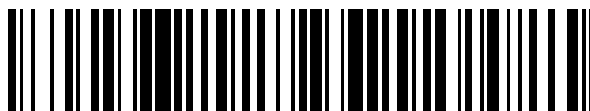


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 441 516**

51 Int. Cl.:

A61K 8/92 (2006.01)
A61Q 9/02 (2006.01)
A61Q 19/00 (2006.01)
A61Q 19/10 (2006.01)
A61K 8/36 (2006.01)
A61K 8/04 (2006.01)
A61K 36/185 (2006.01)
A61K 35/60 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **08.06.2004 E 04754840 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.11.2013 EP 1638513**

54 Título: **Utilización de una composición que comprende materiales insaponificables**

30 Prioridad:

30.06.2003 US 611775

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

04.02.2014

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

HILL, JOHN C.

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 441 516 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

Utilización de una composición que comprende materiales insaponificables

Campo de la invención

5 La presente invención se refiere a un nuevo uso de una composición de materia derivada de materiales naturales o extractos de materiales naturales. En particular, la invención se refiere al uso de composiciones derivadas de ingredientes naturales con niveles relativamente altos de materiales insaponificables (según lo definido más adelante) y al uso de los mismos para activar agentes gelificantes y como agente vehículo para la aplicación tópica de materiales.

Antecedentes de la invención

10 Las grasas vegetales y animales son materiales orgánicos lipídicos que generalmente contienen 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. (La hidrólisis es la escisión de un compuesto en componentes por adición de agua y una enzima, un ácido o una base). Los resultados de una reacción de hidrólisis son conocidos como "hidrolizados". Cuando se calientan en presencia de un hidróxido alcalino, los ésteres mencionados dan un jabón (la sal alcalina del ácido graso) y glicerina; este procedimiento de hidrólisis particular se denomina saponificación. Los términos "saponificación" y "saponificar" se usan aquí de manera normal para significar la reacción de hidrólisis entre una cera, un aceite o una grasa con un hidróxido de metal alcalino o alcalinotérreo formando el jabón sal metálica correspondiente. Estos aceites y grasas tienen un valor de saponificación que es el número de miligramos de hidróxido potásico requerido para la saponificación completa de un gramo de ácido orgánico libre y/o el éster de ácido orgánico.

Los productos de la postsaponificación pueden ser hidrófilos (solubles en agua) o hidrófobos (insolubles en agua). Se usará aquí el término "insaponificable" para designar los materiales que finalizada la reacción de saponificación siguen siendo insolubles en agua. Esto está de total acuerdo con A.O.C.S. Oficial Method Ca 6b-53, que define los materiales insaponificables como las sustancias frecuentemente encontradas como componentes de grasas y aceites, que no se pueden saponificar por el tratamiento cáustico usual, pero que son solubles en grasas y aceites ordinarios. Incluidos, pero no limitativamente, en el grupo de materiales insaponificables están alcoholes alifáticos superiores, esteroides, pigmentos, aceites minerales e hidrocarburos. Generalmente los materiales insaponificables son no volátiles a 103°C. El porcentaje en peso de material insaponificable en una sustancia se puede medir directamente midiendo el porcentaje en peso de los materiales definidos como insaponificables,

30 Los lípidos vegetales y animales más conocidos tienen niveles bajos, inferiores a cinco por ciento (<5%) de materiales insaponificables. Esto significa que la mayoría de los productos de la reacción de saponificación son solubles en agua. Los aceites vegetales comúnmente usados tienen niveles de materiales insaponificables generalmente inferiores a 1%. Por ejemplo, la saponificación de aceite de soja deja 0,7% en peso de materiales insaponificables, la saponificación de aceite de oliva deja 1,2% en peso de materiales insaponificables y la saponificación de aceite de cacahuete deja 0,4% en peso de materiales insaponificables. Sin embargo, algunos aceites comerciales contienen concentraciones más altas de productos insaponificables, hasta de 6,0% en peso de materiales insaponificables. Entre los ejemplos figuran aceite de salvado de arroz en crudo, 4,2% de insaponificables, aceite de germen de trigo en crudo, 6% de insaponificables y manteca de karité, 9-13% de insaponificables. Los materiales con niveles altos de insaponificables, tales como la manteca de karité, no son materiales de partida preferidos para la producción de jabón a causa de la gran cantidad de materiales insaponificables que quedan después de la reacción de saponificación.

45 En la mayoría de los casos, los productos de la hidrólisis del proceso de saponificación sólo se usan para un solo fin, que es como agente higiénico para la limpieza de la piel (jabón). En el pasado, el ingrediente básico del jabón era grasa animal (también conocida como sebo o talol) usando lejía basada en ceniza de madera en el procedimiento de saponificación. Idealmente, una barra de jabón tiene una dureza adecuada para maximizar los ciclos del usuario y tiene una cierta cantidad de resistencia a la reabsorción de agua cuando no se usa, mientras que al mismo tiempo proporciona espuma suficiente (que actúa como agente espumante) para intensificar la capacidad limpiadora del jabón. Los lípidos animales como ingrediente activo en el procedimiento de producción de jabón satisfacen generalmente en mayor o menor grado estas demandas del usuario. La producción actual de jabón sigue basada marcadamente en grasas animales en sus productos para satisfacer los requerimientos de la demanda del consumidor y la producción, aunque más tipos de diferentes materiales sintéticos comienzan a tener uso en las composiciones de jabón. Los diversos compuestos sintéticos y las mezclas de compuestos han llegado a ser muy populares en la moderna tecnología de fabricación de jabón para mejora de la calidad del jabón y satisfacer al usuario. Sin embargo, estos jabones basados en materiales sintéticos generalmente son resistentes a los procesos naturales de descomposición (esto es, biodegradabilidad) y por ello son relativamente persistentes en el medio.

