



263559

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se presenta para unir a la solicitud

d e

P A T E N T E D E I N T R O D U C C I O N

formulada el 24 de Diciembre de 1960, con el N° 263.559

e n

E S P A Ñ A

por DIEZ años

a nombre de CARL HEINZ BUER CHEMISCH PHARMAZEUTISCHE FABRIK,
entidad alemana, establecida en Eupener Strasse 159, Köln-
Braunfeld, República Federal Alemana, por:

"UN PROCEDIMIENTO PARA LA PREPARACION DE EMULSIONES
DE FOSFATIDOS"

=====

El presente invento se refiere a la preparación de emul-
siones de fosfátidos en alcohol acuoso.

Para preparar emulsiones con un tanto por ciento elevado
de fosfátidos en alcohol acuoso, el procedimiento que se ha lle-
vado a cabo hasta ahora consiste en añadir el fosfátido, con
5 agitación constante, a una solución fuertemente calentada de al-
cohol en agua, conteniendo dicha solución por lo menos 6%, pero
no más del 35%, de un hidrato de carbono. Como hidratos de car-
bono pueden tomarse en consideración los siguientes: monosacá-
ridos, como las pentosas y hexosas, disacáridos, como la saca-
10

263559



rosa, maltosa y lactosa y polisacáridos, como el almidón. Mediante este procedimiento, pueden prepararse emulsiones que tengan un contenido de hasta 15% de fosfátido y una concentración de alcohol de 5-25%.

5 Se ha descubierto que la estabilidad de las emulsiones, obtenidas de acuerdo con el procedimiento antes descrito, que tengan un peso específico mayor de 1,0, varía según el contenido en grasa neutra del fosfátido; los fosfátidos puros producen emulsiones inestables, mientras que los fosfátidos que
10 tengan un pequeño contenido en grasa neutra, conducen a emulsiones estables. Este comportamiento variable de los fosfátidos es debido al hecho de que las partículas finas de fosfátidos se recubren con la grasa neutra, en forma de película muy delgada, que cubre los grupos hidrófobos de las moléculas de fosfátido y hace posible, así, la preparación de emulsiones estable
15 de fosfátido con un tanto por ciento elevado.

 El procedimiento del invento se lleva a cabo, preferentemente, convirtiendo los fosfátidos en emulsión—según se indicó anteriormente—, con aquellas grasas neutras con las que se
20 encuentran asociados en la naturaleza. Dicha grasa neutra se añade al fosfátido que se emulsifica, o, bien, el fosfátido se libera de modo incompleto, durante su preparación, de la grasa neutra adherida al mismo. Por ejemplo, se procede añadiendo al fosfátido, por ejemplo, la lecitina que haya de ser emul-
25 sificada, una pequeña cantidad del aceite que haya sido extraído por acetona de la lecitina bruta; o, bien, durante la preparación de la lecitina bruta, se lleva a cabo incompletamente la extracción con acetona.

 De preferencia, el alcohol acuoso empleado en el procedimiento, de acuerdo con el presente invento, no contiene más
30



383559

del 25% de alcohol.

Para la preparación de una emulsión estable, se ha encontrado que es, particularmente adecuada, una cantidad de grasa en el intervalo de 0,5-5%, calculada con respecto al fosfátido a emulsificar. De preferencia, las emulsiones resultantes contienen, por lo menos, 5% de fosfátido.

