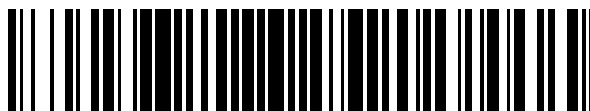


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 390 212**

51 Int. Cl.:

**A61K 8/92** (2006.01)

**A61K 8/97** (2006.01)

**A61Q 17/02** (2006.01)

**A61Q 17/04** (2006.01)

**A61Q 19/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **00989549 .1**

96 Fecha de presentación: **28.12.2000**

97 Número de publicación de la solicitud: **1250120**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **23.10.2002**

54 Título: **Sustancias ricas en productos insaponificables y métodos de uso de las mismas**

30 Prioridad:  
**01.01.2000 US 478071**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**07.11.2012**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**07.11.2012**

73 Titular/es:  
**INTERNATIONAL FLORA TECHNOLOGIES, LTD.  
(100.0%)  
291 East El Prado Court  
Chandler, AZ 85225, US**

72 Inventor/es:  
**BROWN, JAMES, H.;  
COPELAND, LEE, ROY;  
KLEIMAN, ROBERT;  
KORITALA, SAMBASIVARAO y  
CUMMINGS, MELANIE, K.**

74 Agente/Representante:  
**DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto**

ES 2 390 212 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

## DESCRIPCIÓN

Sustancias ricas en productos insaponificables y métodos de uso de las mismas.

Campo técnico de la invención

5 La presente invención se refiere al uso de una composición de una materia derivada de materiales naturales o extractos de materiales naturales. En particular, la invención se refiere al uso de portadores sustantivos derivados de aceite de yoyoba,

Antecedentes de la materia

10 Las grasas vegetales y animales son materiales lipídicos orgánicos que contienen generalmente ésteres de ácidos grasos de cadena larga y glicerina. En ciertas condiciones, estos ésteres reaccionan con agua (hidrólisis) formando un alcohol (glicerina) y ácidos grasos. (Hidrólisis es la escisión de un compuesto en sus componentes mediante la adición de agua y una enzima, ácido o base). Los resultados de una reacción de hidrólisis son conocidos como "hidrolizados". Cuando se calientan en presencia de un hidróxido alcalino, los ésteres anteriormente mencionados proporcionan jabón (la sal alcalina del ácido graso) y glicerina; este proceso de hidrólisis particular se denomina saponificación. "Saponificación" y "saponificar" se usan en la presente memoria de manera normal para indicar la reacción de hidrólisis entre una cera, aceite o grasa con un hidróxido de metal alcalino o metal alcalinotérreo, formando el correspondiente jabón de sal metálica. Estas grasas y aceites tienen un valor de saponificación que es el número de miligramos de hidróxido de potasio requeridos para la completa saponificación de un gramo de ácido orgánico libre y/o éster de ácido orgánico.

20 Los productos postsaponificación pueden ser hidrófilos (hidrosolubles) o hidrófobos (no hidrosolubles). En la presente memoria, se usará el término "insaponificable" para indicar aquellos materiales que, después de completar la reacción de saponificación, permanecen no hidrosolubles. Esto está totalmente de acuerdo con el Método Oficial Ca 6b-53 de la A.O.C.S., que define los materiales insaponificables como aquellas sustancias encontradas frecuentemente como componentes de grasas y aceites que no pueden saponificarse mediante el tratamiento cáustico habitual, pero que son solubles en grasas y aceites ordinarios. Se incluyen, pero sin limitación, en el grupo de materiales insaponificables los alcoholes alifáticos superiores, esteroides, pigmentos, aceites minerales e hidrocarburos. Los materiales insaponificables son generalmente no volátiles a 103°C. El porcentaje en peso de material insaponificable en una sustancia puede medirse directamente midiendo el porcentaje en peso de aquellos materiales definidos como insaponificables.

30 La mayoría de lípidos vegetales y animales bien conocidos tienen bajos niveles, menores del 5% en peso (<5%), de materiales insaponificables. Esto significa que la mayoría de los productos de la reacción de saponificación son hidrosolubles. Los aceites vegetales usados comúnmente tienen niveles de materiales insaponificables generalmente inferiores al 1%. Por ejemplo, la saponificación de aceite de soja deja un 0,7% en peso de materiales insaponificables, la saponificación de aceite de oliva deja un 1,2% en peso de materiales insaponificables y la saponificación de aceite de cacahuete deja un 0,4% en peso de materiales insaponificables. Sin embargo, algunos aceites comerciales contienen concentraciones mayores de productos insaponificables, de hasta un 6,0% en peso de productos insaponificables. Los ejemplos incluyen: aceite de salvado de arroz bruto: 4,2% de insaponificables, aceite de germen de trigo bruto: 6% de productos insaponificables y manteca de karité: 9-13% de productos insaponificables. Los materiales con altos niveles de productos insaponificables, tales como manteca de karité, no son un material de partida preferido para la producción de jabón debido a la alta cantidad de materiales insaponificables dejados después de la reacción de saponificación.

45 En la mayoría de casos, los productos de hidrólisis de un proceso de saponificación se usan únicamente con un solo fin, que es como agente higiénico de limpieza de la piel (jabón). En el pasado, el ingrediente básico del jabón era la grasa animal (también conocida como manteca o sebo), usando lejía basada en ceniza de madera en el proceso de saponificación. Idealmente, una pastilla de jabón tiene la dureza adecuada para maximizar los ciclos del usuario y tiene una cierta cantidad de resistencia a la reabsorción de agua cuando no está en uso, proporcionando el mismo tiempo suficiente formación de espuma (actuando como agente espumante) para potenciar la capacidad de limpieza del jabón. Los lípidos animales como ingrediente activo en el proceso de preparación de jabón satisfarán generalmente estas demandas del usuario en mayor o menor grado. La producción actual de jabón sigue basándose en gran medida en grasas animales en sus productos para satisfacer la demanda del consumidor y los requisitos de producción, aunque están empezando a encontrar uso más y diferentes tipos de materiales sintéticos en composiciones de jabón. Diversos compuestos sintéticos y mezclas de compuestos se han convertido en adiciones muy populares en la moderna tecnología de preparación del jabón por su mejora de la calidad del jabón y la satisfacción del usuario. Sin embargo, estos jabones de base sintética son generalmente resistentes a los procesos de degradación natural (concretamente biodegradabilidad) y son por tanto relativamente persistentes en el entorno.

55 Hay básicamente dos tipos distintos de procesos de fabricación del jabón. En un primer método, se hierven aceites y grasas en una caldera abierta con disoluciones alcalinas cáusticas, causando la saponificación gradualmente hasta que todas las grasas y aceites se saponifican completamente, seguido de la retirada de la glicerina. Este proceso puede realizarse en lotes o en un proceso continuo.

