todos los laboratorios en general, ha sido a base de suspensiones (sólido en líquido) o pomadas.

20 Las suspensiones, a pesar de poder contar hoy día, con muchos adelantos, tanto en aparatos como en técnicas, sabemos que sus partículas no pueden llegar a ser tan pequeñas, que igualen a las disoluciones, y por lo tanto, pasen por los filtros corrientes. Esto tiene el inconveniente en oftalmología de que los cristales irritan a los tejidos extremadamente delicados del ojo.

25 Otro tanto debemos decir, con respecto a las pomadas, pues aunque se utilicen también técnicas muy avanzadas en su fabricación no dejan de resultar sus cristales algo más grandes en general, que las suspensiones. Esto agrava aún más, el inconveniente antes citado para las suspensiones, pues al resultar los cristales mayores, irritan aún más los tejidos oculares.

30 Por todos estos inconvenientes, y para ver la manera de subsanarlos, es por lo que nos hemos dedicado a la investigación, para poder encontrar algún procedimiento de obtener su disolución, sin menoscabo de su potencia.

35 Después de numeros ensayos y probaturas, con infinidad de substancias disolventes organicas, llegamos a la conclusión de que el Tween 80 (polioxietilen sorbitan monooleato) era el más adecuado a nuestros fines. Es un líquido soluble en todas proporciones con

236901



el agua, no se necesitan cantidades exageradas para la disolución, es hemectante, ayudando pues con esta cualidad a su más rápida difusión a través de los tejidos, no es irritante, y se puede esterilizar.

El procedimiento para la fabricación del colirio citado, consiste en la disolución de las sustancias, en el Tween y subsiguientemente mezcla con suero isotónico y demás ingredientes.

Se pesa la cantidad suficiente de Acetato 9- α -FLUORHIDROCORTISONA, y se tritura lo más finamente posible después de lo cual, se pasa por un tamiz de malla finísima. Se pesa también la cantidad necesaria de NEOMICINA (o su equivalente a sulfato de neomicina) el cual también se tritura y tamiza. Se mide la quinta parte del volumen total, que será la necesaria de Tween 80. Se echan las sustancias sobre éste y se agita continuamente, en caliente, procurando que la temperatura no exceda de unos 150° C. Una vez disueltas se dejan enfriar, hasta unos 50° C. Mientras se enfría se hace la disolución del cloruro sódico con agua bidestilada exenta de pirógenos, añadiéndole un c.c. de cloruro de benzalconio 1:10.000 por cada cien c.c. de volumen total. Teniendo ya las dos disoluciones a 50° C. se echa el Tween sobre el agua, agitando hasta que se han mezclado completamente. Se deja enfriar y se esteriliza.

REIVINDICACIONES

1). Procedimiento de preparación de un colirio a base del acetato 9- α -fluorhidrocortisona y neomicina, caracterizado por obtenerse la disolución del acetato 9- α -fluorhidrocortisona y la neomicina con Tween 80 (polioxietilen sorbitan monooleato).

236901



65 2). Procedimiento según la reivindicación anterior, caracterizado por hacerse la disolución del suero con agua bidestilada exenta de pirógenos con adición de cloruro de benzalconio al 1 : 10000 dando como fórmula cualitativa la de: acetato 9- α -fluorhidrocortisona, neomicina, polioxietilen sorbitan monooleato, y suero isotónico.

70 3). Procedimiento según las reivindicaciones anteriores, caracterizado por triturarse el acetato 9- α -fluorhidrocortisona y la neomicina lo más finamente posible en un mortero, después de lo cual se tamizan por una tela finísima. Se echan las sustancias por separado, primero el acetato 9- α -fluorhidrocortisona y después
75 la neomicina, agitando continuamente y se calienta procurando que la temperatura no exceda de 150° C. Una vez disueltas se deja enfriar hasta unos 50° C.

80 4). Procedimiento según las reivindicaciones anteriores, caracterizado por dar un compuesto con la siguiente composición: Acetato de 9- α -Fluorhidrocortisona, 1 mgr.; Neomicina, 10 mgr.; Polioxietilen sorbitán mono-oleato, 0'2 c.c.; Suero isotónico, c.s. para 1 c.c.

85 5). PROCEDIMIENTO DE PREPARACION DE UN COLIRIO A BASE DEL ACETATO 9- α FLUORHIDROCORTISONA Y NEOMICINA.

Esta Memoria consta de cuatro hojas foliadas y mecanografiadas por un solo lado de sus caras.

Madrid, a 15 de Marzo de 1.958

baulera