Entre los fosfátidos se incluyen los esterés de los diferentes ácidos carboxílicos alifáticos, saturados y no saturados, que tengan un número de átomos de carbono de 16 a 26, con un alcohol al que se halla unida una base nitrogenada, como la colina o colamina, por medio de un resto de ácido fosfórico. El fosfátido, que existe más frecuentemente en la naturaleza, es la lecitina, un glicerofosfátido. En relación con esto, la colin- y colaminlecitina (conocida también como cefalina) se distinguen porque la base nitrogenada, unida por el resto de ácido fosfórico, es colina o colamina. El número de lecitinas aumenta todavía por la posibilidad de que el resto de ácido fosfórico que lleva la base nitrogenada pueda encontrarse en la posición 2 ó 3 del resto de glicerina. Los otros dos grupos hidroxilo del resto de glicerina, es decir, las posiciones 1 y 3 ó 1 y 2 pueden hallarse esterificados, uno o ambos, por ácidos grasos saturados o no saturados, que tengan un número de átomos de carbono de 16 a 26. En el caso de dos ácidos grasos, éstos son normalmente de tipos diferentes y uno de ellos es no saturado; en relación con esto, incluso para una cantidad determinada de lecitina, las proporciones de ácidos saturados y no saturados pueden variar en un amplio intervalo.

Ejemplo 1

100 g de colina-colamina-lecitina exenta de grasa se emul-



263557

5 significan en 1000 cc de una solución calentada a 80°C, de 80 g de dextrosa, en alcohol etílico acuoso al 5%, por medio de un aparato de agitación apropiado. Una vez completa la adición, se continúa la agitación durante otros 5 minutos. La emulsión resultante se encuentra, sin embargo, que es inestable.

Ejemplo 2

10 Operando de acuerdo con el ejemplo 1, pero añadiendo simultáneamente, junto con la lecitina, aproximadamente, 1 g del aceite contenido en la lecitina bruta, se obtiene una emulsión completamente estable con un porcentaje elevado. El tamaño de partícula de la lecitina en la emulsión se encuentra entre 0,03 y 0,06 μ . El peso específico de la emulsión es mayor que 1.

Ejemplo 3

15 150 g de lecitina desengrasada de modo incompleto, con un contenido en aceite, de aproximadamente 2%, se añaden en pequeñas porciones y con agitación a una solución, calentada a 70°C, de 20 g de sacarosa y 100 g de dextrosa en 1400 cc de alcohol acuoso al 15% y se agitó durante 8 minutos. Se obtuvo una emulsión completamente estable con un porcentaje elevado. El tamaño de partícula de la lecitina en la emulsión se encuentra entre 0,03 y 0,06 μ . El peso específico de la emulsión es mayor de 1.

25 Las emulsiones obtenidas de acuerdo con el presente invento pueden utilizarse en una gran variedad de campos para muchas aplicaciones diferentes, por ejemplo, como tónicos para el tratamiento de la anemia, y afecciones nerviosas y, asimismo, terapéuticamente para el tratamiento de desarreglos hepáticos y cardíacos.

30

263559



- N O T A -

Los puntos de invención propia, no nueva, pero no establecida, practicada ni divulgada en España, que se presentan para que sean objeto de esta Patente de Introducción, por DIEZ años, son los siguientes:

1º.- Un procedimiento para la preparación de emulsiones estables de fosfátidos, que comprende agitar un fosfátido y una grasa neutra en una cantidad de aproximadamente 0,5 a 5% en peso del fosfátido, en una solución acuosa de aproximadamente 70 a 80º C, que contiene aproximadamente 5 a 25% de alcohol etílico y un carbohidrato, empleándose dicho carbohidrato en una cantidad de aproximadamente 6 a 35% en peso y empleándose dicho fosfátido en una cantidad de aproximadamente 5 a 15% en peso de la emulsión.

2º.- El procedimiento del punto 1º, en el cual dicho carbohidrato es un monosacárido elegido del grupo consistente en pentosas y hexosas.

3º.- El procedimiento del punto 1º, en el cual dicho carbohidrato es un disacárido elegido del grupo consistente en sacarosa, maltosa y lactosa.

4º.- El procedimiento del punto 1º, en el cual dicho carbohidrato es almidón.

5º.- El procedimiento del punto 1º, en el cual dicha grasa neutra está contenida en dicho fosfátido.

6º.- Un procedimiento para la preparación de emulsiones de fosfátidos.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y con los fines que se han especificado.

263559



Esta Memoria consta de seis hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid,

25 FEB 1941

P.A.

AVS. 