Básicamente hay dos tipos distintos de procedimientos de fabricación de jabón. En un primer procedimiento, los

ES 2 441 516 T3

aceites y grasas se someten a cocción con soluciones cáusticas alcalinas, produciéndose gradualmente la saponificación hasta que se saponifican completamente los aceites y las grasas, siguiendo a ello la eliminación de la glicerina. Este procedimiento se puede realizar por lotes o en régimen continuo.

5 En un segundo procedimiento, que típicamente es un procedimiento continuo (pero que se puede realizar por lotes), los ácidos grasos y el álcali se aportan juntos en las proporciones apropiadas para saponificación total mediante una válvula de mezcla u otro dispositivo que los pone en íntimo contacto. La progresión de la saponificación depende de la temperatura, el tiempo de contacto y la eficiencia de la mezclado. Las soluciones concentradas producidas por estos procedimientos se denominan jabones "netos" y tienen una concentración de 60-65% de jabón, 35% de agua y rastros de sal y glicerina. A partir de este producto se producen los jabones para el consumidor en forma de barras, escamas, gránulos y polvos, secando primeramente el jabón neto a pelets que tienen un contenido de humedad de aproximadamente 12-16%, a lo que siguen las etapas de acabado tales como conformación, estrujamiento, amalgamación y similares.

15 Las barras de jabón del consumidor se fabrican hoy en día de aceite de coco y/o talol o sus ácidos grasos. El aceite de palmiste sustituye a veces al aceite de coco por razones económicas y los jabones preparados con aceite de palmiste se ajustan para un comportamiento similar al de las formulaciones de talol/coco no sustituidos.

20 Una consideración a tener en cuenta al seleccionar materiales para fabricar jabón es la de la relación apropiada de ácidos grasos saturados frente a insaturados y de cadena larga frente a cadena corta que resultan en un jabón que tiene las cualidades deseadas de estabilidad, solubilidad, facilidad de formación de espuma, dureza, capacidad de limpiar y similares. Se ha determinado que los jabones preparados de mezclas de ácidos grasos en las que la mayor parte de los ácidos grasos de las mezclas tiene cadenas de carbono de menos de doce átomos irritan la piel. Los jabones preparados a partir de ácidos grasos saturados de C_{16} y C_{18} típicamente son demasiado insolubles para uso del consumidor. Así, los materiales preferidos para la producción de jabón tienen cadenas de ácido graso de una longitud de entre doce y dieciocho átomos de carbono.

25 La saponificación de talol produce un jabón comprendido por una mezcla de ácidos grasos de $C_{14:0}$, $C_{16:0}$, $C_{18:0}$ y $C_{18:1}$ (ácidos mirístico, palmítico, esteárico y oleico, respectivamente) y la saponificación de aceite de coco produce un jabón que comprende una mezcla de ácidos grasos de $C_{12:0}$ y $C_{14:0}$ (ácido láurico y ácido mirístico, respectivamente) y cantidades significativas de ácidos grasos $C_{8:0}$ y $C_{10:0}$. Usualmente, las preparaciones de jabón de consumo contienen relaciones de talol/coco (T/C) de aproximadamente 90:10 a 75:25. Puesto que el ácido láurico sólo se encuentra en la fracción de coco de mezclas de T/C, el cambio más espectacular observado al aumentar el porcentaje de fracción de coco de mezclas de T/C es el aumento del ácido láurico. Al aumentar la fracción de coco en jabones que contienen ácido graso T/C generalmente mejoran las deseadas características de espumación de tales jabones. Sin embargo, en jabones con relaciones T/C de 50:50, es reducen las deseadas propiedades de suavidad para la piel.

35 La distribución típica de ácidos grasos (en porcentaje ponderal) de componentes para producir jabón es la siguiente:

Longitud de la cadena de carbono	Talol	Palma	Coco	Palmiste
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

40 Se puede ver en la tabla que las grasas de coco y palmiste (ambas conocidas como grasas láuricas) son particularmente ricas en ácidos grasos saturados C_{10-14} , en particular derivados del propio ácido láurico. Otra grasa que contiene ácidos grasos saturados de cadena relativamente corta similar al aceite de coco es el aceite de palma baebosiana. A diferencia, el aceite de talol y el de palma en sí son fuentes industriales de grasas no láuricas,

especialmente las que contienen ácidos grasos C₁₆ y C₁₈.

En general, las sales alcalinas de ácidos grasos de cadena larga, en particular las sales menos caras de C₁₆ y C₁₈ (como las obtenidas de aceites de talol y palma) proporcionan estructura en las barras de jabón acabadas y previenen o retardan la desintegración de la barra de jabón al exponerla al agua. Las sales más caras, de cadena más corta, derivadas de grasa láurica (esto es. sales de ácido láurico) y otras sales solubles (típicamente como las obtenidas de aceite de coco y palmiste) contribuyen a las propiedades espumantes de la composición global. Un problema general en la formulación de jabones de barra ha sido encontrar un equilibrio entre proporcionar estructura (obtenida generalmente a partir de un componente de cadena larga) y mantener las propiedades espumantes (obtenidas generalmente a partir de un componente más caro de cadena corta) a un coste global práctico.