- En un segundo método, que es típicamente un método continuo (pero que puede realizarse en forma de lotes), se combinan ácidos grasos y bases en las porciones apropiadas para una saponificación completa en una válvula de mezclado u otro dispositivo que los ponga en contacto íntimo. La progresión de la saponificación depende de la temperatura, el tiempo de contacto y la eficacia del mezclado. Las disoluciones concentradas producidas por estos métodos se designan como jabones "puros" y poseen una concentración de 60-65% de jabón, aproximadamente 35% de agua y trazas de sal y glicerina. Es a partir de este producto que se producen los jabones para consumo en forma de pastillas, escamas, gránulos y polvos, secando en primer lugar el jabón puro en gránulos que tienen un contenido de humedad de aproximadamente 12-16%, seguido de etapas de acabado tales como molienda, extrusión, amalgamamiento y similares.
- Los jabones en pastilla para consumo se fabrican hoy en día a partir de aceite de coco y/o sebo o sus ácidos grasos. El aceite de semilla de palma sustituye a veces al aceite de coco por razones económicas, y los jabones preparados con aceite de semilla de palma se ajustan a características de actuación similares a las formulaciones de sebo/coco no sustituidas. El aceite de palma sustituye a menudo también al sebo.
- Es una consideración en la selección de materiales para preparar jabones la relación apropiada de ácidos grasos saturados frente a no saturados y de cadena larga frente a cadena corta que da como resultado un jabón que tiene las cualidades deseadas de estabilidad, solubilidad, facilidad de formación de espuma, dureza, capacidad limpiadora y similares. Se ha determinado que los jabones preparados a partir de mezclas de ácidos grasos en los que una mayoría de los ácidos grasos en las mezclas tiene cadenas carbonadas menores de 12 átomos irritan la piel. Los jabones preparados a partir de ácidos grasos saturados  $C_{16}$  y  $C_{18}$  son típicamente demasiado insolubles para uso por el consumidor. Por tanto, los materiales preferidos para la producción de jabón tienen cadenas de ácido graso de entre 12 y 18 átomos de carbono de longitud.
- La saponificación de sebo produce un jabón que comprende una mezcla de ácidos grasos  $C_{14:0}$ ,  $C_{16:0}$ ,  $C_{18:0}$  y  $C_{18:1}$  (ácidos mirístico, palmítico, esteárico y oleico, respectivamente) y la saponificación del aceite de coco produce un jabón que comprende una mezcla de ácidos grasos  $C_{12:0}$  y  $C_{14:0}$  (ácido láurico y ácido mirístico, respectivamente) y cantidades significativas de ácidos grasos  $C_{8:0}$  y  $C_{10:0}$ . Las preparaciones de jabón para consumo contienen habitualmente intervalos de relación de sebo/coco (S/C) de aproximadamente 90:10 a 75:25. Puesto que el ácido láurico se encuentra solo en la fracción de coco de las mezclas de S/C, el cambio más drástico observado al aumentar el porcentaje de la fracción de coco de las mezclas de S/C es el aumento de ácido láurico. Aumentar la fracción de coco en jabones que contienen ácidos grasos de S/C mejora generalmente las características de espumación deseables de dichos jabones. Sin embargo, en jabones con relaciones de S/C de 50:50, se reducen las propiedades de suavidad para la piel deseables.

Se da a continuación la distribución típica de ácidos grasos (en porcentaje en peso) de los principales componentes de preparación del jabón:

Longitud de la cadena carbonada	Sebo	Palma	Coco	Semilla de palma
10:0 (cáprico)	0,1	0,0	15,1	6,4
12:0 (láurico)	0,1	0,3	48,0	46,7
14:0 (mirístico)	2,8	1,3	17,5	16,2
16:0 (palmítico)	24,9	47,0	9,0	8,6
18:0 (esteárico)	20,4	4,5	9,0	8,6
18:1 (oleico)	43,6	36,1	5,7	16,1
18:2 (linoleico)	4,7	9,9	2,6	2,9
18:3 (linolénico)	1,4	0,2	0,0	0,0
20:0 (araquídico)	1,8	0,3	0,0	0,4

- A partir de la tabla, puede observarse que las grasas de coco y semilla de palma (ambas conocidas como grasas láuricas) son particularmente ricas en los ácidos grasos saturados  $C_{10-14}$ , particularmente derivados del ácido láurico mismo. Otra grasa que contiene ácidos grasos saturados de cadena relativamente corta similar al aceite de coco es el aceite de babasú. En contraposición, el sebo y aceite de palma *per se* son fuentes industriales de grasas no láuricas, especialmente de aquellas que contienen ácidos grasos  $C_{16}$  y  $C_{18}$ .
- En general, las sales alcalinas de ácidos grasos de cadena larga, particularmente las sales menos caras de  $C_{16}$  y  $C_{18}$  (obtenidas a partir de aceites de sebo y palma) proporcionan estructura a las pastillas de jabón acabado y evitan

o retardan la disgregación de la pastilla de jabón tras exposición a agua. Las derivadas de grasa láurica de cadena más corta más caras (concretamente sales de ácido láurico) y otras sales solubles (obtenidas típicamente a partir de aceite de coco y de semilla de palma) contribuyen a las propiedades de formación de espuma de la composición global. Ha sido un problema general en la formulación del jabón encontrar el equilibrio entre proporcionar estructura (obtenida generalmente a partir del componente de cadena larga) y mantener las propiedades de formación de espuma (obtenidas generalmente a partir del componente de cadena corta más caro) a un coste global práctico.

Además de sales de ácido graso, las pastillas de jabón contienen ácidos grasos libres. La adición de ácidos grasos libres es conocida como "sobreengrasado". El sobreengrasado a un nivel de ácidos grasos libres de 5-10% es conocido por dar una formación de espuma copiosa y cremosa. Otros agentes sobreengrasantes usados incluyen ácido cítrico y otros ácidos que funcionan promoviendo la formación de ácidos grasos libres en la combinación de grasas.

Para la fabricación de tortas de jabón, pueden añadirse aditivos comunes al jabón de base en las cantidades normales, referidas a 100 partes en peso de jabón de base, tales como agentes sobreengrasantes (1 a 3% en peso), estabilizantes (antioxidantes, agentes complejantes) (0,05 a 0,5% en peso), perfumes (0,5 a 3% en peso) y posiblemente tintes (0,05 a 0,3% en peso), así como agentes protectores de la piel tales como sorbitol, glicerina o similares (1 a 5% en peso).

Las industrias farmacéutica y cosmética han usado extractos grasos de origen vegetal desde antiguamente. Hace unos años, resultó evidente en estas industrias que resultaban propiedades biológicas particularmente valiosas del uso de grasas vegetales o extractos de grasas vegetales ricos en materiales insaponificables. Ciertos aceites vegetales, por ejemplo de aguacate y en particular manteca de karité, son conocidos por ser particularmente ricos en materiales insaponificables y/o por contener estos materiales insaponificables.

Se describe un proceso para enriquecer los productos insaponificables en aceites, especialmente manteca de karité, para uso en composiciones cosméticas y farmacéuticas en la patente de EE.UU. nº 5.679.393, expedida a Laur. Este proceso concentra la fracción insaponificable de grasas y aceites mediante procesos de cristalización y fraccionamiento. Este método es caro y no libera el resto alcohólico de los compuestos de partida (hidrólisis). Por tanto, el proceso de Laur y los métodos de uso de los productos del mismo nunca utilizan la hidrólisis para crear sales alcalinas y liberar alcoholes y otros productos insaponificables.

Los hidrolizados aplicados por vía tópica a objetos animados e inanimados encuentran uso en numerosos campos distintos de la limpieza del grupo de preparaciones cosméticas, productos farmacéuticos, formulaciones de hidratación, insecticidas, repelentes de insectos y similares. Uno de los campos de interés creados por los variados usos de los agentes aplicados por vía tópica es maximizar la duración en que un agente activo aplicado por vía tópica está presente sobre la superficie aplicada (sustantividad). Como resultado de este intenso interés, la búsqueda de modos de mejorar la duración de una cantidad fija de agentes cosméticos, farmacéuticos y bioactivos aplicados por vía tópica ha sido de capital importancia en todos los campos en los que se emplean agentes cosméticos, farmacéuticos y bioactivos aplicados por vía tópica. Puede encontrarse un ejemplo de este interés en la técnica anterior relacionada con las composiciones protectoras solares.

El uso de composiciones protectoras solares es necesario para un gran segmento de la sociedad, puesto que solo una pequeña porción de los expuestos a la luz del sol tiene la pigmentación natural que proporciona protección frente a los efectos dañinos de la radiación solar. Debido a que mucha gente muestra eritema incluso tras exposiciones cortas a la luz solar, existe la necesidad de composiciones protectoras solares que protejan ante el eritema causado por radiación, concretamente radiación ultravioleta, de modo que sea posible una exposición más larga a la luz solar con menos riesgo de quemadura solar.

Son conocidas en la materia una variedad de composiciones protectoras solares. Una tendencia en la formulación de composiciones protectoras solares ha sido preparar composiciones que sean resistentes al agua en la piel. Un método es modificar químicamente el absorbente ultravioleta para aumentar su interacción con la piel cuaternizando imidazoles, como se describe en la patente de EE.UU. nº 3.506.758; otro método es copolimerizar monómeros absorbentes de luz ultravioleta con otros monómeros formando películas resistentes al agua, como se describe en las patentes de EE.UU. nº 3.529.055 y 3.864.473; aún otro método es formar películas poliméricas con polímeros no hidrosolubles, como se describe en la patente de EE.UU. nº 3.784.488.

