



AUSGEGEBEN AM
2. SEPTEMBER 1937

REICHSPATENTAMT
PATENTSCHRIFT

Nr 649771

KLASSE 30h GRUPPE 2

R 82901 IV a/30h

Tag der Bekanntmachung über die Erteilung des Patents: 19. August 1937

F. Ad. Richter & Cie A.-G. Chemische Werke in Rudolstadt

Verfahren zur Herstellung gereinigter Capsaicinpräparate

Patentiert im Deutschen Reiche vom 1. Oktober 1931 ab

Extrahiert man Früchte der verschiedenen Pfefferarten (Chillies) in bekannter Weise mit geeigneten Lösungsmitteln, z. B. Alkohol, so werden neben dem als thermophorisches Mittel dienenden Capsaicin verschiedene Begleitstoffe herausgelöst, so z. B. Farbstoffe und fette Öle. Die Isolierung des reinen Capsaicins ist nur auf umständlichem und zeitraubendem Wege möglich.

Es ist ferner bekannt, daß Capsaicin mit Wasserdampf flüchtig ist (vgl. Pharmazeutische Zentralhalle, Bd. 17, 1876, S. 428). Die so gewonnenen Destillate zeigen zwar Pfeffergeschmack, sind aber als thermophorisches Mittel unwirksam. Man hat auch schon Chillies mit hochsiedenden Lösungsmitteln extrahiert.

Die Erfindung bedient sich der Erkenntnis, daß das Capsaicin mit hochsiedenden Lösungsmitteln flüchtig ist. Gemäß der Erfindung werden diese sehr hochsiedenden Lösungsmittel aus den in der Droge enthaltenen fetten Ölen erzeugt. Als Glyceride sind diese Öle selbst nicht destillierbar; werden sie jedoch mit primären Alkoholen in üblicher Weise umgeestert, so entstehen Fettsäureester, die destillierbar sind und einen genügend hohen Siedepunkt besitzen. Sie dienen daher dazu, das in dem Extrakt der Droge befindliche Capsaicin überzudestillieren. Vor der Bildung der Fettsäureester können auch andere geeignete, hoch- oder niedrigsiedende Lösungsmittel, z. B. Kampferöl oder Acelon, den Drogen zwecks Extraktion zugesetzt wer-

den. Man setzt demgemäß den Chillies in bekannter Weise primäre Alkohole, wie Äthyl- oder Isopropylalkohol, hinzu und erwärmt in Gegenwart kleiner Mengen von Umesterungskatalysatoren, wie Schwefelsäure. Darauf wird mit Ammoniak alkalisch gemacht und zuletzt bei hohem Vakuum destilliert. Es gehen zunächst Äthylalkohol und überschüssiges Ammoniak über; dann folgen die das Capsaicin enthaltenden Fettsäureester der verwendeten Alkohole. Durch diese Ester wird auch die Wirkung des Capsaicins auf der Haut unterstützt. Es ist auch möglich, den Chillies andere Drogen zuzusetzen, so z. B. die den Salicylsäuremethylester enthaltenden *Herbae Gaultheriae* oder die ölreichen Samen *Sinapis*. In letzterem Fall kann die Neutralisation der die Umesterung befördernden Säure infolge der Bildung von Thiosinamin nicht mit Ammoniak vorgenommen werden; vielmehr wendet man Alkali in gerade ausreichender Menge an.

Beispiele

1. 100 Teile Chillies werden mit 150 Teilen Isopropylalkohol und 0,75 Teilen Schwefelsäure 24 Stunden heiß extrahiert. Den erhaltenen Extrakt sättigt man mit Ammoniak und destilliert darauf zunächst den überschüssigen Isopropylalkohol ab. Die weitere Destillation wird nun unter einem Druck von 4 mm Quecksilbersäule durchgeführt.

2. 200 Teile eines durch Extraktion gleicher Mengen von Chillies und *Herba Gaultheriae*

mit Kampheröl erhaltenen Extraktes versetzt
man mit der gleichen Menge Alkohol und
1 Teil Schwefelsäure, erhitzt am Rückfluß-
kühler, neutralisiert mit Ammoniak und de-
stilliert darauf unter Verwendung eines hohen
5 Vakuums ab.

PATENTANSPRÜCHE:

10 I. Verfahren zur Herstellung gereinigter
Capsaicinpräparate, dadurch gekennzeich-
net, daß man Chillies oder ein Gemisch
derselben mit anderen wirksamen Drogen
in bekannter Weise mit primären Alko-

holen digeriert, die Alkohole mit den in
den Drogen enthaltenen fetten Ölen um- 15
estert und das nach der Neutralisation der
Masse erhaltene Produkt der Destillation
in hohem Vakuum unterwirft.

Ausführungsform des Verfahrens
nach Anspruch I, dadurch gekennzeichnet, 20
daß die Drogen einer Extraktion mit
anderen hoch- oder niedrigsiedenden Lö-
sungsmitteln, wie Kampferöl oder Aceton,
unterworfen und in dem Extrakt die fetten
Öle mit primären Alkoholen umgeestert 25
werden.