Además de sales de ácido graso, las barras de jabón pueden contener ácidos grasos libres. La adición de ácidos grasos libres se conoce como "superengrasamiento". Se sabe que un superengrasamiento a un nivel de ácido graso libre de 5-10% da una espuma cremosa copiosa. Entre otros agentes de superengrasamiento figuran ácido cítrico y otros ácidos que actúan promoviendo la formación de ácidos grasos libres en la mezcla de grasa.

Para la fabricación de tortas de jabón, al jabón de base se pueden añadir aditivos comunes en cantidades normales, en relación a 100 partes en peso del jabón en barra, tales como agentes sobreengrasadores (de 1 a 3% en peso), estabilizadores (antioxidantes, agentes complejantes) (0,05 a 0,5% en peso, perfume (0,5 a 3 en peso) y posiblemente colorantes (0,05 a 0,3% en peso) así como agentes de protección de la piel tales como sorbitol, glicerina o similares (1 a 5% en peso).

Las industrias farmacéuticas y químicas han estado usando desde los tiempos primitivos extractos de grasa de origen vegetal. Hace unos años se supo en estas industrias que resultaban propiedades biológicas particularmente valiosas al usar grasas y extractos vegetales ricos en materiales insaponificables. Ciertos aceites vegetales, por ejemplo, aguacate y, en particular manteca de karité, se sabe que son particularmente ricos en materiales insaponificables y/o contienen estos materiales insaponificables.

En la patente U.S. nº. 5.679.393, expedida a Laur, se describe un procedimiento para enriquecer materiales insaponificables en aceites, especialmente manteca de karité, para uso en composiciones cosméticas y farmacéuticas. Este procedimiento concentra la fracción insaponificable de grasas y aceites por los procedimientos de cristalización y fraccionamiento. Este procedimiento es caro y no libera el resto de alcohol de los compuestos de partida (hidrólisis). Así, el procedimiento de Laur y los métodos para el uso de sus productos nunca utilizan la hidrólisis para crear sales alcalinas y liberar alcoholes u otros materiales insaponificables.

Los hidrolizados aplicados tópicamente para animar e inanimar objetos encuentran uso en numerosas áreas no de limpieza tales como preparaciones cosméticas, productos farmacéuticos, formulaciones de hidratación, insecticidas, repelentes de insectos y similares. Una de las áreas de interés creado por los diversos usos de agentes aplicados tópicamente maximiza la duración de la presencia de un agente activo tópicamente aplicado sobre la superficie a la que se aplica (sustantividad). Como resultado de intenso interés, la investigación de las vías para mejorar la duración de una cantidad fijada de cosméticos, productos farmacéuticos y agentes bioactivos tópicamente aplicados ha sido de importancia principal en todas las áreas en que se emplean cosméticos, productos farmacéuticos y agentes bioactivos aplicados tópicamente. Un ejemplo de este interés se puede encontrar en la técnica anterior en relación a composiciones para filtros solares.

Un gran segmento de la sociedad requiere el uso de composiciones filtros solares, puesto que sólo una pequeña porción de quienes se exponen a la luz solar tiene una pigmentación natural que proporciona protección contra los efectos perjudiciales de la radiación solar. A causa de que muchas personas presentan eritema incluso en condiciones de una breve exposición a la luz solar, hay necesidad de composiciones filtros solares que protegen frente a la radiación que causa eritema, esto es, radiación ultravioleta, de manera que sea posible un menor riesgo de quemaduras tras exposición a la luz solar.

En la técnica se conocen una variedad de composiciones de filtros solares. Una tendencia en la formulación de composiciones de filtros solares ha sido preparar composiciones que son resistentes al agua de la piel. Un método es modificar químicamente el absorbente de ultravioleta para aumentar su interacción con la piel por cuaternización de imidazoles, como se describe en la patente U.S. nº. 3.506.758; otro procedimiento es copolimerizar monómeros que absorben luz ultravioleta con otros monómeros formando películas resistentes al agua, como se describe en las patentes U.S. nº. 3.529.055 y nº. 3.864.473; otro procedimiento es formar películas polímeras con polímeros insolubles en agua, como se describe en la patente U.S. nº. 3.784.488.

El uso de la forma de ácido de copolímeros de etileno-anhídrido maleico reticulados para retener los absorbentes de luz ultravioleta se considera en la patente U.S. nº. 3.821.363. El uso de polímeros de acrilato insolubles en agua que tienen un parámetro de solubilidad de 6 a 10 en disolventes débiles que unen hidrógeno se describe en la patente U.S. nº. 4.172.122. El uso de materiales poliamida que forman película, insolubles en agua, solubles en alcohol, se da a conocer en la patente U.S. nº. 3.895.104 sólo a los fines de proporcionar una sustentividad

mejorada.

El documento WO 01/49257 A1 se refiere a una composición para aplicación tópica que comprende productos de hidrólisis de materiales orgánicos, en la que los mencionados materiales orgánicos comprenden como mínimo 6% en peso de materiales insaponificables. El documento U.S. 5.759.555 A describe un método para tratar queratosas de la piel o distensiones de estrías, método que comprende aplicar tópicamente a una zona afectada de la piel una composición dermatológicamente aceptable que comprende una concentración de entre 5 y 15 por ciento en peso de lípidos insaponificables de fruto o semilla de aguacate. En el documento FR 2.471.775 A1 se da a conocer un aceite cosmético que comprende una mezcla de como mínimo aceite de jojoba, aceite de tornasol y una fracción no saponificable.

