

Preparazione delle droghe

metodi preposti a migliorare la resa di estrazione e la biodisponibilità dei principi attivi delle droghe

Requisiti: conoscenza della composizione delle Droghe - Aspetti generali -

- 1. Principi attivi:** sostanza principalmente attiva e composti secondari comunque attivi e strutturalmente spesso simili che agiscono in sinergia. Fitocomplesso. Oppio, digitale, strofanto, ginseng, ecc.
- 2. Composti secondari (non attivi):** composti che non posseggono azione farmacologica ma che concorrono all'azione del composto/i attivo/i. Sono composti veicolanti e che influenzano l'assorbimento, es. saponine, polifenoli.
- 3. Sostanze non attive e che non concorrono in alcun modo all'azione.**
Attualmente di difficile individuazione data la riscoperta di medicine alternative dai contenuti olistici, in alternativa alla medicina tradizionale (es. zuccheri)
- 4. Composti non attivi indesiderati:** rendono non appetibile la droga o le sue preparazioni, o la rendono instabile nel tempo (es. irrancidimento dei grassi, taluni composti terpenici in oli essenziali, glucoproteine irritanti come la ricina = emolisi, blocco renale)
- 5. Costituenti strutturali della droga:** cellulosa, lignina, suberina, sostanze pectiche. Sono generalmente indifferenti all'azione ma hanno solo funzione costitutiva.

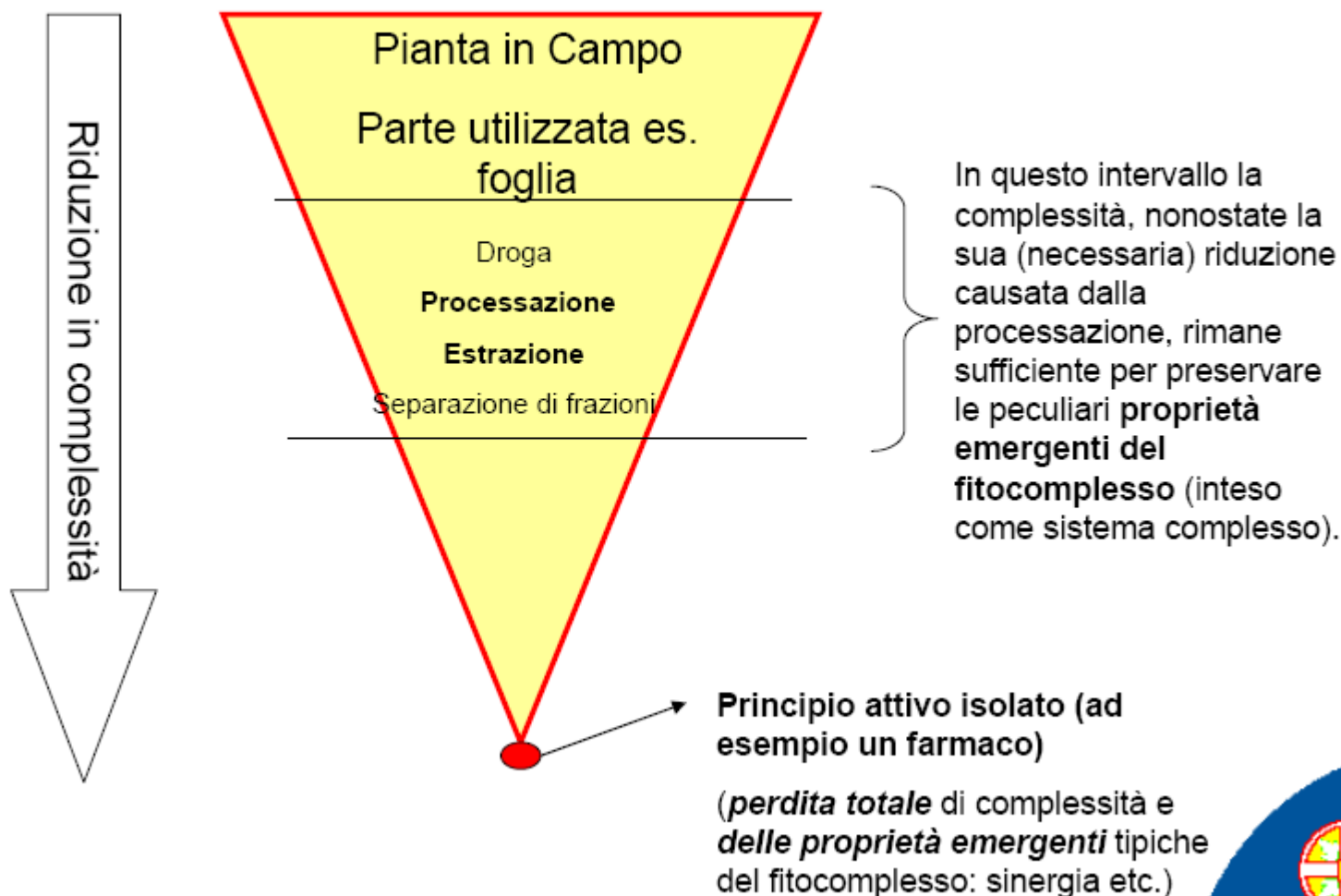
La struttura del fitocomplesso

- La moltitudine di costituenti chimici presenti in un fitocomplesso **non è un aggregato casuale**, ma è il frutto di una precisa **NECESSITA'** metabolica della pianta.
- Il **fitocomplesso** possiede quindi un **intrinseca struttura** che sta diventando un interessante soggetto di indagine.

