

Unidad 9.
Sistemas dispersos
heterogéneos II: emulsiones

1. Introducción

El uso de emulsiones es muy frecuente en la administración de medicamentos por vía oral (preparaciones orales), tópica (cremas y pomadas) y parenteral (para administrar alimentación con sustancias grasas). No obstante, en el campo de la formulación magistral el empleo de emulsiones se suele limitar a la vía tópica.

1. Introducción

1.1. Definición de emulsión.

Una **emulsión** es un sistema disperso heterogéneo formado por dos fases líquidas inmiscibles entre sí.

Esto significa que una de estas fases es **acuosa**, polar o hidrófila y la otra es **oleosa**, lipófila o apolar. Para que la fase acuosa y la oleosa permanezcan unidas de forma indefinida y no se separen, es necesaria la presencia de unas sustancias que se llaman agentes emulgentes, cuya función es mantener unidas de forma permanente las dos fases que forman una emulsión.

1. Introducción

1.1. Definición de emulsión.

En las emulsiones, una de las dos fases se encuentra dividida en forma de gotas muy finas en el seno de la otra.

El **tamaño** de las partículas de la fase interna de las emulsiones oscila entre **0,5 y 500 μm** .

La primera, la que forma gotas muy finas, se conoce como ***fase interna, discontinua o dispersa*** y la segunda, ***fase externa, continua o dispersante***.

1. Introducción

1.1. Definición de emulsión.

Las emulsiones tópicas pueden presentar diferente **viscosidad**.

Así, las cremas son semisólidas y las leches o lociones, líquidas.

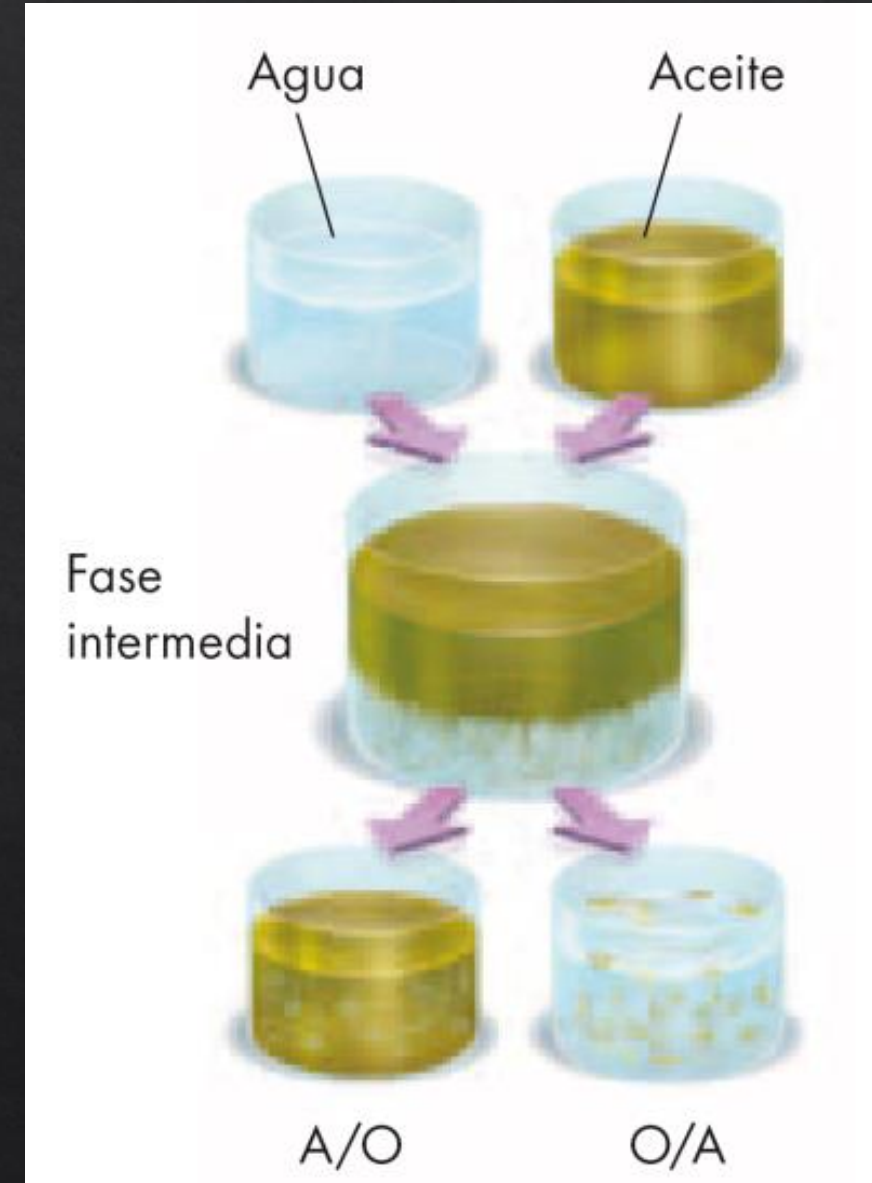
Esta característica determina la vía de administración.