El uso de la forma ácida de copolímeros de etileno-anhídrido maleico reticulados para retener los absorbentes de luz ultravioleta se da a conocer en la patente de EE.UU. nº 3.821.363. Se da a conocer el uso de un polímero de acrilato no hidrosoluble que tiene un parámetro de solubilidad de 6 a 10 en disolventes de unión débil a hidrógeno en la patente de EE.UU. nº 4.172.122. Se da a conocer el uso de materiales de poliamida no hidrosolubles, solubles en alcohol y formadores de película en la patente de EE.UU. nº 3.895.104 únicamente con el fin de proporcionar una sustentividad mejorada.

Los cosméticos y otras aplicaciones de la técnica anterior no han utilizado hasta ahora la sustentividad inherente a los hidrolizados de materiales derivados naturales que contienen sustancias ricas en productos insaponificables o

ésteres de cadena larga (de más de 18 carbonos de longitud) para potenciar la sustentividad intrínseca de los agentes aplicados por vía tópica a los que se incorporan. Anteriormente, el fin de emplear polímeros o materiales poliméricos en las composiciones de la técnica anterior se ha dirigido a mejorar la adherencia, concretamente la sustentividad, del material tópico en la piel, o se han empleado únicamente como agentes espesantes. La sustentividad mejorada, entre otras propiedades, conseguida empleando los hidrolizados según la presente invención no se ha dado a conocer ni apreciado hasta ahora en la técnica anterior.

La sustentividad aumentada de agentes aplicados por vía tópica proporciona un uso más eficaz y económico de dichos materiales.

#### Sumario de la invención

La presente invención se refiere al uso de una composición que comprende una mezcla de sales hidrófilas polares (saponificables) y materiales lipófilos no polares (insaponificables) como composición portadora para aplicación tópica de ingredientes cosméticos o farmacéuticos,

en la que la composición se produce mediante la reacción de hidróxidos de metales alcalinos acuosos con una composición lipídica orgánica que contiene una proporción de material insaponificable de más de un 6% en peso, basada en el peso total de la composición lipídica orgánica y

en la que la composición lipídica orgánica es aceite de yoyoba.

La hidrólisis de materiales con altos niveles de materia insaponificable, tales como extractos de plantas, da como resultado productos con propiedades únicas. Los productos tradicionales de saponificación de aceites naturales funcionan así como resultado directo del bajo nivel de productos insaponificables contenidos en los mismos (como se discute anteriormente). Dichas propiedades incluyen altos niveles de actividad tensioactiva acuosa, hidrosolubilidad o fácil dispersabilidad en agua, actividad como agentes espumantes y similares. El objetivo mismo de los procesos de saponificación tradicionales es aumentar la hidrosolubilidad y actividad tensioactiva de materiales de origen natural. Se ha encontrado que la aplicación de hidrólisis a aceite de yoyoba con una fracción alta de productos insaponificables (por ejemplo, al menos un 6% del peso total del material) en combinación con una fracción saponificable, produce un hidrolizado con propiedades que son significativamente diferentes de las de los productos resultantes de la saponificación convencional de materiales con menos de 6% en peso de productos insaponificables.

Los productos resultantes usados según la presente invención son sustantivos, resistentes al agua, evitan la absorción indeseada de un ingrediente activo portado por la superficie aplicada, exhiben una funcionalidad tensioactiva única y no son agentes espumantes con agua. Se han encontrado algunos usos inesperados para los hidrolizados resultantes como emoliente y/o agente portador natural alternativo para la aplicación tópica de productos cosméticos y farmacéuticos, particularmente a la piel de sujetos, y proporcionan un apoyo sustantivo para los materiales portados.

Los rasgos novedosos que se consideran característicos de la invención se exponen particularmente en la reivindicación adjunta.

#### Descripción de los dibujos

La Figura 1 es una gráfica de los efectos del hidrolizado cuando se usa con una loción hidratante.

La Figura 2 es una gráfica de los efectos del hidrolizado cuando se usa con maquillaje.

La Figura 3 es una ilustración del porcentaje medio de reducción de moscas cuando el pulverizador matamoscas incorpora los hidrolizados según la presente invención.

La Figura 4 es la gráfica de la reducción de moscas por Aquapel cuando incorpora los hidrolizados de la presente invención.

La Figura 5 es la gráfica de la reducción de moscas por Ceratex cuando incorpora los hidrolizados de la presente invención.

La Figura 6 es la gráfica de la reducción de moscas por GnatAway cuando incorpora los hidrolizados de la presente invención.

La Figura 7 es la gráfica de la reducción de moscas por Solitude cuando incorpora los hidrolizados de la presente invención.

La presente invención está dirigida al uso de una composición que comprende una mezcla de sales hidrófilas (saponificables) y materiales lipófilos no polares (insaponificables) como composición portadora para la aplicación tópica de ingredientes cosméticos o farmacéuticos,

en la que la composición se produce mediante la reacción de hidróxidos de metales alcalinos acuosos con una composición lipídica orgánica que contiene una proporción de material insaponificable de más de un 6% en peso, basada en el peso total de la composición lipídica orgánica, y

en la que la composición lipídica orgánica es aceite de yoyoba.

- 5 Adicionalmente, la composición es útil para portar una cantidad eficaz de materiales activos aplicados por vía tópica. Más específicamente, la composición a usar según la presente invención proporciona un agente portador para la aplicación tópica de materiales cuando se requiere una capacidad de "aguante" o sustentividad superior. Adicionalmente, la presente invención es útil porque, entre otras cosas, actúa tanto como emoliente como emulsionante único y demuestra sustentividad; tiene la capacidad de "fijar" muchos tipos diferentes de materiales
- 10 "activos", desde protectores solares a preparaciones farmacéuticas, sobre cualquier superficie animada o inanimada aplicada.

Con los fines de esta invención, deben considerarse las siguientes definiciones:

- 15 Los "materiales ricos en productos insaponificables" o aceites, ceras, grasas y similares "de alto contenido en productos insaponificables" significan composiciones que comprenden al menos un 6% en peso de materiales orgánicos totales que son insaponificables y al menos un 10% en peso de materiales orgánicos que son saponificables (es posible que el porcentaje de productos insaponificables pueda incluso superar el 95% en algunas formulaciones). Por lo tanto, el término incluye composiciones que contienen de 6-90% en peso de materiales orgánicos insaponificables y de 10-94% en peso de materiales saponificables. Se enumeran en la tabla siguiente ejemplos de materiales de base biológica ricos en productos insaponificables.

Material	% de productos insaponificables
Aceite de semilla de amaranto	9%
Aceite de semilla de anís	7%
Aceite de semilla de aguacate	57%
Aceite de cebada	6%
Aceite de briza	78%
Aceite de trigo sarraceno	7%
Cera de candelilla	65-75%
Cera de carnauba	50-55%
Aceite de <i>Cassia occidentalis</i> (café silvestre)	7%
Aceite de semilla de café	8%
Lecitina desaceitada	32% (en teoría)
Aceite de cazón	16-18%
Cera de esparto	42-49%
Aceites de hongos y otros microorganismos	6% o más
Guayule (extracto de material vegetal)	8-12%
Aceite de yoyoba	45%
Aceite de jurinea	40%
Lanolina	39%
Aceite de laurel	6%
Olestra™ u Olean™	33% (aproximación)
Concentrado de aceite de oliva (fitoesqualeno)	35-75%
Aceite de oliva	Más de 6%

Aceite de reloj anaranjado	40%
Cera de Ouricuri	50-55%
Aceite de semilla de quinoa	6%
Aceite de germen de centeno	11%
Aceite de hígado de tiburón	60%
Manteca de karité	9-13%
Aceite de esperma de ballena	36%
Cera de caña de azúcar	18-80%
Cera de girasol	25-45%
Aceite de resina	9-23%
Destilado de aceite de resina	25-33%
Vegepure™ de granos de trigo	70-90%
Aceite de germen de trigo	6%

Según la presente invención, se usa aceite de yoyoba.

5 “Sustantividad” significa la tendencia de un material a resistirse a ser retirado fácilmente o la persistencia de un tratamiento sobre la piel. Por ejemplo, algunas lociones protectoras solares son sustantivas porque forman una película sobre la piel que es relativamente no hidrosoluble. Esto significa entonces que los materiales sustantivos resisten la retirada o transferencia mediante contacto físico, sudor o lavado.

10 El aceite de yoyoba se somete a una reacción de hidrólisis alcalina para producir una composición sustantiva no espumante con propiedades tensioactivas únicas que se usa como composición portadora para la aplicación de otros ingredientes activos, por ejemplo, como base portadora para la aplicación de ingredientes cosméticos y farmacéuticos.