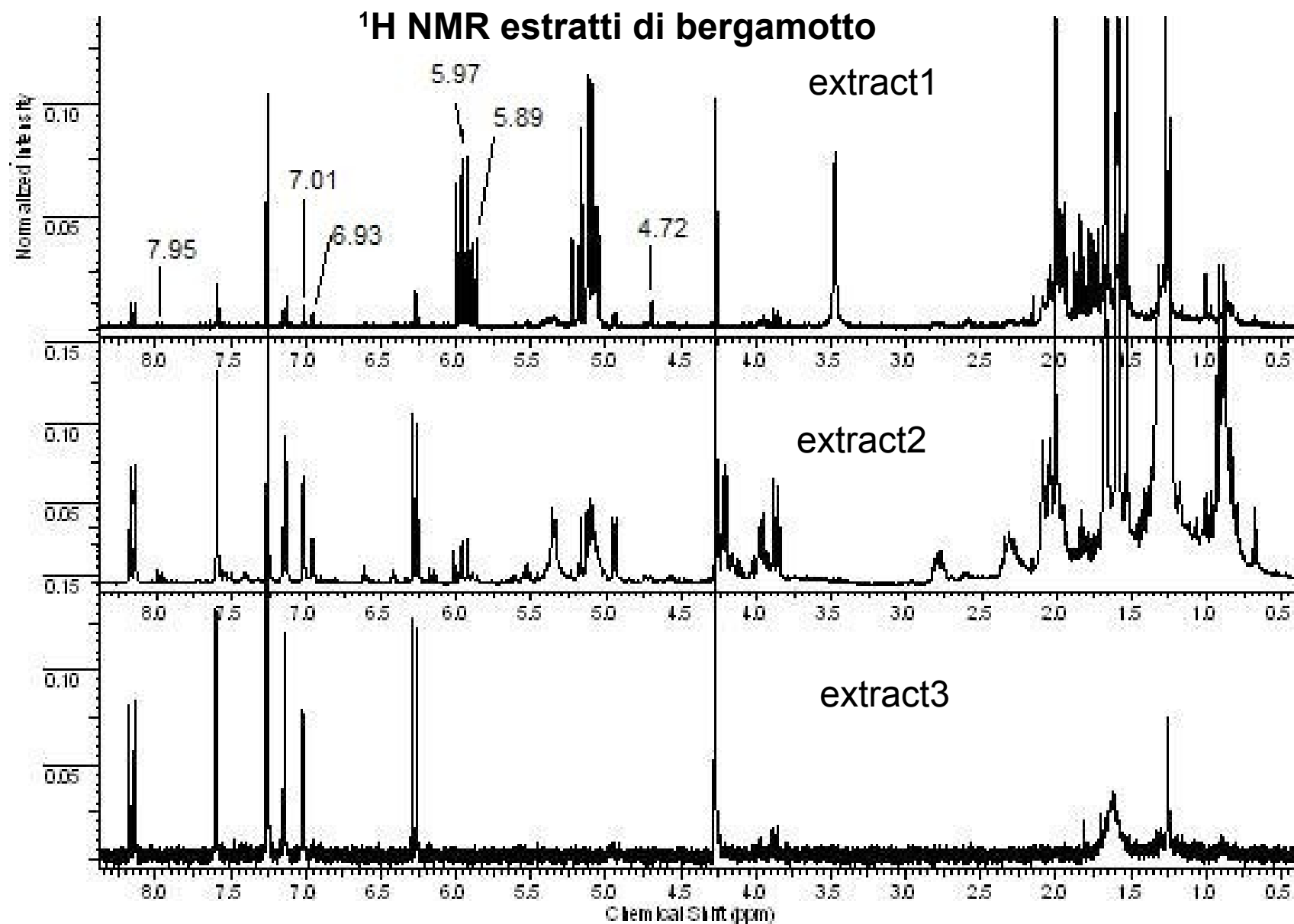
■ Principi attivi e struttura

- La comprensione dell'**attività biologica** di un fitocomplesso, **non può essere raggiunta** pensando di studiare solo i **singoli principi attivi**.
- La **caratteristica intrinseca** di un fitocomplesso è la sua **COMPLESSITA' STRUTTURALE**.

Fitocomplesso, complessità e proprietà emergenti.

