



351,813

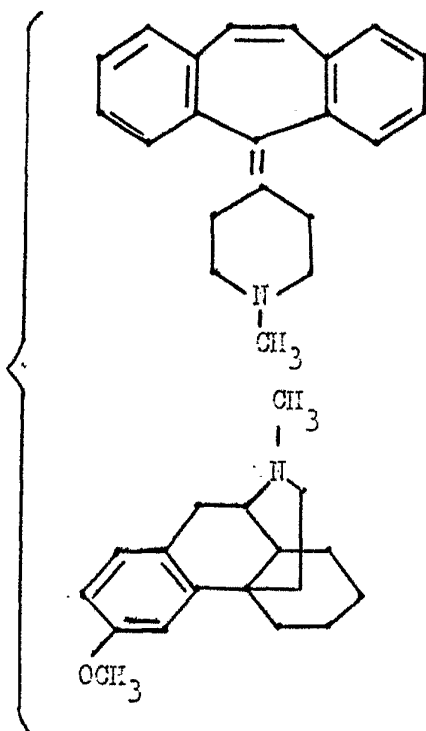
P A T E N T E
D E
I N V E N C I O N

por "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE DERIVADOS DE LA
PREDNISOLONA", a favor de la razón social española ANTONIO
GALLARDO, S.A., con domicilio en BARCELONA, calle Cardener,
nº 72-74.

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

La presente patente de invención trata de la prepara-
ción de sales entre la prednisolona hemisuccinato y las
siguientes bases orgánicas:





- Los derivados en cuestión poseen actividad antiinflamatoria y antihistamínica por lo cual pueden ser utilizados en terapéuticas broncopulmonares para inhibir la reacción alérgica y evitar la aparición de fibrosis peribronquiales, causa importante de recidiva o mantenimiento de las bronquitis crónicas.
- 5.

- Estas sales se han obtenido haciendo reaccionar, a una temperatura entre 45-55° C, en un disolvente orgánico apropiado, el ester hemisuccínico de la prednisolona con las bases antes citadas.
- 10.

De la solución se obtiene la sal por cristalización ó por concentración.

EJEMPLO I

- A una disolución de 1 gr. de prednisolona hemisuccinato en 10 c.c. de etanol absoluto, se añade a 45 - 50° C, una disolución de 0'615 gr. de d-3-metoxi-N-metil morfina-no en 6 c.c. de etanol absoluto.
- 15.

- Se mantiene la calefacción durante 10 minutos y se concentra hasta sequedad, obteniéndose 1'5 gr. de producto que tiene un punto de fusión de 85 - 90° C.
- 20.

EJEMPLO II

A una disolución de 1'15 gr. de Prednisolona Remisuc-



cinato en 20 c.c. de una solución alcohol-eter 1 : 1, se añade a 40 - 45° una disolución de 0'7 gr. de 1-metil-4-(5-dibenzo-[a,e]-Cicloheptatrieniliden) piperidina en 30 c.c. de eter.

5. Se mantiene a 40° durante 10 minutos, después se concentra hasta mitad del volúmen inicial.

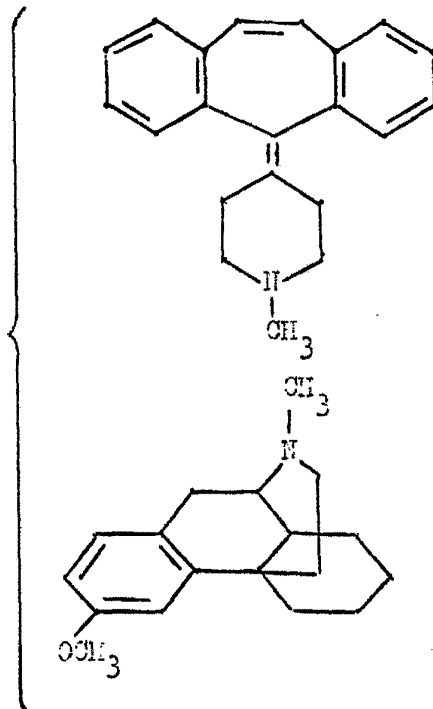
Cristaliza por enfriamiento la sal, obteniéndose 1'4 gr. de producto con un punto de fusión de 138-141° C.



N O T A

Hecha la descripción del presente invento lo que se declara como nuevo y de propia invención, comprende las reivindicaciones siguientes.

1. Procedimiento para la obtención de derivados de la prednisolona, caracterizado esencialmente por el hecho de hacer reaccionar el éster hemisuccínico de la prednisolona, en presencia de un disolvente orgánico, con bases orgánicas que corresponden a las fórmulas





aislándose la sal correspondiente de la prednisolona, del producto reaccional, mediante cristalización o concentración.

2. Procedimiento para la obtención de derivados de la prednisolona.

5.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, que consta de 5 páginas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 20 MAR 1968

p.a.

Una firma manuscrita que parece ser "JOSÉ RODRÍGUEZ".

Firmado JOSÉ RODRÍGUEZ