Las aplicaciones cosméticas y otras de la técnica anterior no han utilizado hasta ahora las sustancias inherente de hidrolizados de materiales derivados naturalmente que contienen ésteres muy insaponificables o de cadena larga (de una longitud de más de 18 átomos de carbono) para intensificar la sustantividad intrínseca de agentes aplicados tópicamente con los que se incorporan. Previamente, la finalidad de emplear polímeros o materiales polímeros en las composiciones de la técnica anterior se ha dirigido a mejorar la adherencia, esto es, sustantividad del material tópico a la piel, o se han empleado sólo como agentes espesativos. La sustantividad mejorada lograda entre otras propiedades empleando los hidrolizados no se ha dado a conocer o apreciar en la técnica anterior.

La sustantividad acrecentada de agentes aplicados tópicamente proporciona un uso más eficaz y económico de tales materiales. En particular, se describen más adelante composiciones mejoradas, incluidos emolientes, agentes de retención de la humedad, filtros solares, barras de labios, maquillajes, repelentes de insectos, insecticidas, plaguicidas, herbicidas y similares, que tienen al menos una cantidad eficaz de un hidrolizado que incluye altos niveles de materiales insaponificables.

Además, muchas de estas composiciones requieren el uso de agentes gelificantes y espesativos. Típicamente, estos agentes espesativos se proporcionan, antes de su inclusión en la formulación, en solución acuosa ácida. La gelación o espesamiento se produce cuando el pH de la solución (formulación) se neutraliza en torno un pH de 5,5-7,0, estando controlada la viscosidad por el pH.

Los agentes neutralizantes más comúnmente utilizados son. AMP (2-amino-2-metil-propanol), AMPD (aminometilpropanodiol), TIPA (triiisopropilamina), DMS (dimetilestearamina), DMHTA (dimetilalolamina hidrogenada), TEA (trietanolamina), NaOH (hidróxido sódico), KOH (hidróxido potásico), DEPA (diethylpropilamina), DIPA (diisopropanolamina), siendo el más común TEA. Sin embargo, se han planteado cuestiones de salud en torno a muchos de los componentes básicos. Por ejemplo, se está investigando la TEA como potencial agente cancerígeno. El National Center Institute designó la TEA como material de estudio a causa de su uso prominente en cosméticos y otros productos de consumo y su potencial conversión en la N-nitrosodietanolamina carcinógena. Sin embargo, ratas y ratones dosificados tenían grados variables de acantosis (un espesamiento de la capa de células de agujas de la epidermis) e inflamación, ulceración y erosión epidérmica en el sitio de la piel en que se hizo la aplicación.

Por tanto, hay necesidad de composiciones que puedan neutralizar soluciones gelificantes sin riesgos para la salud. Las composiciones preferidas tendrían también una sustantividad acrecentada y podrían incluso proporcionar cierto grado de aptitud emoliente a la piel.

Sumario de la invención

La presente invención está dirigida al uso de una composición que comprende sales alcalinas de ácidos grasos, glicerina y al menos 6% en peso de materiales insaponificables, composición que tiene un pH mayor que 7, como agente neutralizante para soluciones gelificantes ácidas y un agente vehículo para la aplicación tópica de materiales cosméticos, farmacéuticos o agentes bioactivos.

La hidrólisis de materiales con niveles altos de material insaponificable, tales como extractos de plantas, da productos con propiedades singulares. Se ha encontrado que la aplicación de productos de hidrólisis de materiales, en particular materiales derivados naturalmente, con una fracción alta de insaponificables (por ejemplo de como mínimo 6% en peso total del material) produce un hidrolizado con propiedades significativamente diferentes de las de los productos resultantes de la saponificación convencional de materiales con menos de 6% en peso de insaponificables.

Los productos resultantes usados de acuerdo con la presente invención sustantivamente retienen la humedad, previenen la absorción innecesaria de un ingrediente activo que contiene la superficie sobre la que se aplica, presentan una funcionalidad de tensioactivo singular, no son agentes espumantes con agua y tienen un pH adecuado para la neutralización de una solución ácida. Los hidrolizados usados de acuerdo con la presente invención se ha encontrado que son neutralizantes de una solución ácida que también actúan como agente de soporte natural para aplicación tópica de cosméticos, productos farmacéuticos y agentes bioactivos, en particular en la piel de sujetos, y proporcionan un soporte sustantivo para los materiales contenidos.

Los rasgos nuevos que se consideran característicos de la invención se exponen en particular en las reivindicaciones anexas.

Descripción detallada de la invención

5 La presente invención está dirigida al uso de una composición que comprende sales alcalinas de ácidos grasos, glicerina y al menos 6% en peso de materiales insaponificables, composición que tiene un pH mayor que 7, como agente neutralizante para soluciones gelificantes ácidas y un agente vehículo para la aplicación tópica de materiales cosméticos, farmacéuticos o agentes bioactivos. Más específicamente, la composición a usar de acuerdo con la presente invención proporciona un agente neutralizante para soluciones de gelación ácidas y un agente vehículo para la aplicación tópica de materiales cuando se requiere una fuerza de “duración” o sustantividad superior. Adicionalmente, la presente invención es útil porque, entre otras cosas, actúa como emoliente y emulsivo 10 único y demuestra sustantividad; tiene la capacidad de “fijar” muchos tipos diferentes de materiales “activos”, de filtros solares a preparados farmacéuticos a cualquier superficie animada o inanimada a que se aplica.