15 El lípido sometido al proceso de la invención puede ser un producto bruto o puede experimentar también diversas etapas de refinado y/o modificación previamente. Los ejemplos de procesos de refinado que pueden mencionarse son los procesos convencionales de refinado químico o físico o los procesos más especializados para el refinado de manteca de karité, que hacen posible en particular retener o concentrar la cantidad máxima de materiales insaponificables, sometiendo después de ello dichos materiales tratados al proceso de la presente invención.

El refinado químico que se usa preferiblemente, que se aplica a las grasas vegetales antes que se sometan al proceso según la presente invención, puede ser cualquier proceso de refinado químico convencional, en particular cualquier proceso que comprenda las siguientes etapas:

20 Etapa 1: Desgomado que implica la insolubilización de fosfatidas con agua, generalmente en presencia de ácido, lo más frecuentemente ácido fosfórico, y separación por decantación o centrifugación (proceso continuo);

Etapa 2: neutralización de los ácidos grasos en el aceite mediante la adición de una disolución de hidróxido de sodio y la separación de los jabones formados (denominados pasta de neutralización), lo más frecuentemente mediante centrifugación, seguido de varios lavados con agua, efectuándose las etapas 1 y 2 a menudo simultáneamente en un proceso continuo;

25 Etapa 3: decoloración con arcillas blanqueadoras activadas a aproximadamente 100°C a vacío reducido, y filtración;

Etapa 4: operación de desodorización necesaria para retirar los compuestos responsables de los olores y aromas del aceite y para producir aceite refinado. Esta operación se lleva a cabo en un aparato denominado desodorizante, implicando el procedimiento calentar el aceite a alta temperatura (180-220°C) a un vacío del orden de aproximadamente 532 Pa) y una inyección masiva de vapor para eliminar impurezas.

30 Se entiende un método de refinado físico alternativo como una variante del proceso de refinado químico explicado anteriormente, siendo la diferencia que no se efectúa la etapa de neutralización con hidróxido de sodio y que la retirada de los ácidos grasos libres del aceite se efectúa durante la etapa de desodorización. Las condiciones de refinado seleccionadas durante este método de refinado físico pueden requerir modificación para retener las

propiedades deseadas de las sustancias ricas en productos insaponificables seleccionadas para uso durante el procedimiento de preparación de la presente invención.

5 Los extractos usados como materiales de partida para la reacción de hidrólisis según la presente invención pueden estar en estado bruto o refinado. Los extractos pueden estar también alcoxilados, polimerizados, acetilados, oxidados, reducidos, concentrados, hidrogenados, parcialmente hidrogenados, interesterificados, modificados en el doble enlace, aleatorizados, refinados o modificados de otro modo antes de la reacción de hidrólisis. Puesto que muchos lípidos tienen bajas concentraciones o fracciones (por ejemplo, 1% o menos, como se discute anteriormente) de productos insaponificables, la presente invención engloba la concentración de bajas fracciones de productos insaponificables a fracciones mayores, concretamente mayores de 6%.

10 Los productos de la reacción de hidrólisis de materiales orgánicos que producen productos insaponificables comprenden una mezcla de: a) sales hidrófilas polares (saponificables) y b) materiales lipófilos no polares (insaponificables), con la posibilidad de que estén presentes también otros materiales, dependiendo de la fuente, estado y forma del reactante inicial.

15 La composición de los materiales a usar según la presente invención se produce mediante la reacción de hidróxidos de metales alcalinos acuosos, por ejemplo, NaOH, LiOH, KOH (el hidróxido preferido), CaOH, MgOH y similares con aceite de yoyoba.

20 El aceite de yoyoba refinado contiene diversas proporciones de ésteres diinsaturados de cadena larga. Los hidrolizados de aceite de yoyoba refinado son una mezcla casi 55:45 de sales hidrófilas polares de cadena larga (sales alcalinas) y materiales lipófilos relativamente no polares (alcoholes grasos). La fracción lipófila es los materiales insaponificables según la definición usada en este documento. Las longitudes de la cadena carbonada de ambos de estos hidrolizados de yoyoba incluyen, y varían, de C<sub>18</sub> a C<sub>24</sub> y tienen dobles enlaces ω-9 como parte de cada molécula. Se ha encontrado que la combinación de fracciones saponificables e insaponificables de los hidrolizados según la presente invención tiene propiedades que ayudan a la formulación de composiciones cosméticas, farmacéuticas y otras.

25 Los productos que resultan de la hidrólisis de aceite de yoyoba, creados durante la práctica de la presente invención, usados puros, combinados, disueltos, dispersados o emulsionados con excipientes, disolventes o portadores, pueden contener y conferir propiedades útiles para las superficies aplicadas.

30 Una de las propiedades anteriormente mencionadas, la sustantividad, es particularmente útil en el campo de las barras de labios, champúes, acondicionadores, abrillantadores, repelentes, atractores, cosméticos, productos farmacéuticos y protectores solares. La propiedad de sustantividad es especialmente beneficiosa para productos para el cuidado del cabello, tales como acondicionadores del cabello "sin aclarado", en que son particularmente deseables comercialmente materiales derivados naturales que exhiban sustantividad. La sustantividad es también particularmente útil como protectores solares, bloqueantes solares o formulaciones de bronceado, así como repelentes de insectos tales como repelentes de garrapatas, pulgas y moscas.

35 Se especula que la inclusión de altos niveles de materiales insaponificables en el material orgánico posibilita que los hidrolizados según la presente invención exhiban su combinación única de propiedades.

La composición a usar según la presente invención se produce preferiblemente en un proceso en lotes usando una caldera de vapor grande equipada con un agitador de paletas.

40 Se añade una cantidad medida de gránulos de hidróxido de potasio a la caldera de vapor con una cantidad medida de agua destilada, desionizada o purificada por ósmosis inversa. La cantidad de hidróxido de potasio empleada para saponificar completamente el ácido orgánico libre y/o éster de ácido orgánico puede calcularse por consiguiente a partir del valor de saponificación del material de partida y será, en teoría, la cantidad estequiométrica. Sin embargo, en la práctica, se emplea preferiblemente ligeramente menos que la cantidad estequiométrica de hidróxido de potasio para asegurar que los hidrolizados que se forman no se contaminan con la base no usada. La cantidad de hidróxido de potasio empleada puede ser considerablemente menor que la cantidad estequiométrica, por ejemplo, 45 puede usarse tan solo el 50% de la cantidad estequiométrica o menos, dependiendo del resultado deseado. Sin embargo, ha de entenderse que puede emplearse una cantidad de hidróxido de potasio en exceso de la cantidad estequiométrica, por ejemplo hasta un 10% más que la cantidad estequiométrica, si se va a conseguir la saponificación completa del ácido orgánico o éster. El hidróxido de potasio en exceso restante al final de la reacción 50 puede retirarse mediante métodos convencionales.

Los gránulos de hidróxido de potasio y el agua se agitan conjuntamente con el agitador de paletas hasta que se disuelven los gránulos de hidróxido de potasio. Es importante observar, con fines de seguridad, que se genera calor durante esta etapa y que la mezcla es bastante cáustica. Los individuos cercanos deben llevar guantes, protección para ojos y cara y prendas protectoras para evitar quemaduras, tanto térmicas como químicas.

55 A continuación, se añade suavemente una cantidad medida de material orgánico refinado o derivado que contiene una alta proporción de productos insaponificables, a saber aceite de yoyoba, a la caldera de vapor, teniendo cuidado de no salpicar la disolución cáustica contenida en la misma.



Se calienta la caldera de vapor a 90-95°C y se mantiene en ese intervalo de temperatura con agitación constante durante 2 horas. En este punto, debe ensayarse el pH de la mezcla resultante. Si el pH de la disolución es mayor de 10,0, se continúa calentando la mezcla con agitación constante a 90-95°C. Se vuelve a ensayar la disolución periódicamente hasta que el pH es 10,0 o menor.

- 5 Una vez el pH es 10,0 o menor, se extrae una muestra para análisis. Esta muestra debe analizarse mediante métodos tales como cromatografía, o mediante otro método similar, para mostrar que la reacción ha transcurrido como se deseaba.