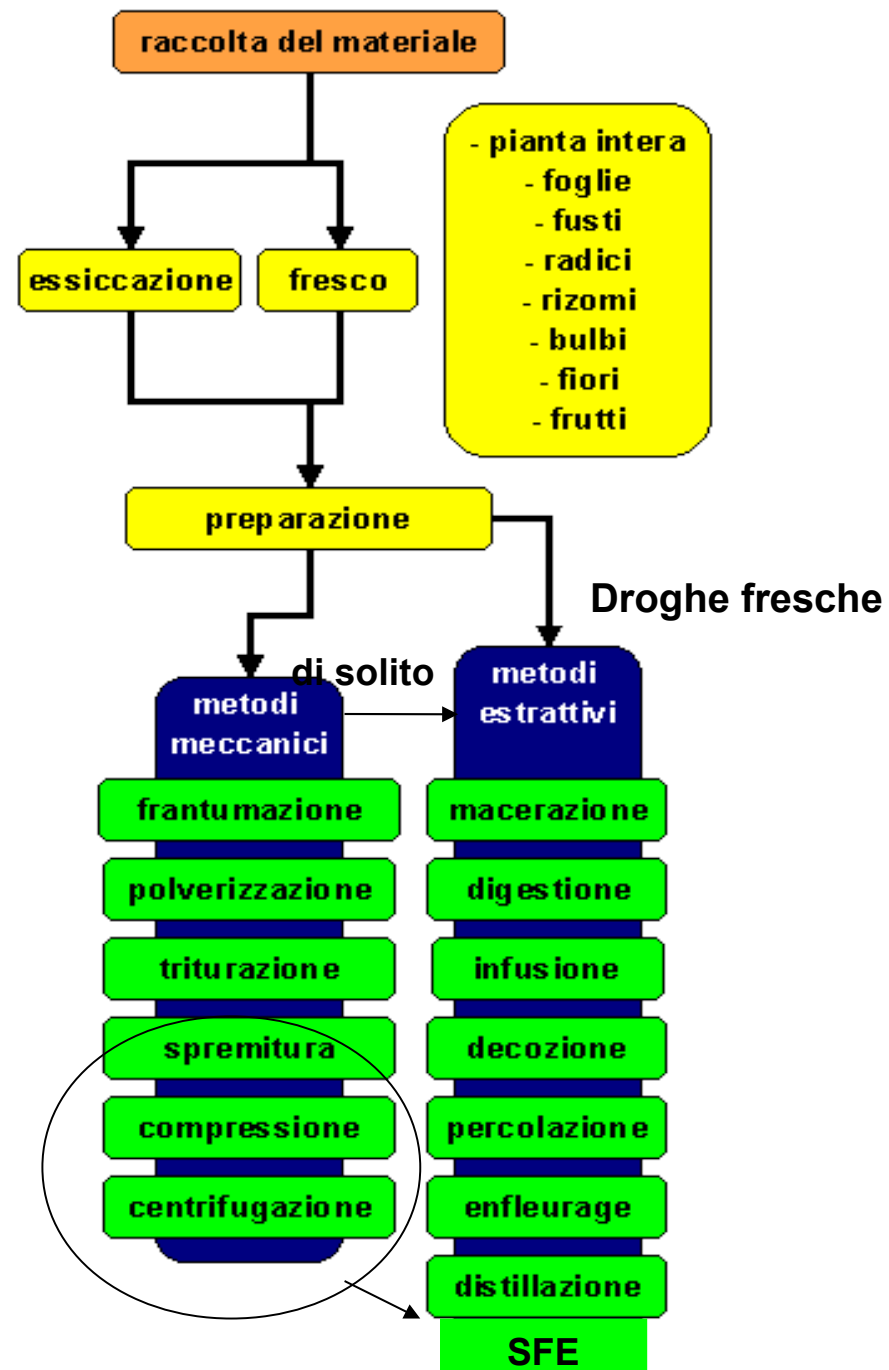


PLANT
MEDIC



Tecniche strutturali di fingerprinting

Diagramma di richiamo riassuntivo



METODI MECCANICI

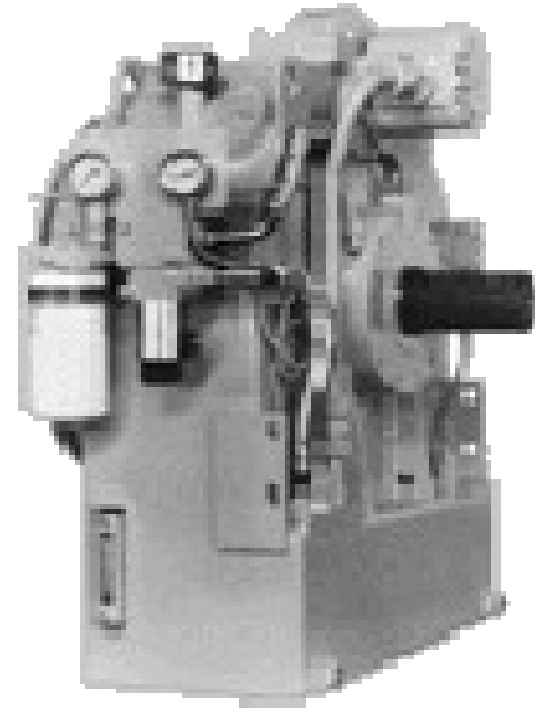
FRANTUMAZIONE: droghe dure, consistenti e di pezzatura elevata (radici, rizomi, cortecce, fusti) per ridurle a pezzatura più o meno grossolana. Mortai, frantumatori a lame, macinatori a coltelli, grattugie rotanti. Materiale: acciaio inox o rame; non poroso. Variante: criofrantumazione con azoto liquido a -196°C .

TRITURAZIONE: droghe di consistenza più ridotta (frutti, tuberi, radici, foglie, gemme, fiori) per ottenere pezzature grossolane, fini, sminuzzamento definti nelle Farmacopee. Si utilizzano strumenti che esercitano forze di pressione, taglio o urto.

Taglio tisana

POLVERIZZAZIONE: ridurre una droga ad una consistenza polverosa ($125\mu\text{m}$) spesso predefinita (FU, OMS). In caso di droghe oleaginose si aggiungono amido, mannitolo, talco, zucchero, cloruro di sodio, ciclodestrine, ecc.

NB i contenitori non devono essere POROSI

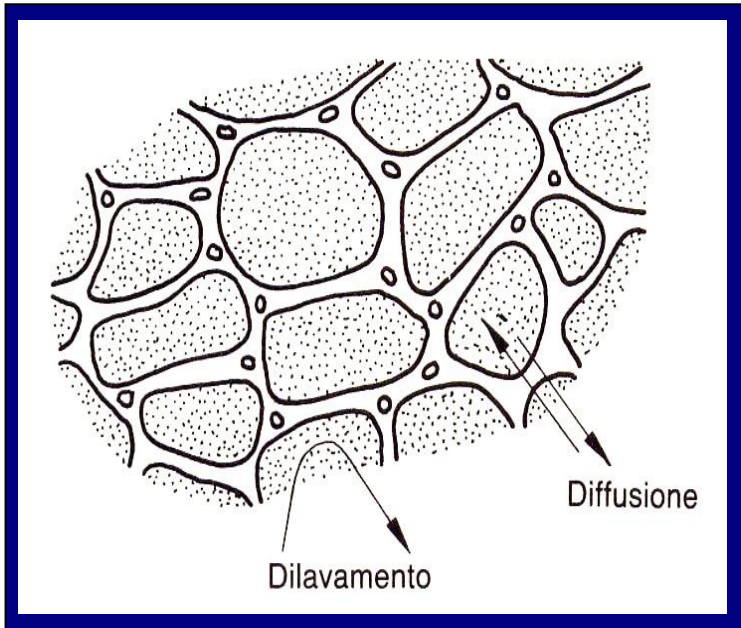


Preparazione delle droghe: estrazioni meccaniche:

- spremitura/compressione: si opera sulla droga fresca (succhi, oli essenziali, oli fissi)
- centrifugazione: succhi (consumazione entro le 24h)