A los fines de esta presente invención se deben considerar las definiciones siguientes:

15 Aceites, grasas y similares “materiales altamente insaponificables” o de “contenido alto de insaponificables” significa composiciones que comprenden como mínimo 6% en peso de total de materiales orgánicos que son insaponificables y como mínimo 10% en peso de materiales orgánicos que son saponificables (es posible que el porcentaje de insaponificables pueda incluso exceder de 95% en algunas formulaciones). Por tanto, el término incluye composiciones que contienen 6-90% en peso de orgánicos de materiales insaponificables y 10-94% en peso de materiales saponificables. En la tabla siguiente se da una lista de biomateriales con alto contenido de 20 insaponificables.

Material	% de 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 de ciervo	7%
Cera candelilla	65-75%
Cera carnauba	50-55%
Aceite de casia occidentalis (café silvestre)	7%
Aceite de grano 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 de plantas)	8-12%
Aceite de jojoba	45%
Aceite de jurinea	40%
Lanolina	39%
Aceite de baya de laurel	6%
Olestra® u Oleant®	33% (aproximación)
Concentrado de aceite de oliva (fitoescualeno)	35-75%
Aceite de semilla de oliva	mayor que 6%
Aceite basto de naranja	40%
Cera de ouricury	50-55%
Aceite de semilla de quinoa	6%
Aceite de germen de centeno	11%
Aceite de hígado de tiburón	60%

Material	% de insaponificables
Manteca de karité	9-13%
Aceite de esperma de ballena	36%
Cera de azúcar de caña	18-80%
Cera de girasol	25-45%
Aceite de talol	9-23%
Destilado de aceite de talol	25-33%
Vegepure® de granos de trigo	70-90%
Aceite de germen de trigo	6%

“Sustantividad” significa la tendencia de un material a resistir que sea eliminado o la persistencia de un tratamiento sobre la piel. Por ejemplo, algunas lociones sustancias solares son sustantivas porque forman una película sobre la piel que es relativamente insoluble en agua. Esto significa que los materiales sustantivos resisten la eliminación o transferencia por contacto físico, sudoración o lavado.

Las composiciones de materia que comprende ceras, aceites y/o grasas (lípidos) que contienen como mínimo 6% en peso de ingredientes insaponificables y como mínimo 10% en peso de ingredientes saponificables son sometidas a una reacción de hidrólisis alcalina para producir una composición sustantiva no espumante con propiedades de tensioactivo singulares que se puede usar como ingrediente activo o como vehículo para la aplicación de otros ingredientes activos, por ejemplo, como soporte de base para aplicación de ingredientes cosméticos, farmacéuticos u otros ingredientes activos. Entre los extractos basados en biomaterial comercialmente disponibles que tienen una alta proporción de insaponificables figuran, no limitativamente, cera candelilla, cera carnauba, aceite de jojoba, lanolina, lecitina y manteca de karité.

El lípido sometido al presente uso de la invención puede ser un producto en bruto o puede ser sometido a varias etapas de refinado y/o modificación. Son ejemplos de procedimientos de refinado que se pueden mencionar, los procedimientos convencionales de refinado químico o físico o los procedimientos más especializados para el refinado de manteca de karité, que posibilitan en particular la retención o la concentración de la cantidad máxima de materiales insaponificables, sometiendo después tales materiales tratados al uso de la presente invención.

El refinado químico, que se usa preferiblemente, que se aplica a las grasas vegetales antes de ser sometidas a los procedimientos de acuerdo con la presente invención, puede ser cualquier procedimiento de refinado químico convencional, en particular cualquier procedimiento que comprende las etapas siguientes:

Etapas 1: eliminación de gomas que implica la insolubilización de los fosfátidos con agua, generalmente en presencia de ácido, muy frecuentemente ácido fosfórico, y separación por decantación o centrifugación (procedimiento continuo);

Etapas 2: neutralización de los ácidos grasos libres del aceite por adición de solución de hidróxido sódico y separación de los jabones formados (denominados stock de jabón), muy frecuentemente por centrifugación seguida por varios lavados con agua, efectuándose con frecuencia las etapas 1 y 2 simultáneamente en un proceso continuo;

Etapas 3: decoloración con arcillas de blanqueo activadas a aproximadamente 100°C en vacío reducido, y filtración;

Etapas 4: operación de desodoración necesaria para eliminar los compuestos responsables de los olores y sabores de un aceite y producir un aceite refinado. Esta operación se realiza en un aparato denominado desodorizador, implicando el procedimiento calentar el aceite a una temperatura alta (180-220°C) en un vacío del orden de aproximadamente 532 Pa e inyectar masivamente vapor de agua para eliminar impurezas.

Se entiende como una variante del procedimiento de refinado químico explicado antes, un método de refinado físico alternativo, que difiere en que no se realiza la etapa de neutralización con hidróxido sódico y que la eliminación de los ácidos libres del aceite se realiza durante la etapa de desodoración. Las condiciones de refinado seleccionadas durante este método de refinado físico pueden requerir una modificación con el fin de retener las deseadas propiedades de los insaponificables seleccionados para uso en la presente invención.

Los extractos usados como materiales de partida para la reacción de hidrólisis pueden estar en el estado bruto o refinado. Los extractos también alcoxilar, polimerizar, acetilar, oxidar, reducir, concentrar, hidrogenar, hidrogenar parcialmente, interesterificar, modificar mediante un enlace doble, aleatorizar, refinar u oxidar de otra forma antes de la reacción de hidrólisis. Puesto que muchos lípidos tienen concentraciones o fracciones bajas (por ejemplo, 1% o menos según se ha discutido antes) de insaponificables, la presente invención abarca la concentración de insaponificables de baja fracción a fracciones más altas, esto es, mayor que 6%.

Los productos de la reacción de hidrólisis de materiales orgánicos que producen insaponificables comprenden una mezcla de: 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, el estado y la forma del reactante inicial.