10 El hidrolizado resultante puede diluirse entonces añadiendo una segunda cantidad medida de agua, u otro diluyente, a la caldera de vapor y agitando con el agitador de paletas. El calor debe aplicarse continuamente, a menos de 80°C, hasta que la mezcla sea homogénea.

Una vez homogeneizada, se enfría la mezcla de hidrolizado a 60°C siguiendo con el mezclado con el agitador. La mezcla de hidrolizado puede transferirse entonces a un envase contenedor y dejarse enfriar a temperatura ambiente antes de sellar el envase contenedor.

15 La emulsificación es el proceso de dispersar un material por otro en gotas separadas y, con fines industriales, efectuar una dispersión que retendrá sus características físicas durante un periodo de uno a dos años al menos. La influencia del tipo de emulsionante seleccionado para uso está relacionada con la relación de carácter hidrófilo y lipófilo expresada por el emulsionante con referencia al carácter similar, aunque recíproco, del aceite que se está emulsionando. Estas dos propiedades se han denominado equilibrio hidrófilo-lipófilo (EHL) del emulsionante y EHL necesario del aceite. El sistema EHL es de ayuda para el formulador de emulsiones con el fin de emparejar el emulsionante apropiado con un aceite dado. Este emparejamiento habitualmente se realiza experimentalmente, sin embargo, cuando el EHL de un emulsionante y el EHL necesario de un aceite dado son conocidos, esta experimentación puede reducirse en gran medida. El EHL de la presente invención exhibe la propiedad única de tener una amplitud de 3 a 4 números de EHL y en el intervalo hidrófilo. Un emulsionante con un intervalo eficaz amplio de EHL es ventajoso debido a la flexibilidad conferida inherentemente por dicho emulsionante. El intervalo eficaz de EHL amplio de la presente invención proporciona también formulaciones con un margen extra para tratar con condiciones inhabituales tales como pH, calor, frío y similares que puedan encontrarse en la distribución normal de productos cosméticos, farmacéuticos y otros bioactivos.

20 Se observó durante un experimento que cuando se diluía un repelente de moscas concentrado (Purina Horse Spray Concentrate Insecticide) según las instrucciones, la mezcla resultante se separaba y requería reintegración con agitación antes del uso. Esta separación de componentes se eliminaba mediante la adición del hidrolizado según la presente invención, demostrando por tanto la propiedad de emulsificación única del hidrolizado.

#### Aplicabilidad industrial

Se describen a continuación varios usos ejemplares encontrados para los hidrolizados según la presente invención.

##### Ejemplo 1. Hidratación cutánea potenciada

35 Un Nova Meter es un dispositivo medidor de la impedancia que se diseña y se usa habitualmente para proporcionar un método no invasivo objetivamente reproducible de medida de la cuantificación de un carácter biofísico relativo a la hidratación de la piel. Diez panelistas participaron en un estudio de hidratación cutánea que utilizó un Nova Meter para registrar y almacenar los resultados. El ensayo se realizó según el siguiente procedimiento.

40 Se adquirió una loción cutánea comercialmente disponible y se dividió en partes iguales. Se usó la mitad como control y se usó la otra mitad como base a la que se incorporó un 5% de aceite de yoyoba. El hidrolizado de yoyoba se preparó según el método dado a conocer en esta invención. Se tomó una lectura de hidratación cutánea como valor de referencia con el Nova Meter para cada panelista antes de cada aplicación de loción. Se aplicaron las lociones de control y que contienen hidrolizado en diferentes zonas del antebrazo de cada panelista. Se aplicó la loción que contiene hidrolizado en el antebrazo derecho y se aplicó la loción de control en el antebrazo izquierdo. Se usó el Nova Meter para tomar lecturas de hidratación cutánea de las zonas del antebrazo en las que cada participante se había aplicado cada loción. Se tomaron múltiples lecturas de hidratación cutánea y se almacenaron a intervalos de 2 horas después de la aplicación de loción. Se ilustran los resultados en la Figura 1.

50 El experimento dio como resultado un aumento drástico de la hidratación cutánea para la mayoría de los sujetos de ensayo en las zonas de ensayo en que se aplicó la formulación de hidrolizado, en comparación con las zonas de ensayo de la formulación de control. En general, de 6 a 10 horas después de la aplicación, la formulación de loción de hidrolizado demostró de 20 a 54% de mejora en la hidratación cutánea frente a las zonas del valor de referencia. La formulación de hidrolizado mostró un 10 a 47% de mejora en la hidratación cutánea frente a la piel tratada con la formulación de control.

Ejemplo 2- Reduce la deshidratación

Se prepararon dos fórmulas de maquillaje: una formulación de hidrolizado que contiene un 5% de hidrolizado según la presente invención y una formulación de control que contiene un 5% extra de agua. Se añadió el 5% de agua a la formulación de control para mantener las composiciones de ingredientes restantes iguales entre las dos formulaciones. Se aplicó la formulación de control en el antebrazo izquierdo y se aplicó la formulación de hidrolizado en el antebrazo derecho.

Se usó un Nova Meter para tomar lecturas de hidratación como valor de referencia de cada participante antes de la aplicación de maquillaje y para tomar lecturas de hidratación a intervalos de 4 a 7 horas después de la aplicación de cada formulación. Se promediaron los resultados para cada persona usando lociones de control y que contienen hidrolizado para determinar la diferencia porcentual en la hidratación cutánea con el valor de referencia. Los resultados se muestran en la Figura 2.

A las 4 horas después de la aplicación de maquillaje, las lecturas de Nova Meter medias de los participantes mostraron un aumento de la hidratación cutánea de aproximadamente un 5% frente al valor de referencia en zonas en que se había aplicado la formulación de hidrolizado. Se observó una reducción de la hidratación cutánea de aproximadamente un 4% frente al valor de referencia en las zonas con la formulación de control. La diferencia entre las formulaciones de hidrolizado y control fue aproximadamente de 9%, mostrando la formulación de hidrolizado mejores propiedades de hidratación. De hecho, la formulación de control mostró deshidratación cutánea, lo que no es inusual para formulaciones cosméticas altamente pigmentadas tales como maquillajes y barras de labios.

A las 7 horas después de la aplicación, las lecturas de Nova Meter medias de los participantes mostraron una reducción de la hidratación cutánea de aproximadamente un 4% por debajo del valor de referencia en las zonas con la formulación de hidrolizado. Se observó una reducción de la hidratación cutánea de aproximadamente un 6% por debajo del valor de referencia en las zonas con la formulación de control. La diferencia de hidratación entre las dos formulaciones de maquillaje después de 7 horas era de aproximadamente un 2%, siguiendo mostrando la formulación de hidrolizado mejores propiedades de hidratación que la formulación de control. Fueron necesarias 7 horas para que la formulación de maquillaje de hidrolizado se aproximara al nivel de sequedad de la piel en comparación con la formulación de maquillaje de control.

Por lo tanto, la incorporación de los hidrolizados según la presente invención a formulaciones de maquillaje típicamente desecantes muestra propiedades de hidratación cutánea mejoradas en comparación con formulaciones que no contienen los hidrolizados. De hecho, la formulación de hidrolizado parece hidratar la piel inicialmente, en contraposición con el efecto deshidratante observado en la formulación de maquillaje de control.

Ejemplo 3- Actuación/sustantividad mejorada

Se obtuvieron 4 productos diferentes para el tratamiento de la disminución de moscas en animales tales como caballos (Ceratex, Gnat-Away, Solitude y Aqua-Pel). Las versiones concentradas de estos productos no estaban disponibles, por lo tanto se usaron diluciones comercialmente disponibles.

Se añadió a cada muestra agua o hidrolizado según la presente invención para preparar una disolución que contiene 10% de hidrolizado. Se mezclaron concienzudamente todas las formulaciones con un agitador hasta homogeneización. Se transfirieron todas las formulaciones a frascos pulverizadores.

Se seleccionaron 4 caballos para participar. Se pulverizó el lado izquierdo de cada caballo con la formulación de control. Se pulverizó el lado derecho de cada caballo con la formulación de hidrolizado. Durante ocho (8) días, se determinó el número de moscas en cada pata del caballo antes de la reaplicación de cualquier formulación. Con cada una de las 4 formulaciones de hidrolizado, el efecto acumulativo después de 8 días demostró una reducción significativa en el recuento de moscas. Las Figuras 3-7 muestran claramente que la formulación de hidrolizado produce una mayor reducción del recuento de moscas que la formulación de control. Por tanto, la inclusión del hidrolizado según la presente invención mejora la actuación acumulada de los materiales activos transferidos con el hidrolizado en los productos de disminución de moscas comercialmente disponibles.

