



Patent dodatkowy
do patentu

Zgłoszono: 22.VI.1966 (P 115 235)

Pierwszeństwo:

Opublikowano: 15.I.1969

Kl. 30 h, 2/03

MKP A 61 k

27/14

UKD

Współtwórcy wynalazku: dr Adolf Reinholz, dr Janusz Kachelski

Właściciel patentu: Fabryka Mydła i Kosmetyków „Lechia”, Poznań (Polska)

Sposób uaktywniania preparatów zawierających kapsaicynę

1

Przedmiotem wynalazku jest sposób uaktywniania preparatów zawierających kapsaicynę.

Wiadomo, że w preparatach o działaniu przeciwrzeumatycznym (wywołujących czasowe przekrwienie skóry) stosuje się bądź to naturalne ekstrakty kapsycynowe, wyekstrahowane z papryki względnie z pieprzu Cayenne, zawierające kapsaicynę naturalną łącznie z ciałami balastowymi, bądź też czyste, syntetyczne namiastki kapsaicyny naturalnej (syntetyczne kapsaicyny).

Zarówno kapsaicyna naturalna, wyodrębniona z ekstraktu kapsycynowego jak i jej namiastki syntetyczne mają słabe działanie farmakodynamiczne, ponieważ są praktycznie nierozpuszczalne w wydzielinach skóry, co utrudnia docieranie ich do tkanki skórnej, a co za tym idzie zmniejsza ich działanie fizjologiczne.

Ciała balastowe, zawarte w naturalnych ekstraktach kapsycynowych posiadają w zależności od technologii otrzymywania ekstraktów zmienne ilości naturalnych solubilizatorów kapsaicyny, wzmagających jej oddziaływanie na skórę.

Stwierdzono, że działanie farmakodynamiczne ekstraktów kapsycynowych (naturalnych) zależy zarówno od stosowanych technologii ich otrzymywania, jak też od użytych rozpuszczalników i częstokroć nie jest proporcjonalne do zawartości kapsaicyny w ekstrakcie. W związku z tym ekstrakty pochodzące z tej samej partii materiału roślinnego w zależności od sposobu ich przygotowania

2

wykazują różne działanie farmakodynamiczne wielokroć nie korelujące z zawartością kapsaicyny wykazaną w analizie.

Sposobem według wynalazku do preparatu zawierającego kapsaicynę dodaje się solubilizator, przez co uzyskuje się silniejsze działanie farmakodynamiczne, odpowiadające całkowitej zawartości kapsaicyny w preparacie.

Sposób według wynalazku polega na dodawaniu do ekstraktu kapsycynowego, do syntetycznej kapsaicyny, lub do mieszaniny ekstraktu kapsycynowego i syntetycznej kapsaicyny solubilizatora niejonowego, wykazującego wartość równowagi hydrofilo/lipofilowej „HLB” w granicach 15—18 według nomenklatury i norm wprowadzonych przez W.C. Griffin’a w „Classification of surface — active agents by HLB”: J. Soc. Cosm. Chemists 1, 311—325 (1949) a zwłaszcza solubilizatora należącego do grup niejonowych substancji powierzchniowo-czynnych takich jak: polioksyetylenowane alkohole tłuszczowe o ogólnym wzorze chemicznym $R_1(OCH_2CH_2)_nOH$, w którym R oznacza resztę alkilową o 12—18 atomach węgla w łańcuchu, n wynosi 20—30, lub polioksyetylenowane kwasy tłuszczowe o ogólnym wzorze chemicznym $R_2CO(OCH_2CH_2)_mOH$, w którym R₂ oznacza resztę alkilową o 16—18 atomach węgla w łańcuchu, m wynosi 25—30, lub polioksyetylenowane monoestry sorbitanu i kwasów tłuszczowych, zawierających 12—16 atomów węgla w łańcuchu.

Solubilizator dodaje się w stosunku wagowym 1—3:1 w odniesieniu do całkowitej zawartości kapsaicyny w preparacie.

Solubilizowaną kapsaicynę przeznacza się do takich preparatów farmaceutycznych jak plastry, maści oraz emulsje i balsamy, używanych do łagodzenia bólów reumatycznych.

Przykład I. W naczyniu emaliowanym, w temperaturze około 55°C, topi się 0,18 części wagowych syntetycznej kapsaicyny. Następnie dodaje się 3,8 części wagowe ekstraktu kapsycynowego, zawierającego 2% wagowe naturalnej kapsaicyny, uprzednio ogrzanego do temperatury 50°C i dokładnie miesza. Do mieszaniny dolewa się 0,5 części wagowej oksyetylenowanego dwudziestu cząsteczkami tlenu etylenu monolaurynianu sorbitanu i po ponownym wymieszaniu i ochłodzeniu do temperatury pokojowej, mieszaninę ugniata się, lub miesza z 95,5 częściami wagowymi masy plastrowej, osnowy maściowej, lub emulsji.

Przykład II. W naczyniu emaliowanym ogrzewa się do temperatury 60°C 0,75 części wagowych oksyetylenowanego dwudziestu cząsteczkami tlenu etylenu monolaurynianu sorbitanu, dodaje się 0,25 części wagowych syntetycznej kapsaicyny (np. wanililoamidu kwasu nonyloвого) i miesza się do otrzymania jednorodnego klarownego roztworu. Roztwór chłodzi się mieszając do temperatury pokojowej i ugniata z 99,0 częściami wagowymi masy plastrowej, lub miesza z 99,0 częściami wagowymi osnowy maściowej.

Przykład III. W naczyniu emaliowanym ogrzewa się do temperatury około 47°C 6,0 części wagowych ekstraktu kapsycynowego zawierającego 3,5% wagowe naturalnej kapsaicyny (wani-

liloamid, kwasu izodecylenowego), dodaje 0,5 części wagowej oksyetylenowanego dwudziestu cząsteczkami tlenu etylenu alkoholu stearylowego i miesza w ciągu 15 minut, utrzymując temperaturę 45—50°C. Następnie, mieszając, chłodzi się do temperatury pokojowej i ugniata tak solubilizowany ekstrakt z 93,5 częściami wagowymi masy plastrowej.

Zastrzeżenia patentowe

1. Sposób uaktywniania preparatów zawierających kapsaicynę w postaci naturalnych ekstraktów kapsycynowych, czystej syntetycznej kapsaicyny, lub mieszanin ekstraktu kapsycynowego i syntetycznej kapsaicyny, **znamienny tym**, że do preparatów dodaje się solubilizator w postaci niejonowej substancji powierzchniowo czynnej wykazującej wartość równowagi hydrofilo/lipofilowej w granicach 15—18, a zwłaszcza solubilizator należący do takich grup substancji niejonowych powierzchniowo czynnych jak: polioksyetylenowane alkohole tłuszczowe o ogólnym wzorze chemicznym $R_1(O.CH_2.CH_2)_n.OH$, w którym R oznacza resztę alkilową o 12—18 atomach węgla w łańcuchu, a n wynosi 20—30, lub polioksyetylenowane kwasy tłuszczowe o ogólnym wzorze chemicznym $R_2.CO.(O.CH_2.CH_2)_m.OH$, w którym R₂ oznacza resztę alkilową o 16—18 atomach węgla w łańcuchu, a m wynosi 25—30, lub polioksyetylenowane monoestry sorbitanu i kwasów tłuszczowych, zawierających 12—16 atomów węgla w łańcuchu.
2. Sposób według zastrz. 1, **znamienny tym**, że solubilizator dodaje się w stosunku wagowym 1—3:1 w odniesieniu do łącznej ilości kapsaicyny zawartej w preparacie.