Questi processi estrattivi possono essere seguiti da decantazione e filtrazione

PREPARAZIONE DELLE DROGHE: ESTRAZIONE CON SOLVENTI DEI PRINCIPI ATTIVI

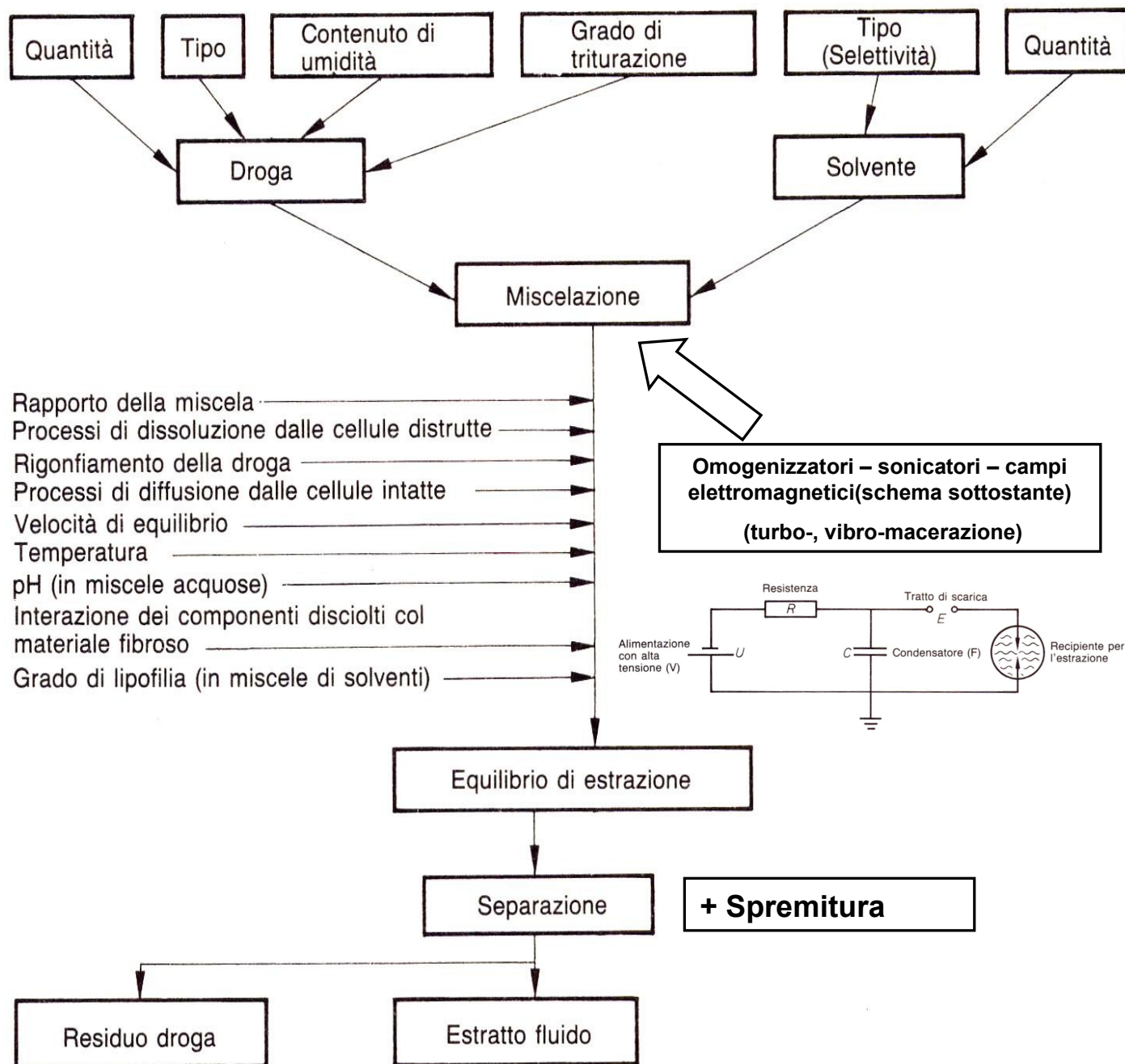


- Conoscenza dei principi attivi da estrarre: scelta del solvente (miscela di solventi) per affinità – simile scioglie simile (acqua-alcol, acqua-alcol-glicerina, glicole propilenico uso esterno, esano va rimosso)
- Stato della droga: fresca o essiccata
- Temperatura di estrazione
- Tempo di estrazione
- Rimestamento
- Aspetti legati alla tipologia specifica di estrazione (ad esaurimento, equilibrio)

Macerazione, digestione, infusione, decozione, percolazione, enfleurage, distillazione, estrazione in controcorrente, estrazione con fluidi supercritici

Macerazione: la droga polverizzata o variamente contusa - e preventivamente umettata con solvente di estrazione - viene posta a bagno nel solvente in contenitori opportuni ad una °T non superiore ai 30°C. **Solventi:** Alcol (EtOH), acqua/alcol, etere, aceto, olio. La droga può essere sottoposta numerose volte a macerazione con solvente fresco fino ad esaurimento. **Feccia** = droga esausta. **Durata:** 7-15 gg

Digestione: macerazione effettuata a °T > 30°C (FUI 35°C < °T < 65°C)

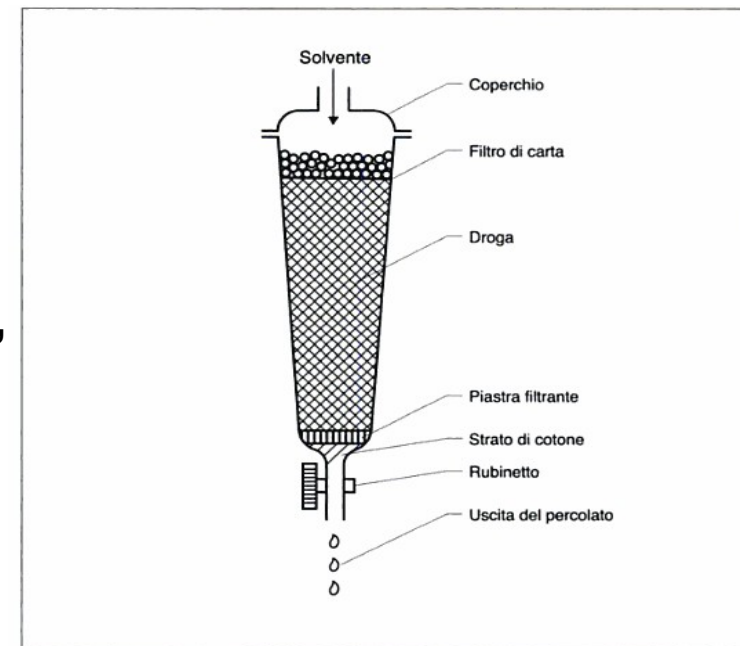


Infusione: si distingue *I. aromatico* e *I. terapeutico* sulla base del tempo di estrazione; 5-10 min per il tipo “aromatico”; fino a 30 min per il tipo “terapeutico”. Il solvente (generalmente acqua) una volta portato ad ebollizione viene versato sulla droga secca. Trascorso il tempo opportuno si filtra il tutto e viene consumato subito o comunque nell’arco delle 24h. Si opera generalmente su droghe non coriacee (foglie, fiori, infiorescenze) o comunque con un taglio triturato (es. taglio tisana)

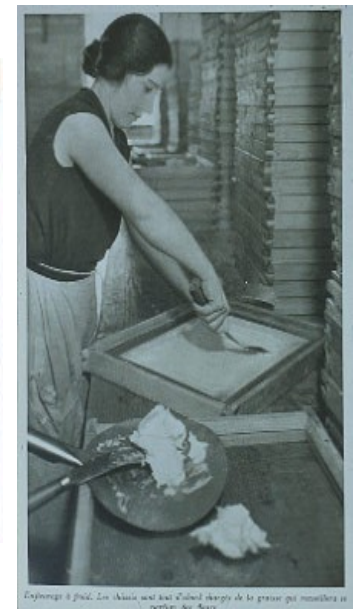
Decozione: tempistica: vedi infuso. Il solvente è generalmente acqua. Il solvente e la droga vengono da subito combinati in un recipiente opportuno e si porta il tutto ad ebollizione. Si opera una decozione generalmente su droghe coriacee (legno, corteccia, radice, rizoma). Il taglio deve essere preferibilmente triturato

Percolazione: il solvente viene fatto passare attraverso uno strato uniforme di droga, preventivamente umettata o macerata (24 ore). Importante il grado di compattamento della droga, il suo umettamento, il grado di polverizzazione, la velocità di flusso del solvente. Si raccolgono percolati parziali.

Ripercolazione, percolazione sotto pressione



Enfleurage: adsorbimento delle essenze volatili in grassi solidi fissi. Utilizzato per quelle droghe (generalmente fiori) che con le normali tecniche di distillazione non offrirebbero garanzie di quantità e qualità. Il grasso utilizzato deve avere caratteristiche neutre rispetto al profumo e stabili nel tempo. Il grasso saturo dell'essenza (*pommade*) viene poi sottoposto ad estrazione con alcol oppure commercializzato come tale.



Distillazione: sottoporre un liquido ad ebollizione raccogliendo in un contenitore a parte i composti più volatili

- . D. a bassa pressione: per composti termolabili;
- . D. distruttiva: a secco; (degradazione dei componenti in componenti volatili)
- . D. frazionata: a °T differenti
- . D. molecolare: a secco e sotto vuoto spinto (processo di purificazione) si fa evaporare il materiale, poi lo si condensa su una superficie fredda

Distillazione in corrente di vapore d'acqua: distillazione particolare per la maggiore dedicata all'estrazione di essenze. Il solvente è l'acqua. Il prodotto è duplice: olio essenziale e acque distillate aromatiche (idrolati). La droga può essere allo stato fresco o essiccato. Arricchimento dell'**IDROLATO** per distillazione ripetuta di nuova droga (coobazione).



Estrazione continua in controcorrente: una soluzione, una emulsione, una sospensione o una massa solida (droga) in movimento su una massa liquida (solvente) che fluisce in senso contrario. È esaustiva perché il solvente è sempre nuovo. Applicata con successo su droghe oleaginose. Solvente di elezione: *n*-esano.