**REIVINDICACIONES**

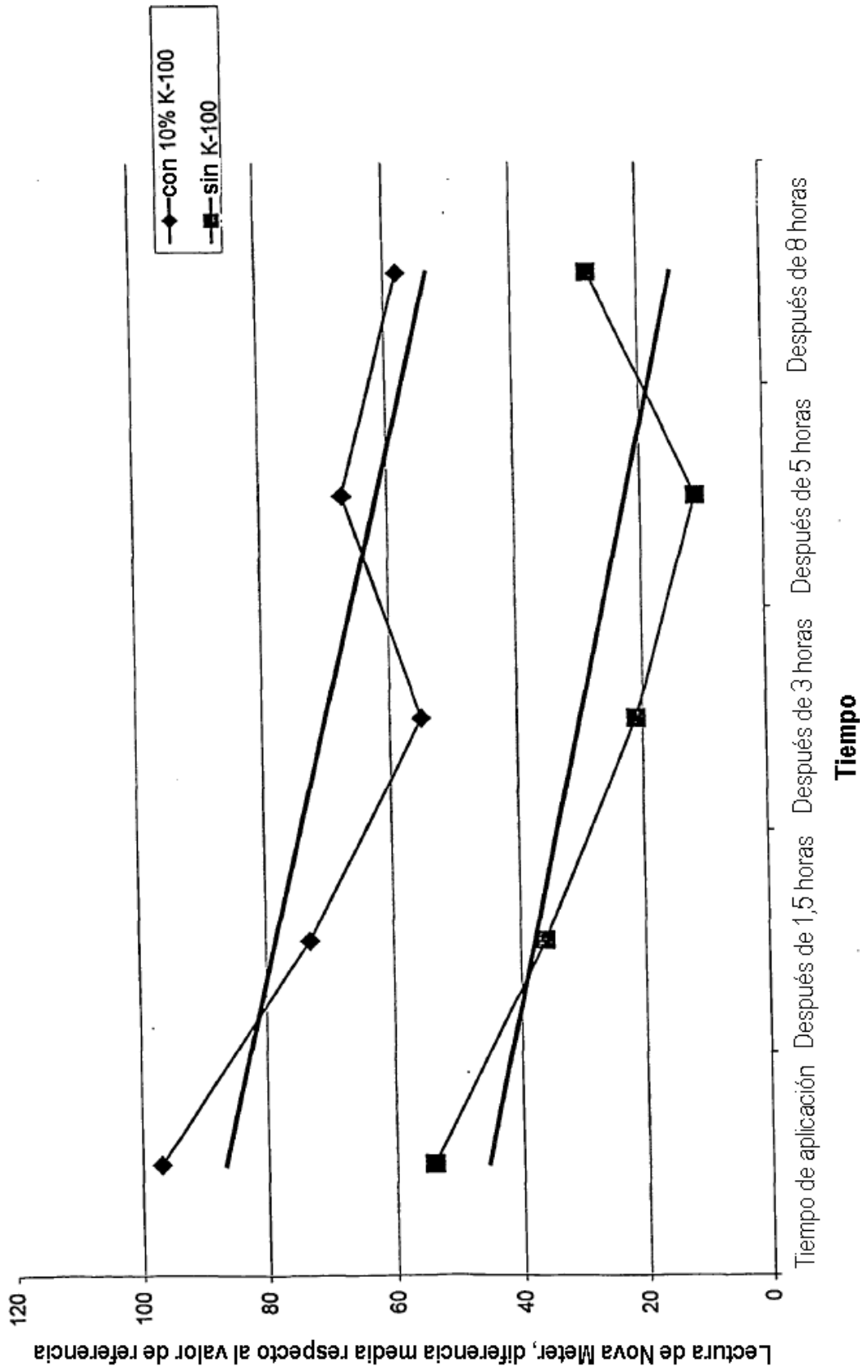
1. Uso de una composición que comprende una mezcla de sales hidrófilas polares (saponificables) y materiales lipófilos no polares (insaponificables) como composición portadora para la aplicación tópica de ingredientes cosméticos o farmacéuticos,

5 en el que la composición se produce mediante la reacción de hidróxidos de metales alcalinos acuosos con una composición lipídica orgánica que contiene una proporción de material insaponificable mayor de un 6% en peso, basada en el peso total de la composición lipídica orgánica, y

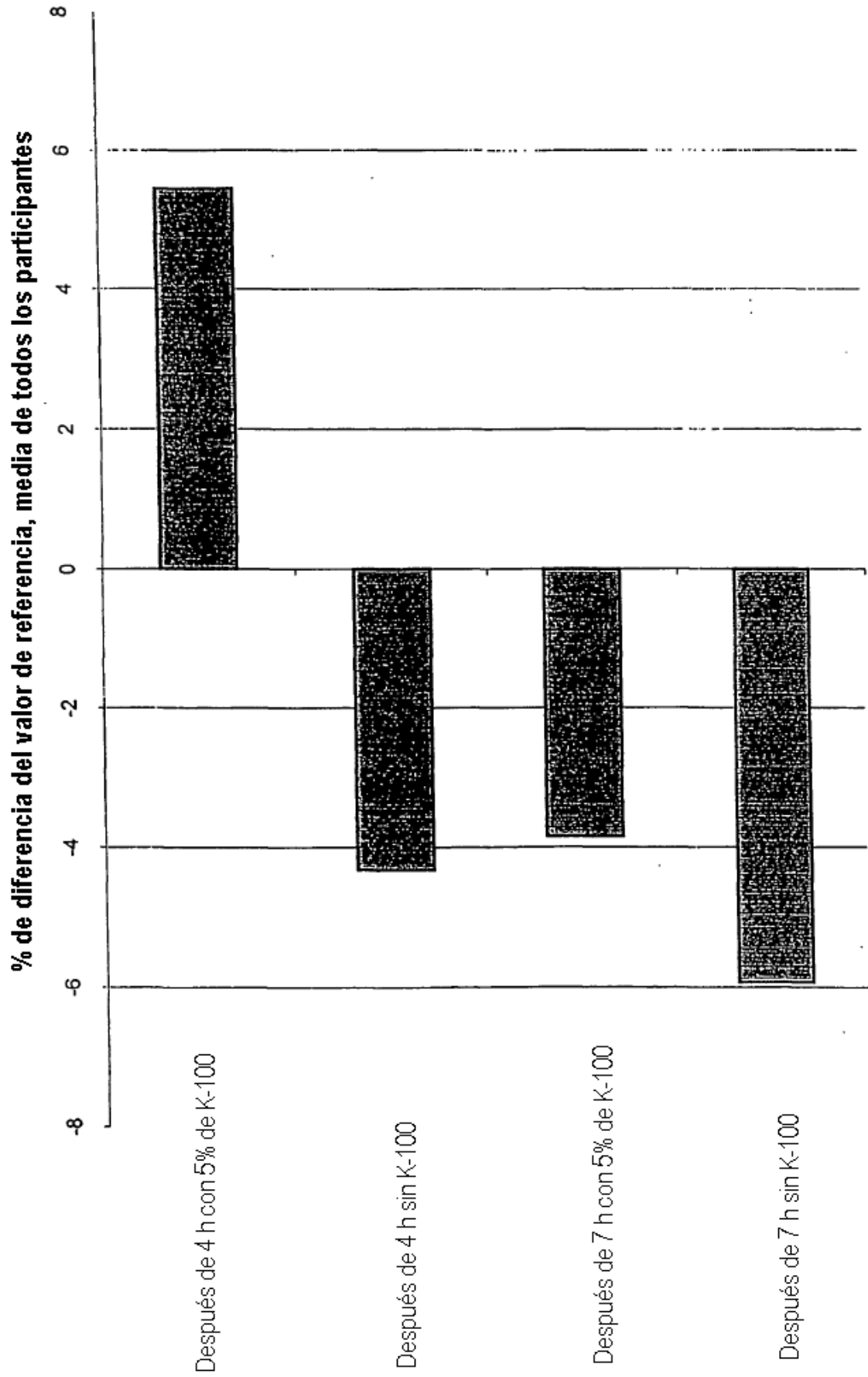
en el que la composición lipídica orgánica es aceite de yoyoba.