1. Introducción

1.2. Tipos de emulsiones.

Las emulsiones se clasifican según el reparto y la distribución de las fases que las forman.

Su denominación se realiza citando, en primer lugar, la fase interna y, en segundo lugar y separado por una barra, la fase externa.



1. Introducción

1.2. Tipos de emulsiones.

Existen cuatro tipos principales de emulsiones:

1. Emulsión óleo/acuosa: O/A u O/W.
2. Emulsión acuo/oleosa: A/O o W/O.
3. Emulsiones acuo/silicónicas: A/S o W/S.
4. Microemulsiones: pueden ser A/O u O/A

1. Introducción

O/A O/W

1.2. Tipos de emulsiones. EMULSIÓN ÓLEO/ACUOSA.

- La fase externa, continua o dispersante es la acuosa.
- La fase interna, discontinua o dispersa es la fase oleosa.

La Real Farmacopea Española las llama cremas hidrófilas cuando son de uso tópico. Características:

- Su contenido en agua puede llegar hasta un 85 %.
- Son emulsiones lavables y que se adhieren a la piel.
 - Tienen bajo poder emoliente y se usan mucho en el tratamiento de procesos dermatológicos agudos.

1. Introducción

A/O W/O

1.2. Tipos de emulsiones. EMULSIÓN ACUO/OLEOSA.

- La fase externa es la oleosa.
- La interna es la acuosa.

Características:

- El contenido de la fase oleosa puede llegar hasta un 85 %.
- Las emulsiones A/O tienen un alto poder lubricante por su elevado contenido graso.
- Presentan acción emoliente y se usan en procesos dermatológicos crónicos.

1. Introducción

A/S W/S

1.2. Tipos de emulsiones. EMULSIÓN ACUO/SILICÓNICAS.

- La fase externa son derivados de la silicona .
- La interna es la acuosa.

Las emulsiones A/S son muy usadas para el tratamiento de pieles acneicas y grasas. La preparación de las emulsiones con silicona se realiza en frío, y son muy poco irritantes al aplicarlas sobre la piel lesionada.

En la elaboración de estas emulsiones no se pueden usar emulgentes de alto HLB (Equilibrio hidrófilo-lipofílico)y son incompatibles con sales y óxidos de metales.

1. Introducción

1.2. Tipos de emulsiones. MICROEMULSIONES.

Se caracterizan por el pequeño tamaño de la gota dispersa, debe ser $< 0,1 \mu\text{m}$.

Esto favorece la absorción del principio activo a través de la piel. Las microemulsiones pueden ser A/O u O/A, tienen consistencia líquida, se preparan en frío, y son poco viscosas y transparentes.

La elección del tipo de emulsión depende del uso final que se le vaya a dar:

- Para administración parenteral deben ser emulsiones O/A.
- Para administración oral de grasas se emplean emulsiones O/A.
- Para administración tópica se pueden utilizar emulsiones O/A o A/O, dependiendo de la afección que se vaya a tratar.

1. Introducción

1.3. Componentes de una emulsión

Las emulsiones pueden presentar distinta consistencia física, pero todas están formadas por tres partes:

1. Fase acuosa.
2. Fase oleosa.
3. Agentes emulgentes.

1. Introducción

1.3. Componentes de una emulsión

1. **FASE ACUOSA:** puede contener todos o sólo algunos de los siguientes componentes:
 - **Agua:** es el componente mayoritario y debe ser desionizada y purificada.
 - **Agentes humectantes:** facilitan la solubilidad de principios activos poco solubles y retienen la humedad de la piel una vez aplicado el producto.
 - **Conservantes antimicrobianos hidrosolubles:** evitan el crecimiento de bacterias y hongos. Se incorporan a la preparación en concentraciones bajas, entre el 0,1 % y 0,7 %. Los más usados son: Nipagín, Nipasol, Kathon CG[®], Phenonip[®], Dowicil 200[®] al 0,2-0,5 %.
 - **Antioxidantes:** se añaden si algún componente que se oxida fácilmente.
 - **Principios activos hidrosolubles:** aportan la acción farmacológica.