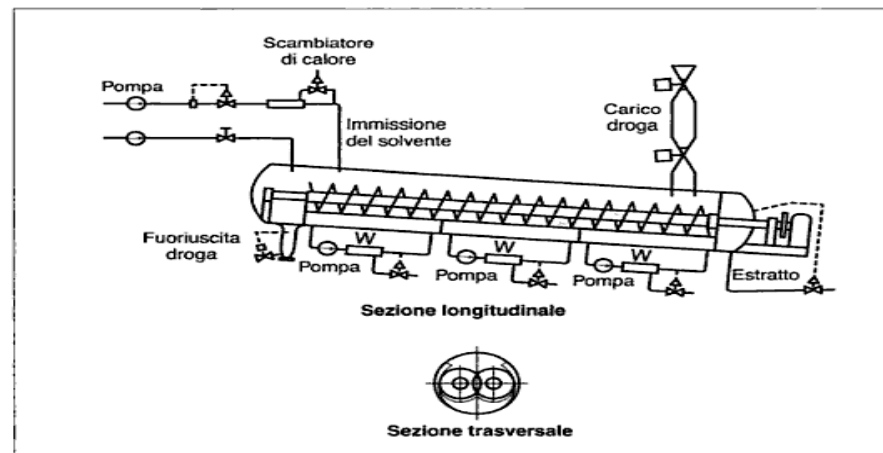


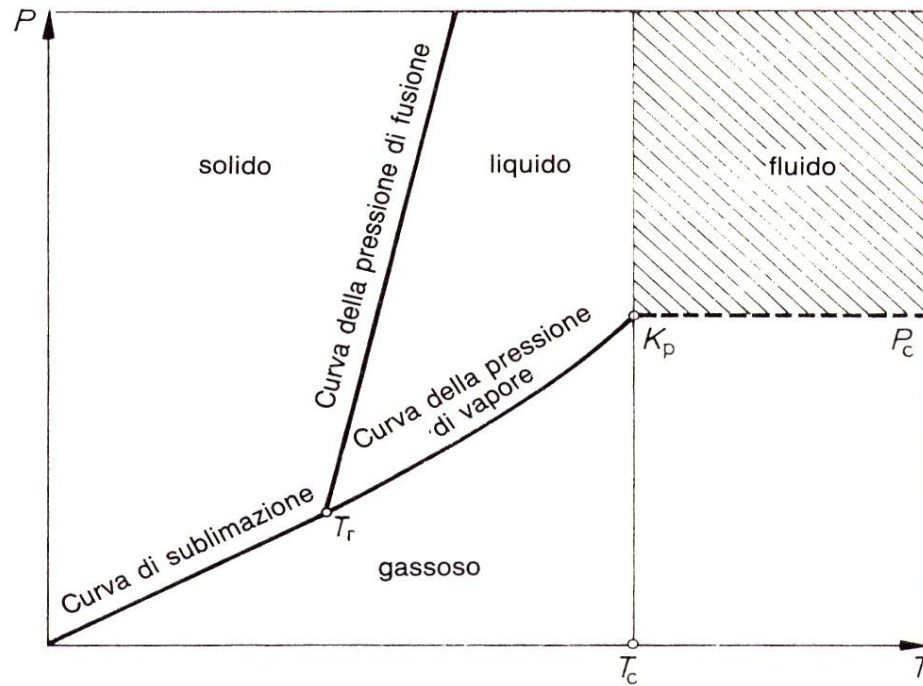
Figura 10.13 Estrattore secondo DAB 8

Estrazione con Fluidi supercritici:

- CO₂ solvente di elezione
- Particolarmente efficace per droghe oleaginose
- Stato gassoso caratterizzato da elevata densità. Proprietà intermedie tra quelle dei liquidi e dello stato aeriforme

Rispetto ad un liquido:

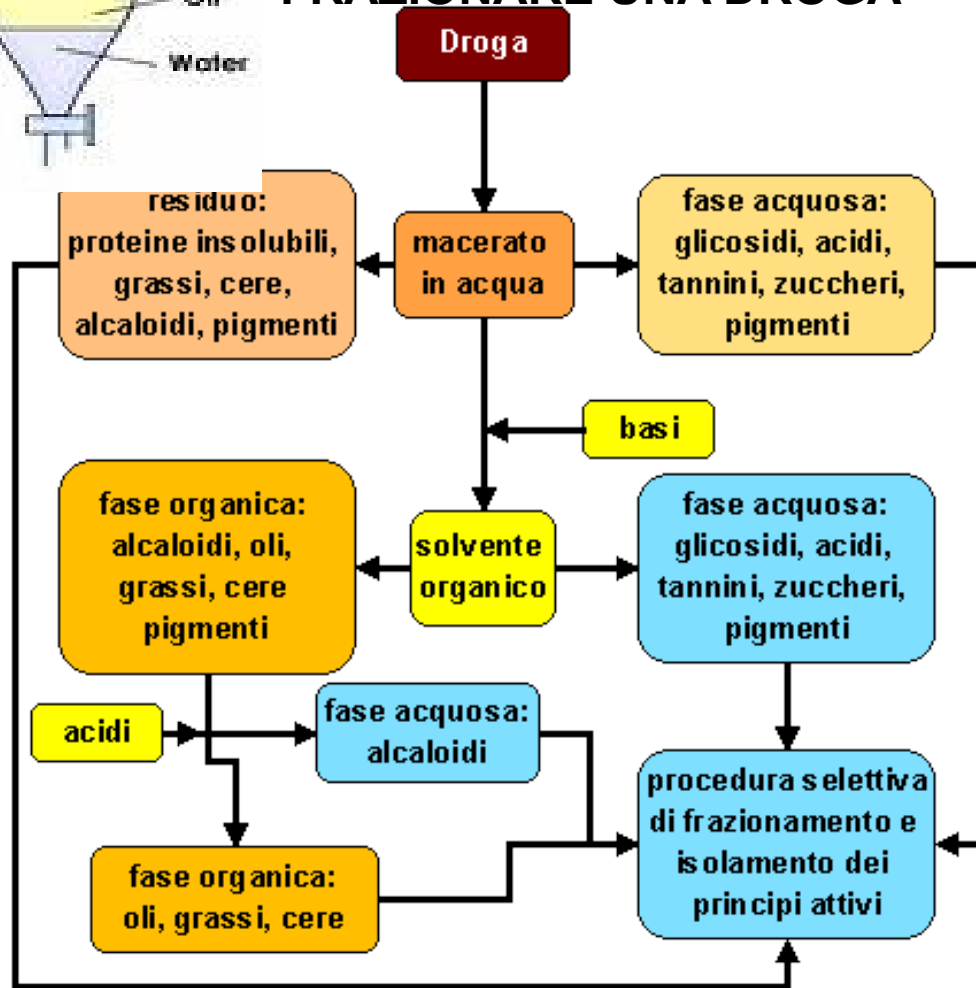
- densità leggermente inferiore
- viscosità molto più bassa
- maggiore diffusività
- possibilità di variare *in progress* la capacità solvatante agendo su piccole variazioni di P e °T
- possibilità di variare il potere solvatante con l'aggiunta di piccole quantità di solvente organico
- possibilità di ottenere estratti *solvent free*: impiego diretto
- azzeramento dei costi di smaltimento dei solventi=scarso impatto ambientale
- costi ancora elevati