5 La composición de materiales usados de acuerdo con la presente invención se produce por la reacción de hidróxidos de metales alcalinos acuosos, por ejemplo, NaOH, LiOH, KOH (el hidróxido preferido), CaOH, MgOH y similares, con composiciones de lípidos orgánicos, usualmente extractos vegetales, aceites, grasas o ceras (de los extractos o derivados de los extractos), conteniendo las composiciones orgánicas una proporción alta de materiales insaponificables (mayor que 6%) y, preferiblemente, como ésteres de cadena larga.

10 El aceite de jojoba se puede examinar como caso de ejemplo. El aceite de jojoba refinado contiene varias proporciones de ésteres diinsaturados de cadena larga. Los hidrolizados de aceite de jojoba refinado son casi una mezcla 55:45 de sales hidrófilas polares de cadena larga (sales alcalinas) y materiales lipoófilos relativamente no polares (alcoholes grasos). La fracción lipófila son los materiales insaponificables de acuerdo con la definición usada en este documento. Las longitudes de las cadenas de carbono de estos dos hidrolizados de jojoba incluyen y
15 varían de C₁₈ a C₂₄ y tienen 9 dobles enlaces ω como parte de cada molécula. Se ha encontrado que la combinación de las fracciones saponificable e insaponificable de los hidrolizados de acuerdo con la presente invención tiene propiedades que coadyuvan en la formulación de composiciones cosméticas, farmacéuticas y otras.

Los productos que resultan de la hidrólisis de los lípidos que contienen altos porcentajes de materiales insaponificables, como los creados durante la práctica de la presente invención, se usen como netos, mezclados,
20 disueltos, dispersados o emulsionados con excipientes, disolventes o vehículos, pueden contener e impartir útiles propiedades a las superficies a que se han aplicado. Esta superficies pueden ser superficies animadas, en particular piel humana, superficies de plantas e incluso superficies de objetos inanimados, por ejemplo, objetos de madera, fibra o plástico. Entre las propiedades pueden figurar, no exclusivamente, sustantividad, aptitud para ser emulsionado, retención de la humedad y similares.

25 Una de las propiedades mencionadas, la sustantividad, es particularmente útil en el campo de las barras de labios, champúes, acondicionadores, abrillantadores del cabello, repelentes, agentes de atracción, cosméticos, productos farmacéuticos y filtros solares. La propiedad sustantividad es especialmente beneficiosa para productos de cuidado del cabello, tales como acondicionadores del cabello permanentes, en los que son particularmente comercialmente materiales derivados naturalmente que presentan sustantividad. La sustantividad es también particularmente útil
30 con filtros solares, bloques solares o formulaciones para broncear, así como para repelentes de insectos, repelentes de pulgas y moscas, y plaguicidas. La sustantividad puede ser también beneficiosa cuando se usa en objetos inanimados tales como refrescantes, agentes antibacterianos, agentes antimildiú y agentes antifúngicos, tiras adhesivas para moscas, plaguicidas, insecticidas, repelentes de insectos, herbicidas y similares.

Se teoriza sobre si la inclusión de los altos niveles de materiales insaponificables en el material orgánico permite
35 que los hidrolizados a usar de acuerdo con la presente invención pongan de manifiesto su combinación singular de propiedades. La naturaleza exacta de los materiales insaponificables dentro de los aceites, ceras, grasas y otros extractos naturales no es particularmente importante (excepto cuando se desea una propiedad específica), y cada uno de los materiales naturales de partida disponibles puede diferir significativamente en cuanto a la composición y tipos de insaponificables. Por ejemplo, los extractos de jurinea (por ejemplo, los extractos de éter de petróleo de
40 jurinea) pueden comprender 40% en peso de alcoholes pentacrílicos de triterpeno junto con sus ésteres (miristato, palmitato y acetato) así como α -amirina, β -amirina, lupeol y t-taraxasterol (Lipids, K.L. Mikolajczak y otros, 1967, vol. 2, n.º. 2, págs. 127-132). El aceite de briza puede contener 20% en peso de lípidos que son semisólidos, comprendiendo el lípido 49% en peso de digalactosilglicéridos insaponificables, 29% de monogalactosilglicéridos insaponificables y pequeñas cantidades de triglicéridos saponificables convencionales. Los ácidos grasos
45 predominantes en los aceites anteriores son ácido palmítico, ácido oleico y ácido linoleico convencionales (Lipids, C.R. Smith Jr. y otros, marzo 1966, vol. 1, n.º. 2, págs. 123-127).

Se ha encontrado que proporcionando hidróxidos metálicos alcalinos acuosos, se puede producir una solución básica que tiene un pH mayor que 7. Esta solución con un pH alto es adecuada para neutralizar (espesar) agentes
50 gelificantes ácidos. Un experto en la técnica de cualificación normal entenderá que la cantidad exacta de hidrolizados de pH alto a usar de acuerdo con la presente invención, necesaria para neutralizar los agentes de gelación ácidos depende del pH de los hidrolizados y la cantidad, composición y pH de los agentes gelificantes.