1. Introducción

1.3. Componentes de una emulsión

2. **FASE OLEOSA:** incluye todos o alguno de los siguientes componentes:

- **Aceites:** presentan acción emoliente sobre la piel. Los más usados: aceite de almendras dulces, de rosa mosqueta, de germen de trigo y de oliva.
- **Vaselina y parafinas:** ambos compuestos son emolientes y lubricantes de la piel. Se caracterizan por dejar una sensación grasa en ella.
- **Ceras:** son muy oclusivas y proporcionan brillo a las cremas, además aumentan la viscosidad de la fase oleosa.
- **Alcoholes grasos:** tienen acción emoliente y ayudan a estabilizar las emulsiones. El más empleado es el alcohol cetílico.



1. Introducción

1.3. Componentes de una emulsión

2. **FASE OLEOSA:** incluye todos o alguno de los siguientes componentes:

- **Ácidos grasos:** sustancias emolientes que actúan como espesantes de la fase oleosa. Destacan el ácido esteárico y el miristato de isopropilo.
- **Conservantes liposolubles:** como los aceites esenciales (el de lavanda, el de esucalipto, etcétera).
- **Antioxidantes liposolubles:** como la vitamina E, que es termosensible.
- **Siliconas:** protegen del frío y del viento. La más usada es la dimeticona.
- **Principios activos liposolubles:** se incorporan en esta fase.

1. Introducción

1.3. Componentes de una emulsión

3. AGENTES EMULGENTES:

Son compuestos químicos que contienen grupos polares o acuosos y apolares o lipídicos en la misma molécula, de forma que, por los grupos polares, se une a la fase acuosa y, por los grupos apolares, se une a la fase oleosa, manteniéndolas unidas. Si representamos la fase acuosa y la fase oleosa, vemos que al unirlas no encajan y, por lo tanto, permanecerán separadas.

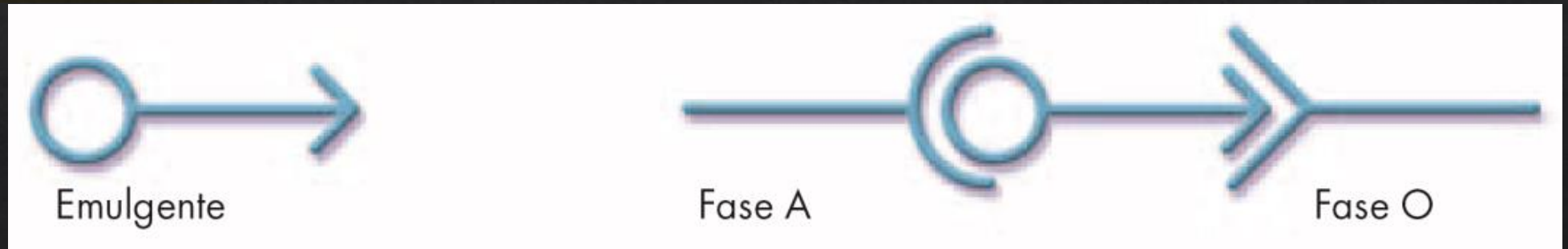


1. Introducción

1.3. Componentes de una emulsión

3. AGENTES EMULGENTES:

Al emplear un emulgente, su molécula se une por un extremo a la fase acuosa y por el otro a la fase oleosa, manteniéndolas unidas de forma permanente.



La proporción de los grupos hidrófilos y lipófilos presentes en la molécula de un emulgente se llama balance hidrófilo-lipófilo y se representa como HLB.

1. Introducción

1.3. Componentes de una emulsión

3. AGENTES EMULGENTES. Tipos según su composición química:

A. Emulgentes iónicos:

- **Aniónicos:** adquieren carga negativa en solución acuosa.
 - Jabones: sales sódicas o potásicas de ácidos grasos.
 - Laurilsulfato sódico: menos irritante que los jabones, se utiliza mucho en productos de higiene corporal.
- **Catiónicos:** tienen carga positiva en solución acuosa. El más usado es el cloruro de benzalconio, que se comercializa bajo el nombre registrado de *Armil*[®].
- **Anfóteros:** se ionizan de forma positiva o negativa según el pH de la solución acuosa donde se encuentran. Son muy poco irritantes y entre ellos destacan las *Tegobetaínas*[®].

1. Introducción

1.3. Componentes de una emulsión

3. AGENTES EMULGENTES. Tipos según su composición química:

B. Emulgentes NO iónicos:

Son los más usados en formulación magistral por ser muy estables, poco tóxicos y poco irritantes, y compatibles con muchos principios activos.

Los principales emulgentes no iónicos son:

- **Span®**: moléculas derivadas del sorbitol. Son predominantemente lipófilas, de HLB bajos (entre 3 y 9) y se emplean en la elaboración de emulsiones A/O.
- **Tween®**: derivados del polietilenglicol. Se emplean en la preparación de emulsiones O/A, pues su HLB oscila entre 8 y 16.

