

26 D



303658

~~302278~~

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

a favor de:

INDUSTRIAL FARMACEUTICA CANTABRIA, S.A., de nacionalidad española residente en Santander, C/ del Monte nº 30 y 32 por:
"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE CANFOSULFONATO DE PREDNISOLONA".

- - - - -

Memoria descriptiva

Esta invención se refiere a la obtención de un nuevo compuesto orgánico, el CANFOSULFONATO de PREDNISOLONA, que es un polvo de color blanco, punto de fusión 215°C., insoluble en agua fría, éter, cloroformo, glicerina, ácidos y álcalis, poco soluble en agua hirviendo, muy soluble en alcohol etílico, alcohol metílico y acetona.

Los estudios clínicos de este producto nuevo han sido efectuados en la Clínica del 18 de Julio de la provincia de Santander bajo la dirección del Dr. Garcia Mata.

En estos estudios se han tratado 14 enfermos, siete de los cuales fueron los sometidos a medicaciones con productos cuyas propiedades farmacológicas eran similares al Canfosulfonato de Prednisolona; los otros siete fueron sometidos a tratamiento con



303658

el Canfosulfonato de Prednisolona.

15 Los enfermos presentaban características similares en cuanto al sexo y edad así como a las características de su síndrome.

Las enfermedades que padecían estos enfermos eran las siguientes:

- Artritis reumatoide 6
- Asma bronquial 4
- 20 Fibrosis pulmonar-enfisema . . 4

Se hicieron dos lotes:

El primero, que fué tratado con productos cuyas propiedades farmacológicas eran similares al Canfosulfonato de Prednisolona, estaba formado por unos enfermos que eran portadores de los siguientes procesos:

- 25 Artritis reumatoide 3
- Asma bronquial 2
- Fibrosis pulmonar-enfisema . . 2

30 El segundo fué tratado con el preparado objeto del ensayo, el Canfosulfonato de Prednisolona y estaba formado por unos enfermos que eran portadores de los siguientes procesos:

- Artritis reumatoide 3
- Asma bronquial 2
- Fibrosis pulmonar-enfisema . . 2

35 El estudio clínico de los resultados obtenidos es el siguiente:

En los enfermos del lote segundo, es decir, los tratados con el preparado objeto del ensayo, de Canfosulfonato de Prednisolona, se obtuvieron:

- a) Una mas rápida respuesta terapéutica.
- 40 b) El efecto antiinflamatorio fué mas acusado.
- c) Una importante mejoría de las diversas condiciones ventilatorias.
- d) Sensación de euforia y mejoría del siquismo.



303658

A la vista de los resultados obtenidos fueron reducidas las dosis y espaciadas las tomas considerablemente, comprobándose reiteradamente la persistencia de los efectos indicados.

Asimismo en ninguno de los enfermos del lote segundo, es decir, los tratados con el preparado objeto del ensayo, de Canfosulfonato de Prednisolona, fueron observados efectos secundarios característicos de los corticoesteroides; asimismo se comprobó que en dichos enfermos no hubo retención salina, ni pérdida de potasio, por lo que en todos los casos ensayados no hubo restricción de sodio, y por ello no hubo necesidad de añadir potasio a la dieta.

Por todo lo anteriormente expresado, el Canfosulfonato de Prednisolona tanto desde el punto de vista químico como el efectuado clínicamente, ha quedado demostrado ser un producto totalmente nuevo en la terapéutica médica y puede afirmarse que cubre un campo en las enfermedades bronco pulmonares en las que hasta ahora los productos conocidos tenían una eficacia deficiente.

El procedimiento de obtención tiene como característica principal el hecho de combinar el anhidro de un ácido con un corticosteroide.

Su proceso es como sigue: Añádase a un gramo del ácido canfosulfónico aproximadamente 2 gramos de piridina obteniendo así una solución.

A esta solución así formada se le añade un gramo de 11 Beta 17 Alfa, 21-trihidroxi- 1,4 - pregnadieno-3,20 diona agítase, enfriese durante cuarenta horas y echarlo sobre agua helada durante un periodo aproximadamente de una hora.

Realizado lo anteriormente expuesto se le añade carbonato sódico en solución diluida, fíltrese. En el filtro nos queda una substancia a la cual se le añade agua hirviendo, déjese enfriar, así obtenemos un nuevo compuesto organico llamado canfolsulfonato de prednisolona.

26 D



REIVINDICACIONES

303658

75 1). Procedimiento de obtención de un nuevo compuesto orgánico caracterizado por mezclarse cantidades equimoleculares de prednisolona, anhídrido del ácido canfosulfónico que se disuelve en cantidades apropiadas de piridina mediante agitación.

2). Procedimiento según la reivindicación anterior caracterizada por su enfriamiento durante 40 horas que se añade sobre agua helada durante 1 hora.

80 3). Procedimiento según las reivindicaciones anteriores caracterizadas porque se añade carbonato sódico en solución diluida filtrándose y recristalizándose el producto.

4). "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE CANFOSULFONATO DE PREDNISOLONA".

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

Madrid, 1 de Septiembre de 1.964