Entre los agentes gelificantes ácidos preferidos figuran, no limitativamente, polímeros sintéticos, gomas, coloides hidrófilos y sus derivados. Los polímeros sintéticos se inician con un material en bruto tal como carbómeros, copolímeros de acrilatos, polímeros cruzados de decadieno de PVM/MA, copolímero de acrilatos/acrilatos
55 esteareth-20 y copolímeros de esteareth-10 alil éter/acrilatos (o combinaciones de los mismos). Las gomas, coloides hidrófilos y sus derivados se inician con un material en bruto tal como celulosa o derivados de tipo carbohidrato. Entre los ejemplos de estos tipos de materiales en bruto figuran Gellan Gum, goma de xantano hidroxietilcelulosa e hidroxipropil guar. La Gellan Gum por definición es una goma de heteropolisacarido de alto

ES 2 441 516 T3

peso molecular producida por fermentación de cultivo puro de un carbohidrato con *Pseudomonas elodea*. La goma de xantano satisface la misma definición pero se produce de *Pseudomonas campestris*.

La composición a usar de acuerdo con la presente invención se produce preferiblemente por un procedimiento por lotes usando una caldera grande de vapor de agua equipada con una mezcladora de propulsor.

5 Se añade a la caldera una cantidad medida de pelets de hidróxido potásico con una cantidad medida de agua destilada, desionizada o purificada por ósmosis inversa. La cantidad de hidróxido potásico empleada para saponificar completamente el ácido orgánico libre y/o el éster de ácido orgánico se puede calcular a partir del valor de saponificación del material de partida y teóricamente será la cantidad estequiométrica. En la práctica, sin embargo, se prefiere emplear ligeramente más que la cantidad estequiométrica de hidróxido potásico con el fin de asegurar que los hidrolizados que se forman contienen ácido sin usar. La cantidad de hidróxido potásico empleada puede ser considerablemente más que la cantidad estequiométrica, por ejemplo, se puede usar el 150% de la cantidad estequiométrica o más dependiendo del resultado que se desee.

15 Los pelets de hidróxido potásico y el agua se mezclan juntamente en la mezcladora de propulsor hasta que se disuelven los pelets de hidróxido potásico. Es importante señalar por razones de seguridad que se genera calor en esta etapa y que la mezcla es bastante cáustica. El personal debe usar guantes y protección para ojos y cara, así como ropa protectora para evitar quemaduras, tanto por calor como químicas.

Seguidamente se añade a la caldera de vapor de agua una cantidad medida de un material orgánico refinado o derivatizado que contiene una proporción alta de insaponificables, tal como aceite de jojoba, teniendo cuidado de no salpicar la solución cáustica contenida en ella.

20 La caldera de vapor de agua se calienta a 90-95°C y se mantiene a esa temperatura a agitación constante durante 2 horas. En este momento se debe medir el pH de la mezcla resultante. Se continúa calentando la mezcla a 90-95% bajo agitación constante. Se comprueba periódicamente la solución hasta que el pH se estabiliza a aproximadamente 10,5. Una vez que se estabiliza el pH, se toma una muestra para análisis. La muestra se debe analizar por procedimientos tales como cromatografía u otro método similar con el fin de saber si la reacción ha transcurrido como se deseaba.

Los hidrolizados resultantes se pueden diluir luego añadiendo una segunda cantidad medida de agua u otro diluyente a la caldera de vapor de agua, diluyendo con el propulsor de mezcla. Se debe aplicar calor continuamente, a menos de 80°C, hasta que la mezcla sea homogénea.

30 Una vez homogeneizada la mezcla de hidrolizado se enfría a 60°C mientras que se sigue mezclando con el propulsor. Luego se puede pasar la mezcla de hidrolizado a un recipiente de mantenimiento y dejar que se enfríe a temperatura ambiente antes de cerrar el recipiente de mantenimiento.

Seguidamente se describen varios ejemplos de usos encontrados para los hidrolizados a usar de acuerdo con la presente invención.

Ejemplo 1. Producto sanitario para manos con una hidratación extendida de la piel.

35 Esta fórmula produce un gel antibacteriano transparente que suministra capacidad emulsiva y vitamina B para dejar bandas hidratadas, nutridas y frescas. La hidratación intensificada se logra mediante el uso de la composición sustantiva de acuerdo con la presente invención. La fragancia se extiende asimismo usando la composición de la presente invención.

Fase	Nombre comercial	Nombre de INCI	Suministrador	% p/p
A.	Agua desionizada	Agua		c.s.
	Carbopol ETD2020	Polímero cruzado de acrilatos/acrilato de alquilo C ₁₀₋₃₀	Noveon	0,3
B.	Versene NA	EDTA disódico	Dow	0,01
	Etanol SDA-40	Alcohol	Remet	61,78
C.	Etanol SDA-40	Alcohol	Remet	0,22
	Floraesters K-20W Jojoba	Ésteres de jojoba hidrolizados (y) agua	Floratech	1,00
D.	Florasomes Jojoba MXS/15% peso de fragancia	Ésteres de jojoba (y) fragancias	Floratech	0,62
	Florasomes Jojoba MXS/10% peso de vit. E	Ésteres de jojoba (y) acetato de tocoferol	Floratech	0,38

40 TOTAL 100,00

Procedimiento de mezcla

1. Se añade a agua a temperatura ambiente el Versene NA con agitación con propulsor. Se añade lentamente Carbopol ETD2020 y se dispersa por agitación a alta velocidad durante una hora.
2. Se añade la Fase B a la Fase A y se agita con agitación por barrido moderada durante 20 min. Se deja en reposo AB durante como mínimo 1 hora para desaireación.
3. Se premezcla la Fase C y se añade a la Fase AB usando agitación por barrido moderada hasta que se alcanza la viscosidad deseada.
4. Se humedece la Fase D usando una cantidad igual de ABC y se añade a ABC con una agitación por barrido moderada.
5. Se mezcla con agitación por barrido moderada durante 15 min o hasta que la Fase D se distribuya por igual en el lote.