Fig. 1

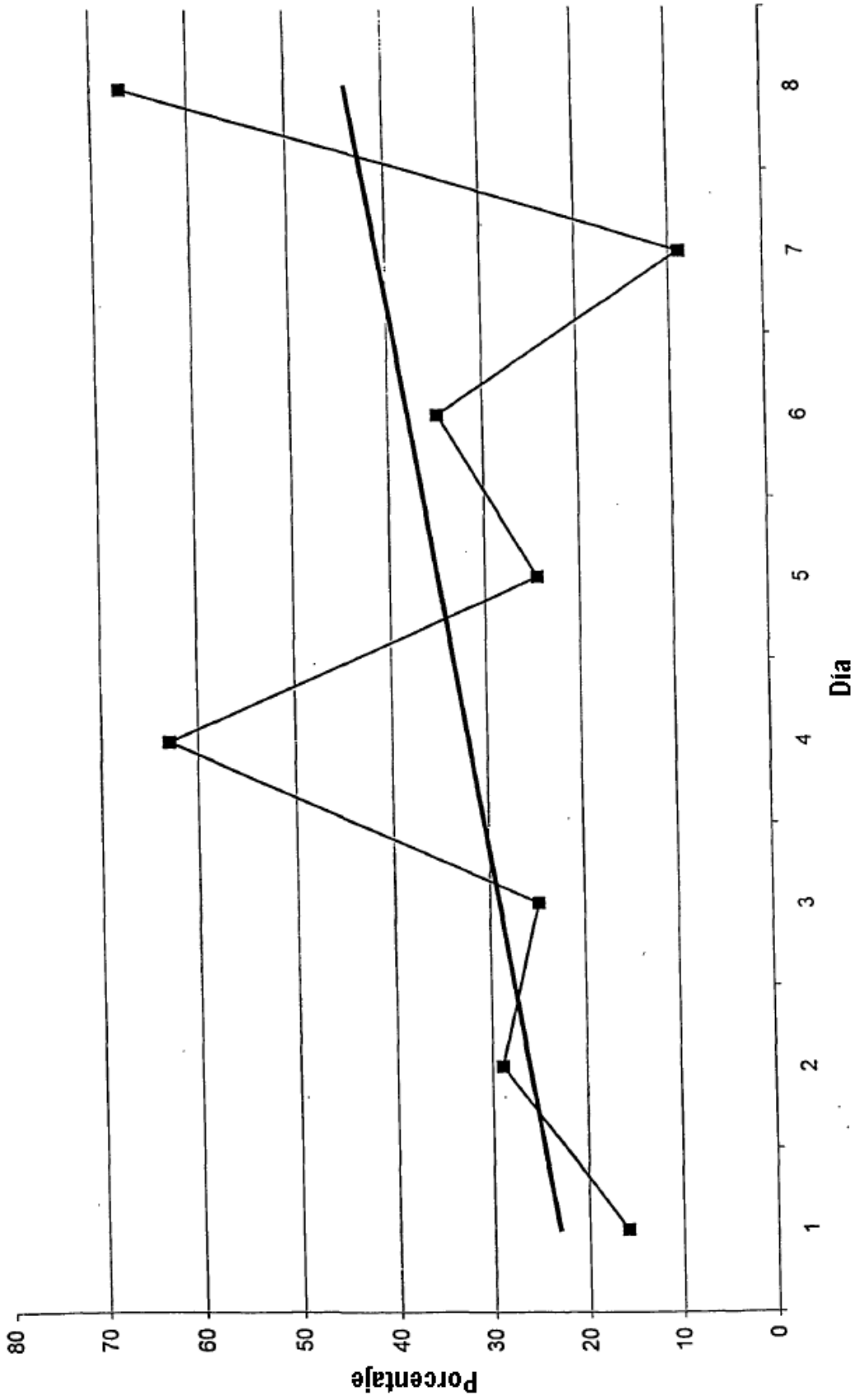
Estudio de loción Keri con Nova Meter



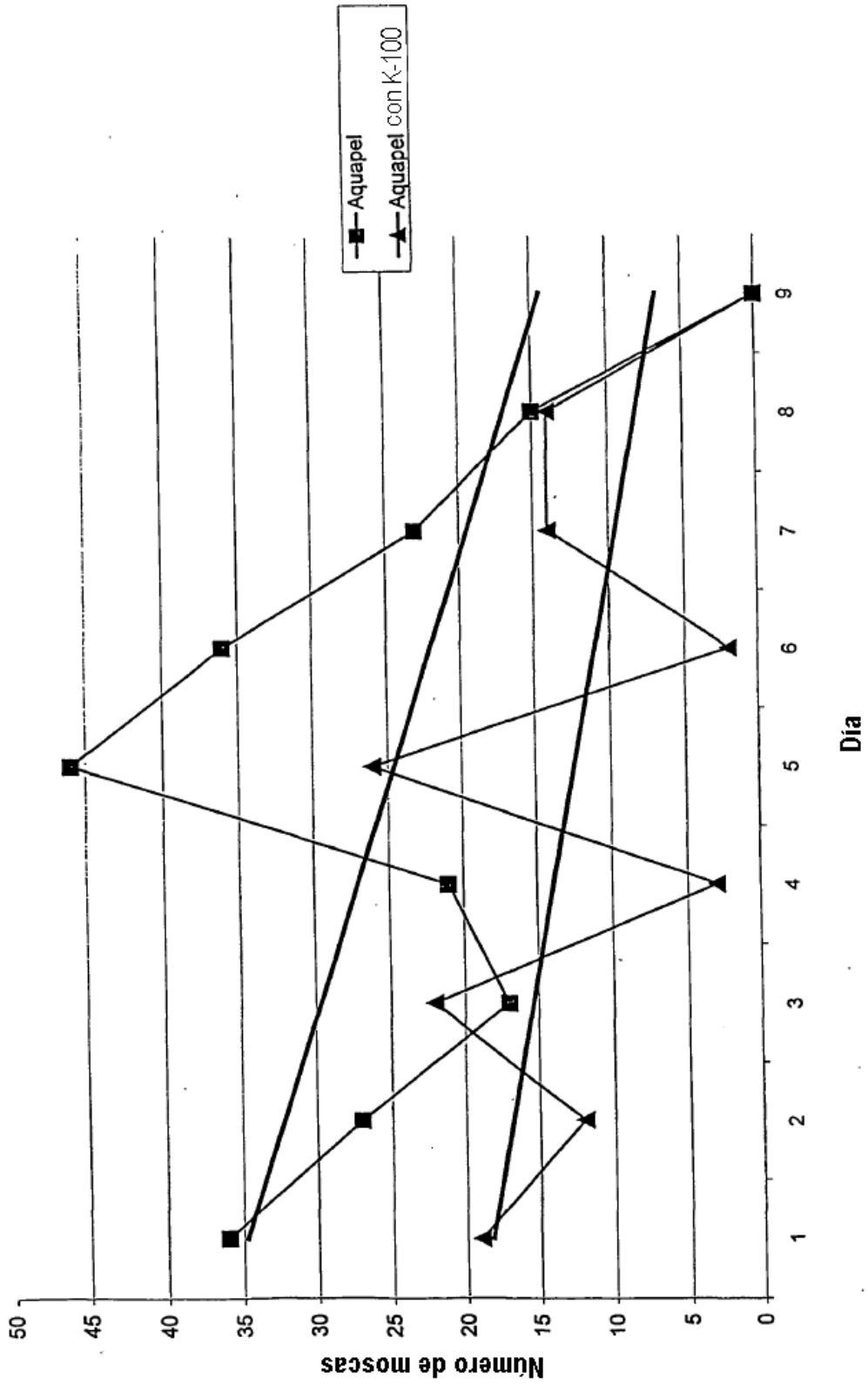
**Fig. 2** Estudio de "maquillaje en brazos" con Nova Meter



**Fig. 3** Reducción porcentual media



**Fig. 4** Aquapel, caballo 1  
 Por el Dr. McPhaul: El caballo 1 es un caballo marrón oscuro, lo que significa que tuvo que acercarse más para ver las moscas, lo que significa que las moscas no cooperaron durante el proceso de recuento