°T=31°C

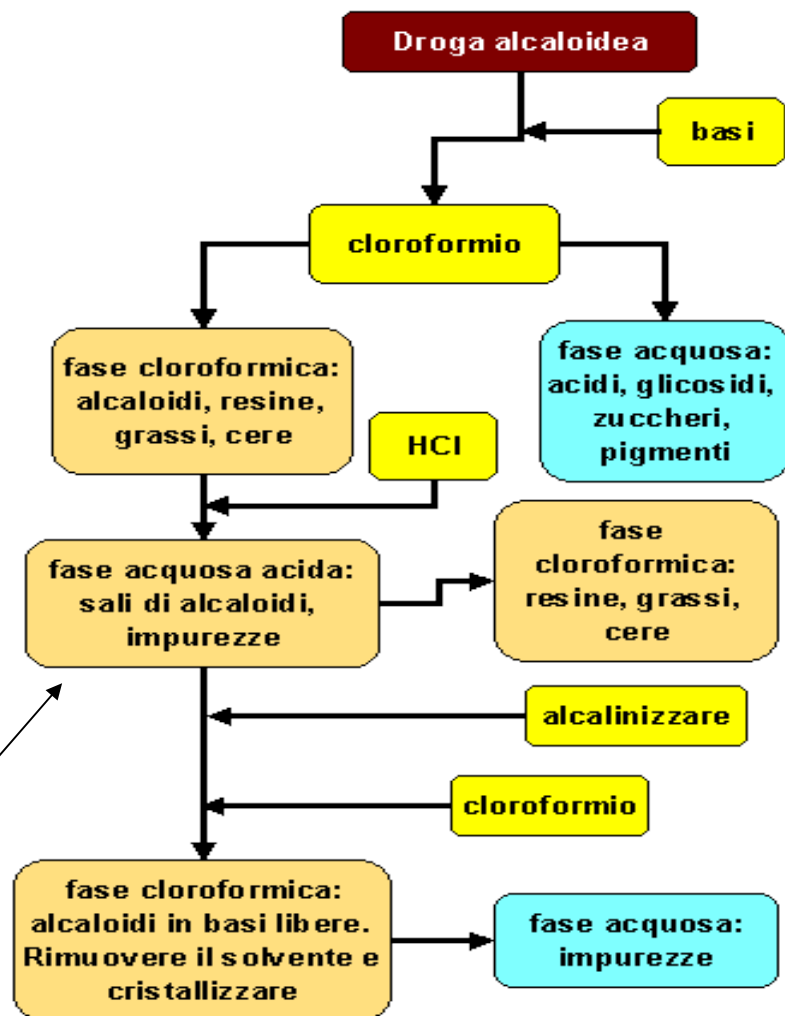
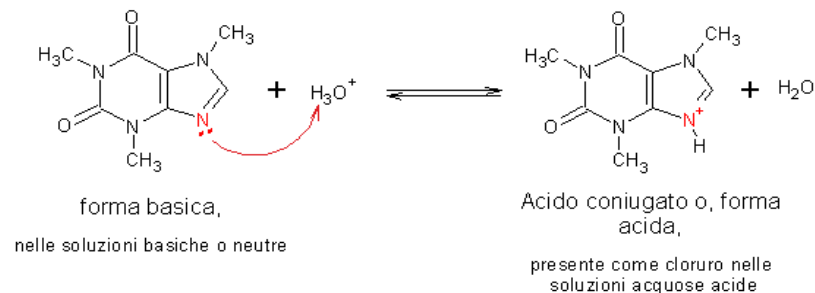
P~73atm

SCHEMA GENERALE PER FRAZIONARE UNA DROGA



Solventi che sfasano con acqua: esano, clorurati, eteri, etilacetato. NO etanolo e metanolo

