

202377.8



5. Parte, no saturados, en tanto que 7 como mínimo y 14 como máximo de sus átomos de carbono sean alineados en cadena no ramificada. Ejemplos de tales ácidos con el ácido heptoico (C_7), el ácido caprílico (C_8), el ácido nonoico (C_9), el ácido cáprico (C_{10}), el ácido undecanoico (C_{11}), el ácido láurico (C_{12}), el ácido tridecanoico (C_{13}), el ácido margárico (C_{14}) así como derivados de estos ácidos llevando grupos alcoilo, en tanto que correspondan a la condición arriba fijada, relativa a la longitud de cadena. Además, entran en consideración,
10. los derivados de los ácidos mencionados, en los cuales ciertas de las ligaduras carbono-carbono, tienen un carácter etilénico; un representante conocido de tales ácidos no saturados es, por ejemplo, el ácido undecilénico. Los alcoholes que toman parte en la composición de los ésteres son, por ejemplo,
15. alcoholes monobásicos de hasta 4 átomos de carbono, por ejemplo, el etanol, o el butanol, alcoholes dibásicos tales como el propilenglicol, o tribásicos como la glicerina. Los ésteres de glicerina son preferidos. Particularmente ventajosos son los glicéridos ácidos mixtos, sobre todo aquellos con una crecida proporción de ácidos alifáticos de cadena corta (menos de 12 átomos de carbono en cadena no ramificada).
- 20.

Para preparar estos ésteres, se parte de una mezcla de ácidos alifáticos con 7 - 14 átomos de carbono en la cadena no ramificada, siendo la proporción de ácidos con 7 - 11 átomos de carbono, de preferencia, superior a aquella de los ácidos con 12 - 14 átomos de carbono. Tales mezclas de ácidos alifáticos pueden ser aisladas, de modo, de suyo conocido, de productos naturales, por ejemplo, aceite de nuez de coco, o mezclas de ácidos grasos sintéticos, procedentes, por ejemplo, de la oxidación de la parafina. La esterificación de es

25.

30.

202377



tas mezclas de ácidos grasos con alcoholes, de preferencia con la glicerina, se efectúa del modo de suyo conocido. Suministra "ésteres mixtos" de consistencia normalmente oleaginosas. Para obtener los ésteres glicéricos oleaginosos, se esterifica la glicerina, de preferencia con una mezcla de los ácidos grasos, y esto de tal manera que se forma muchos glicéridos ácidos mixtos y pocos glicéridos monoácidos.

5.

Por otra parte, puede efectuarse la preparación de los ésteres, asimismo, esterificando separadamente los ácidos con el alcohol y mezclando los ésteres monoácidos obtenidos, para formar una "mezcla de ésteres". Estas mezclas de ésteres generalmente son productos con carácter de unguento, cuya consistencia depende de la proporción cuantitativa de cada uno de los ésteres monoácidos de punto de fusión relativamente elevado.

10.

15.

Se disuelve, por ejemplo, vitaminas liposolubles, hormonas, substancias queratolíticas, antimicóticos u otros medicamentos en los ésteres de ácidos grasos, así obtenidos, de preferencia en los ésteres mixtos glicéricos y se unta la piel con ellos. Resulta ventajoso, utilizar un gran exceso de estos ésteres con relación al medicamento que en el mismo está incorporado.

20.

25.

Los ésteres de ácidos grasos con 7 - 14 átomos de carbono utilizados como disolventes para los medicamentos, son generalmente aceites liposolubles neutros, no irritantes, que solo están ligeramente polarizados por el hecho de su engarce de ésteres y que presentan con respecto a otros aceites o grasas solamente fuerzas intermoleculares relativamente débiles. Penetran rápida y fácilmente en la profundidad de la piel y no presentan tendencia alguna a formar una membrana de protección

30.



202377-8

- homogénea, aferrada fuertemente en la superficie de la piel. Su poder de penetración resulta tan grande, que pasan sin dificultad a través de las capas de queratina y que no se dejan detener por las proteínas. Cuando se incorpora en los mismos medicamentos liposolubles, forman con estos últimos películas mixtas, mejorando por este hecho la resorción de estos últimos y funcionan como vehículo para penetrar en las capas profundas de la piel. Además, los ácidos grasos de cadena mediana, tienen en los cambios biológicos de la piel sana un papel importante, si bien aún bastante desconocido, y su aportación influye en la vitalidad de la piel de una manera generalmente favorable; véase a este respecto G. Weizel, Deutsche Medizinische Wochenschrift 75 (Revista semanal médica alemana) -1950-, página 1616, y G. Weizel y O. Mast, Hautarzt (El Dermatólogo) 2 (1951), páginas 356-359.

EJEMPLO 1.

- En 1500 cm³ de un glicérido mixto de los ácidos grasos C₈, C₁₀, C₁₂ (composición: un aproximadamente 50 por ciento de C₈, 30 por ciento de C₁₀, 20 por ciento de C₁₂)-obtenido por fraccionamiento de la mezcla de ácidos grasos preparados partiendo de aceite de nuez de coco y por esterificación de la fracción deseada con glicerina- se disuelven tres millones de unidades de vitamina A, bajo la forma de palmitato de vitamina A. La solución límpida puede ser conservada, sin que se vaya modificando la vitamina A, y se unta con élla la piel en capas menudas por dosis diarias de 1 a 10 cm³.

EJEMPLO 2.

- 10 g de propionato de testosterona son disueltos en 1000 cm³ de un glicérido mixto de los ácidos no ramificados C₁₀, C₁₁, y C₁₂ (obtenido de manera análoga a aquella mencio

202377



nada en el Ejemplo 1). Se adiciona a la solución transparente 1000 cm³ de una mezcla de los ésteres etílicos de los mismos ácidos grasos, teniendo cuidado de que la proporción de cada uno de los ácidos con relación a la totalidad de los ácidos, sea de aproximadamente 33%. Se obtiene un aceite fluido, con el cual se unta la piel.

5. La invención, dentro de su esencialidad, podrá llevarse a la práctica en otras variantes de realización que difieran en detalle de la indicada a título de ejemplo, empleando los medios, aparatos, temperaturas y proporciones más adecuados a cada caso: por quedar todo ésto comprendido dentro del espíritu de las reivindicaciones.

N O T A

15. Hecha la descripción del presente invento, se hace constar que la presente solicitud se acoge a los derechos de prioridad de la patente alemana depositada el día 16 de marzo de 1951, y comprende las siguientes reivindicaciones, como de propia invención:

20. 1ª.- Procedimiento para la preparación de soluciones medicamentosas, tales como soluciones de vitaminas liposolubles, de hormonas, de soluciones queratolíticas, antimicóticas, etc., caracterizado por el hecho de que se utiliza como disolvente ésteres de ácidos grasos con 7 - 14 átomos de carbono en la cadena no ramificada y alcoholes mono- o polibásicos, particularmente glicerina.

25. 2ª.- Procedimiento según la reivindicación 1ª, caracte-

202377



terizado por el hecho de que se utiliza ésteres mixtos o mezclas de ésteres, en los cuales la proporción de los ácidos grasos con 7 - 11 átomos de carbono en la cadena no ramificada, resulta superior a aquella de los ácidos grasos con 12 - 14 átomos de carbono en la cadena no ramificada.

5.

3ª.- Procedimiento para la preparación de soluciones medicamentosas.

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, que consta de seis hojas, foliadas y escritas a máquina por una sola cara.

10.

Madrid, a 8 de marzo de 1952.

P. a.

JOSE LUIS MIRALLES

P. P.