**Fig. 5** Ceratex, caballo 2

Por el Dr. McPhaul: Este caballo necesitaba herraduras, lo que significa que se le acumulaban suciedad y estiércol en suelas de sus pezuñas, lo que causaba más moscas congregadas alrededor de sus patas traseras. Estaba constantemente pisoteando el suelo, de modo que las moscas iban y venían con cada pisotón

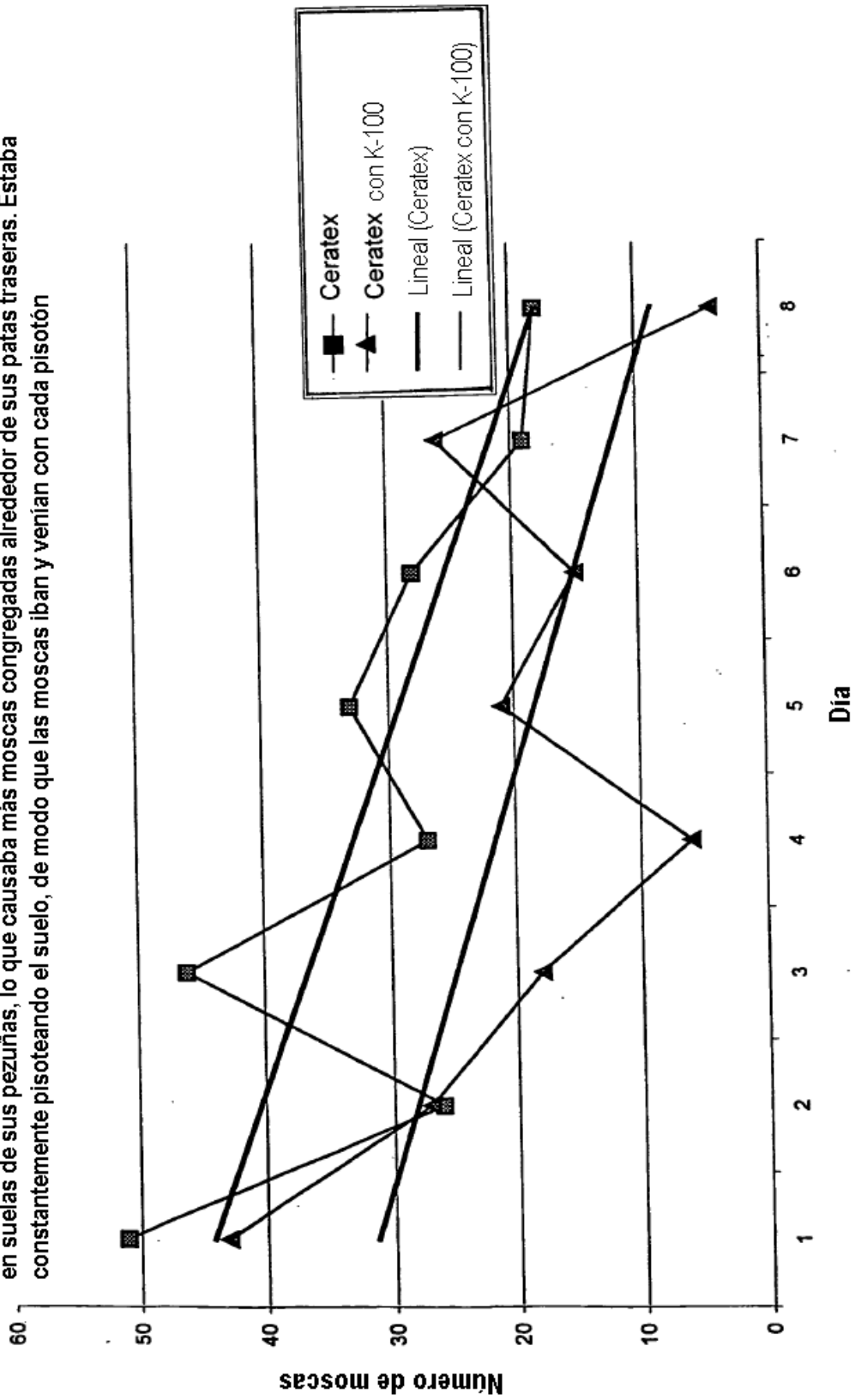
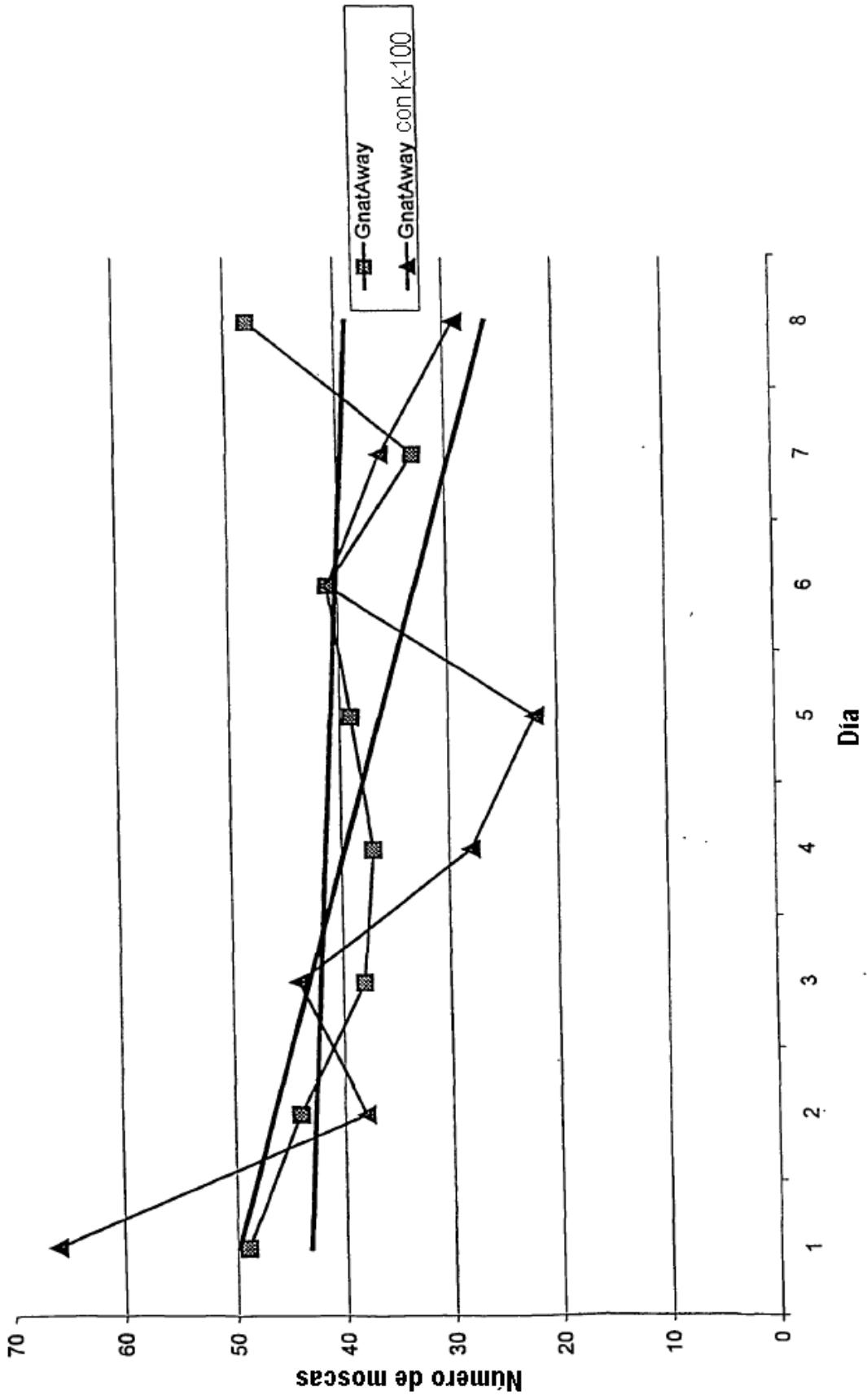




Fig. 6 GnatAway



**Fig. 7 Solitude, caballo 4**

Por el Dr. McPhaul: Este caballo tiene un historial de mayor limpieza y parece tener siempre menos moscas en él, independientemente de los métodos de control de moscas