Ambas moléculas son largos polímeros y, según la longitud de la cadena, se denominan Span® o Tween® más un número.

1. Introducción

1.3. Componentes de una emulsión

3. AGENTES EMULGENTES. Tipos según su composición química:

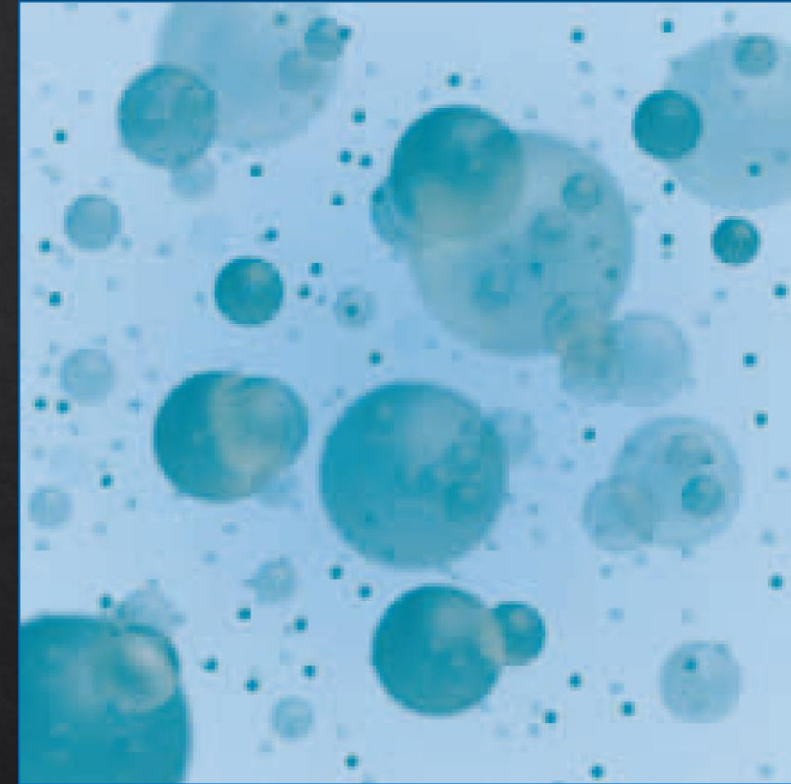
B. **Emulgentes NO iónicos:**

En ocasiones, no se dispone en la farmacia del emulgente con el HLB adecuado para elaborar una determinada fórmula magistral y es necesario mezclar dos emulgentes para obtener un emulgente con el valor de HLB deseado.

2. Estabilidad de las emulsiones.

La estabilidad de las emulsiones puede alterarse debido a varios factores y conduce a la rotura de la emulsión, con la consiguiente separación de las fases acuosa y oleosa.

Entre estos factores se encuentran los fenómenos de hidrólisis, oxidación o reacción entre sus componentes.



3. Ventajas del uso de emulsiones.

El uso de emulsiones en formulación magistral es muy habitual debido a sus **ventajas:**

- Se pueden **enmascarar** los caracteres organolépticos desagradables de principios activos o excipientes.
- Permite una **liberación controlada** del principio activo (p.a.) para obtener un efecto farmacológico mayor.
- Si se usan en tratamientos dermatológicos se pueden elaborar emulsiones de distinta consistencia según las necesidades del paciente.
- Se **aplican de forma muy sencilla** por vía tópica.
- Se pueden aplicar a la vez principios activos hidrosolubles y liposolubles, distribuyéndolos cada uno en la fase correspondiente.
- Los componentes de la fase oleosa presentan acción emoliente en piel y mucosas por sí mismos.

4. Errores más frecuentes en su elaboración y sus consecuencias.

- Defectuosa **fusión** de la fase oleosa. Si la fase oleosa no está perfectamente fundida y quedan restos sólidos, la emulsión no será homogénea y aparecerán restos oleosos sólidos en la emulsión final.
- Distinta temperatura en ambas fases al mezclarlas. Si las fases acuosa y oleosa no están perfectamente atemperadas y la fase acuosa está más fría que la oleosa, al mezclarlas se solidificarán pequeñas partículas de la fase oleosa y aparecerán como **grumos**. Si esta diferencia de temperaturas es muy marcada, puede ser imposible la unión de las fases.
- **Insuficiente agitación**. Si la agitación, sobre todo al principio, no es lo suficientemente enérgica, se puede producir una separación de las dos fases con la consiguiente rotura de la emulsión.