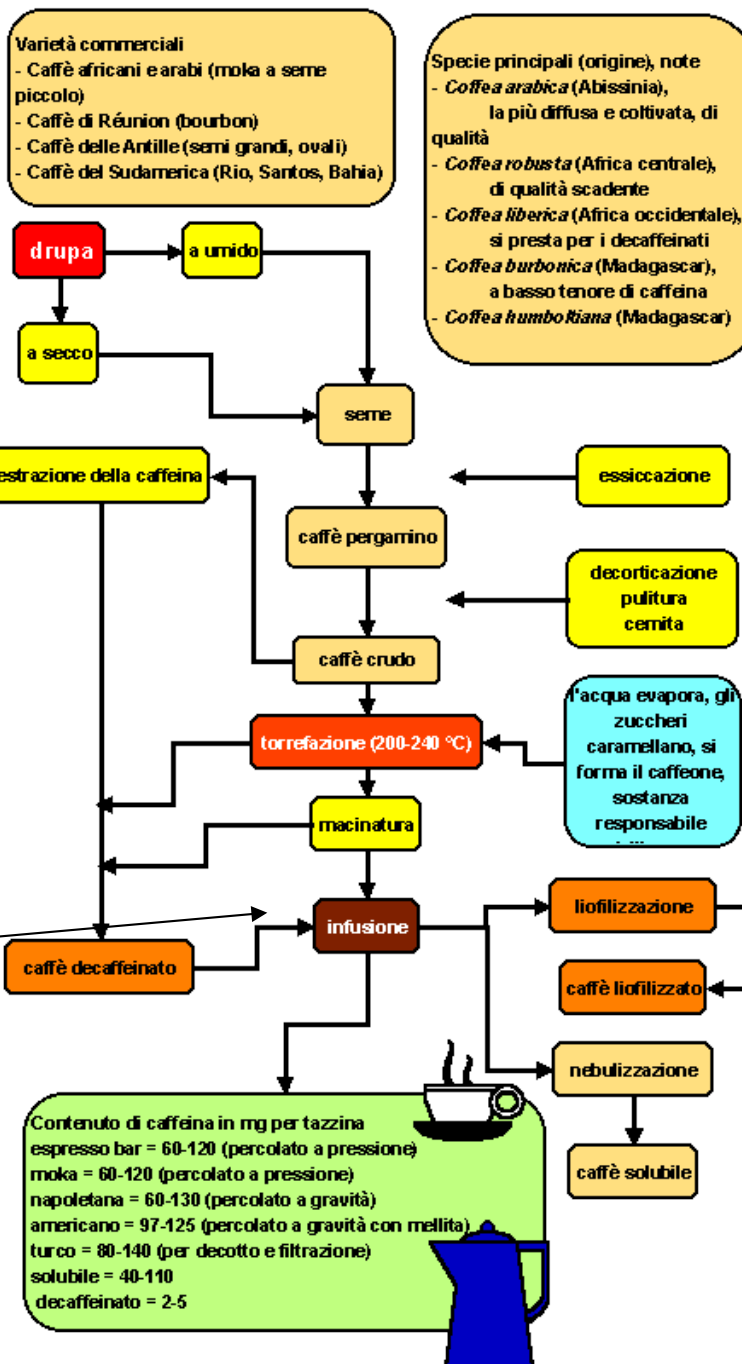
Estrazione per spostamento



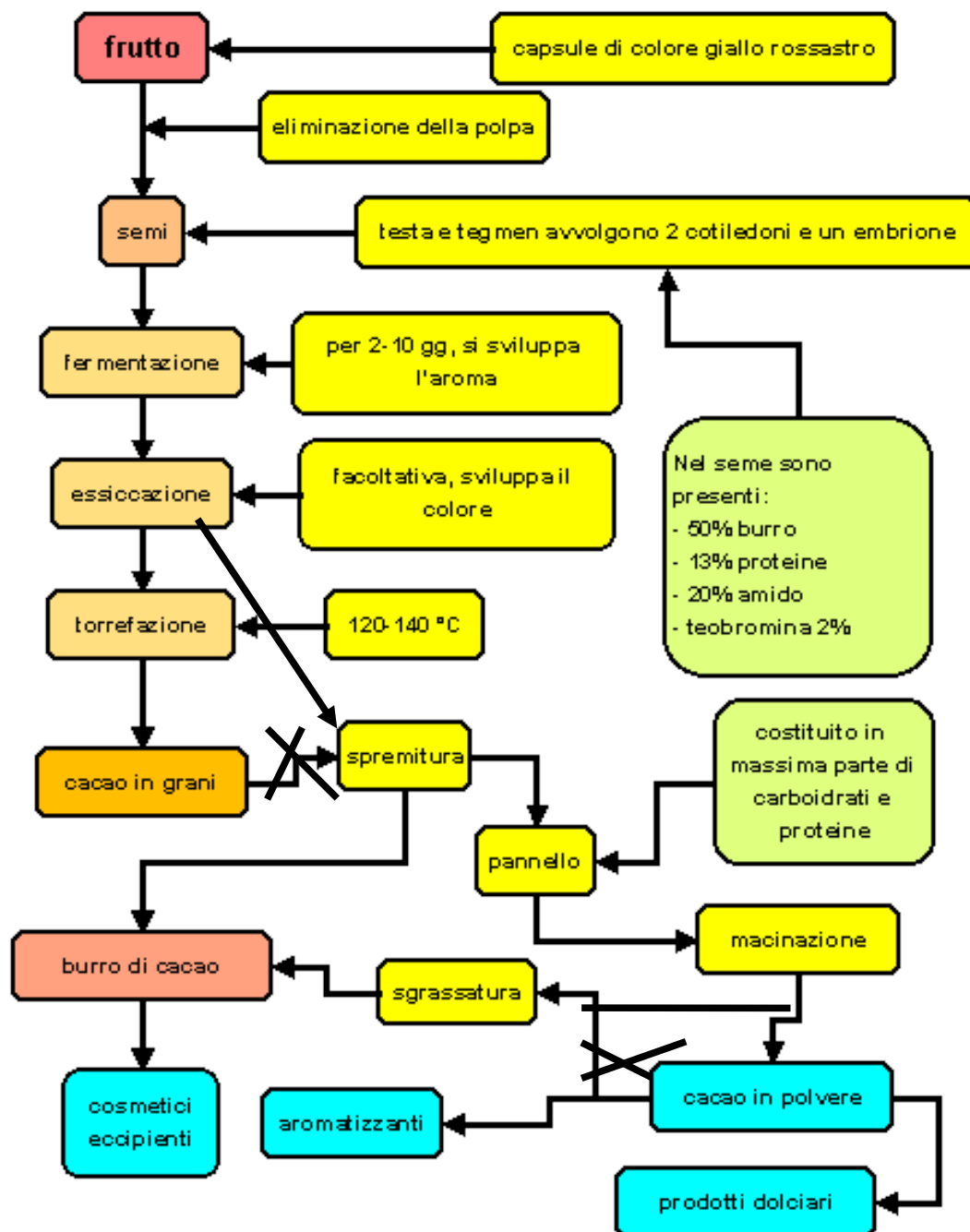
Albero dell'Abissinia

bacca

percolazione



Albero dell'America
centrale



Alberello o Arbusto della Birmania

Camelia sinensis

Coltivato in numerosissime varietà, la parte impiegata sono le foglie giovani. Oltre alle varietà genetiche, esistono varietà commerciali di: provenienza, periodo di raccolta, metodo di raccolta, metodo di preparazione

foglie

raccolta

avvizzimento

accartocciamento

fermentazione

estrazione della teofillina

torrefazione

setacciamento

Tè deteinato

Tè nero detto anche tè Assam o tè indiano. Molto aromatico, apprezzato in occidente

Infuso
0,5- 2,0 g per
tazza (1,5-6,0 mg
di teofillina)

Varietà per metodo di raccolta

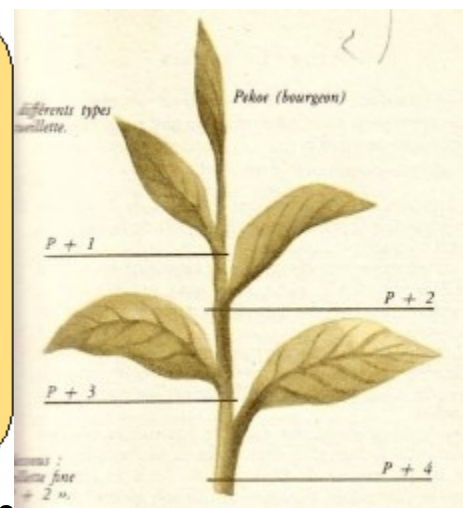
- Golden tips o Pekoe dorato, deriva dai germogli ed è di maggior pregio
- Orange Pekoe o Pekoe dorato, deriva dalle prime foglie
- Pekoe Souchong, deriva dalle terze foglie
- Souchong, deriva dalle quarte foglie
- Congou o Fish leaf o Janum, deriva dalle quinte foglie

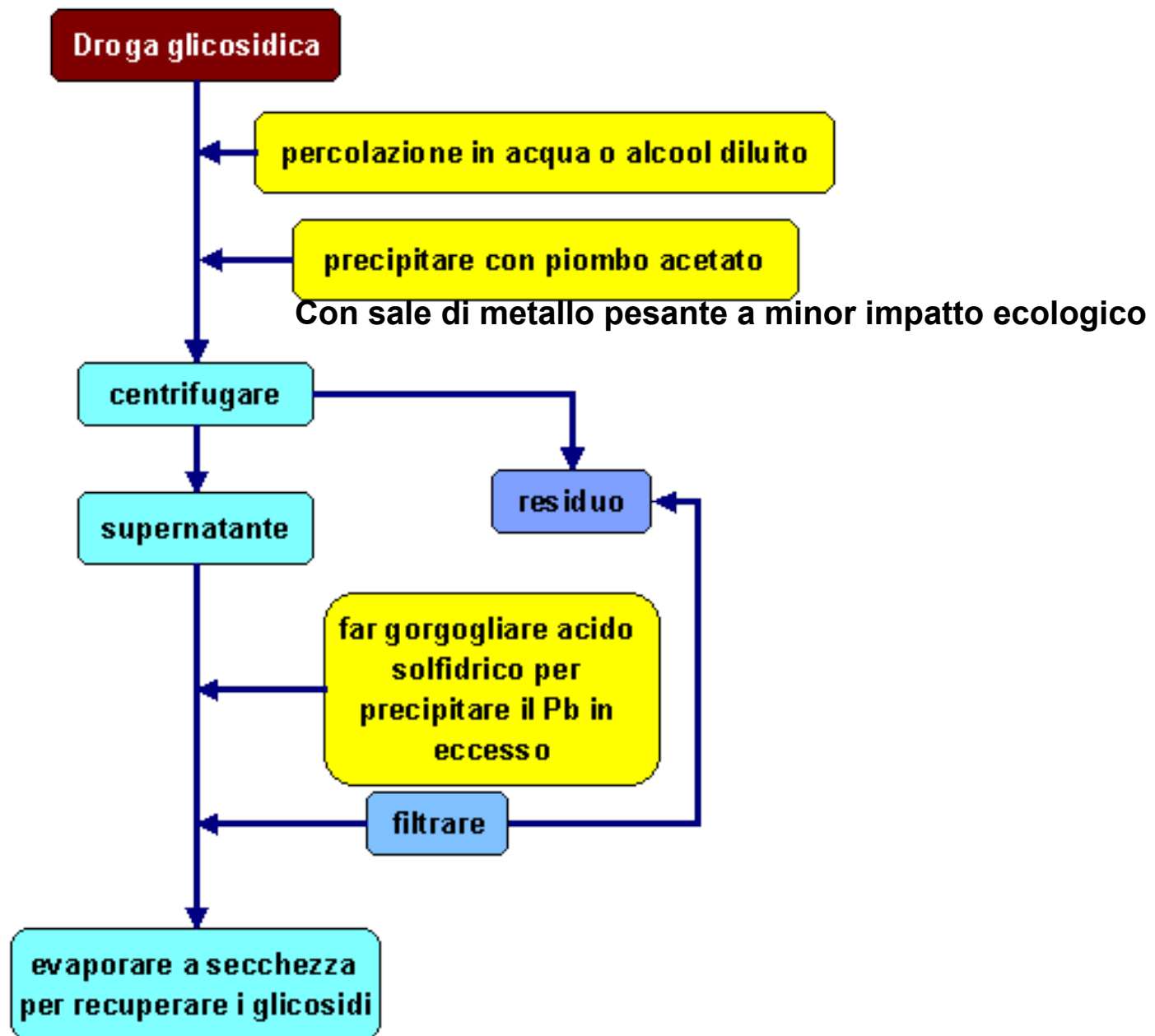
essiccazione

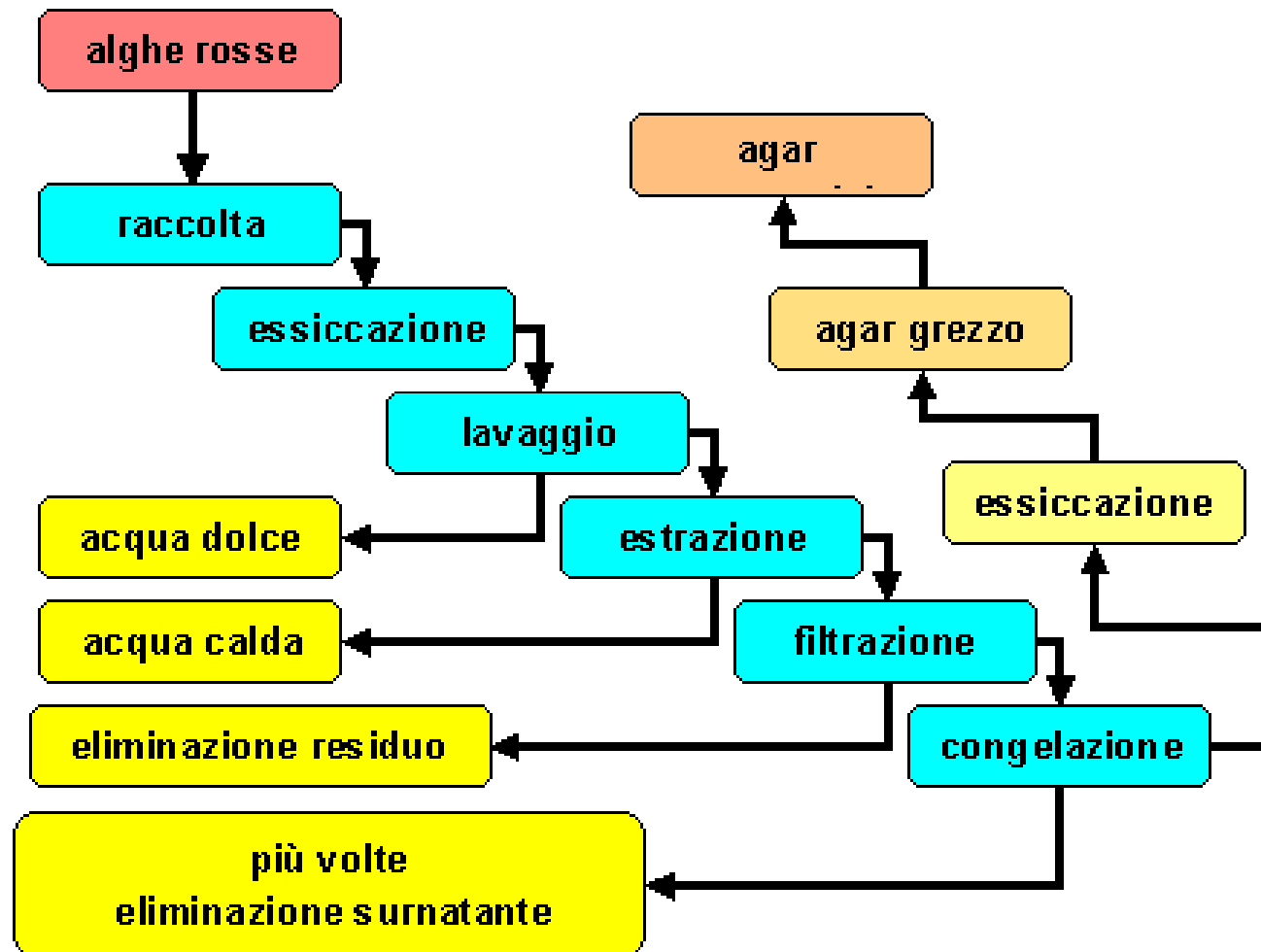
setacciamento

Tè puchong preparato alternando strati con fiori profumati. Usato in Cina e in occidente

Tè verde o cinese, assai profumato di debole consistenza







Metodi indagativi della qualità dei principi attivi estratti dalle droghe