Se compró una loción para la piel disponible comercialmente y se dividió igualmente. La mitad se usó como control y la mitad se usó como base en la que se incorporó 5% de un hidrolizado de jojoba. El hidrolizado de jojoba se preparó de acuerdo con el método descrito en este documento. Se tomó una lectura de la hidratación de la piel de la línea de base con el medidor Nova para cada panelista antes de la aplicación de la loción. Las lociones que contenían el control y los hidrolizados se aplicaron a diferentes zonas de cada antebrazo de los panelistas. La loción que contenía el hidrolizado se aplicó al antebrazo derecho y la loción de control se aplicó al antebrazo izquierdo. El medidor Nova se usó para tomar las lecturas de hidratación de la piel de las zonas del antebrazo al que cada participante había aplicado cada loción. Se tomaron múltiples lecturas de la hidratación de la piel y se registraron a intervalos de una hora después de la aplicación de la loción.

El experimento dio por resultado un período de tiempo espectacularmente alargado para la hidratación de la piel para la mayoría de los sujetos del ensayo en las zonas de ensayo en las que se aplicó la formulación del 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 la loción con hidrolizado demostró una mejora de 20% a 54% (sobre la línea de base) del contenido de humedad sobre la piel tratada con la formulación de control.

Ejemplo 2 – Gel para afeitar acondicionador de la piel

Este gel singular para afeitar no se basa en la espuma o jabonadura para obtener un afeitado claro, preciso. A diferencia, el gel de afeitado, lubria la piel y la barba de manera que sólo los productos orgánicos pueden hacerlo. Se reduce la presión de la cuchilla, se intensifica la precisión del afeitado y se elimina virtualmente la irritación cuando se usa este gel. El gel sustantivo proporciona una hidratación de la piel intensificada durante horas después del afeitado.

Fase	Nombre comercial	Nombre de INCI	Suministrador	% p/p
A.	Agua desionizada	Agua		62,74.
	Carbopol ETD2020	Polímero cruzado de acrilatos/acrilato de alquilo C ₁₀₋₃₀	Noveon	0,60
B	Versene NA	EDTA disódico	Dow	0,01
	Sorbitol	Sorbitol	SPI Polyols	10,00
C.	Floradolvs® PEG-120 Jojoba	Ésteres de cera de jojoba PEG-120	Floritech	5,00
	Glicerina	Glicerina	Spectrum	5,00
	Butilenglicol	Butilenglicol	Ashland	1,00
	Conservante	-----		c.s.
D.	Fragancia para cuidado de la piel(13765H)	Fragancia	Shaw Mudge & Co.	c.s.
	SD alcohol 40	SD alcohol 40	Remet	10,00
	Floraesters® K-20W Jojoba	Ésteres de jojoba hidrolizados (y) agua	Floritech	5,00
	Color (opcional)	-----		c.s.
TOTAL				100,0

Procedimiento de mezcla

1. Se añade a agua a temperatura ambiente el Versene NA con agitación con propulsor. Se añade lentamente Carbopol en el agua desionizada y se mezcla durante un tiempo suficiente para que tenga lugar la hidratación completa.

ES 2 441 516 T3

2. Se mezclan juntos los componentes de la Fase B a 60°C. Se continúa mezclando la Fase A y se eleva su temperatura a 60°C. Se añade la Fase B a la Fase A y se mezcla durante 20 minutos a 60°C. Se baja la temperatura a 40°C.

5 3. Se premezcla el metilo y propilparabeno en el butilenglicol y se añade a la Fase AB. Si se requiere se añade la fragancia.

4. Se premezcla Floraesteres K-20W en etanol y se añade a la Fase ABC. Se añade colorante si se requiere.

10 La incorporación de los hidrolizados de acuerdo con la presente invención en las formaciones de gel de afeitado típicamente secantes muestra propiedades de retención de la humedad en comparación con formulaciones que no contienen los hidrolizados. Además, la incorporación de los hidrolizados de acuerdo con la presente invención añade grados de lubricación perceptibles del proceso de afeitado.

Ejemplo 3 – Gel de ducha que acondiciona la piel

Un gel de ducha limpiador transparente que deja la piel lisa, sedosa y humedecida después de cada ducha. Las Florapearles y Florabeds contribuyen al efecto visual del producto y proporcionan una sensación de lavado durante la ducha

15

Fase	Nombre comercial	Nombre de INCI	Suministrador	% p/p
A.	Agua desionizada	Agua		c.s
	Versene NA	EDTA disódico	Dow	0,1
	Polímero Carbopol Aqua SF-1	Copolímero de acrilatos	Noveon	10,0
	Florasolvs PEG-16 Macadamia	Glicéridos de PEG-16 Macadamia	Floratech	3,0
B.	Sulfochem ES-2	Laurethsulfato sódico	Chemron	25,0
	Sulfochem AEG	Laurilsulfato amónico (y) ALES (y) CAPB (y) Cocamida DEA (y) lauramida DEA	Chemron	4,5
	Solubilisant LRI	PPG-26-buteth-26 (y) PEG-40 aceite de ricino hidrogenado	LCW	1,0
	Floraesters K-20W Jojoba	Ésteres de jojoba hidrolizados	Floratech	7,5
C.	Standamid LD	Lauramida DEA	Cognis	3,7
	Propilenglicol	Propilenglicol	Ashland	5,0
D.	Lexaine C	Cocamidopropil betaína	Inolex	5,0
D.	Tween 20	Polisorbato 20	Uniqema	0,8
	Fragancia	Fragancia	Intercontin Fragrances	c.s.
E.	Conservante	-----		c.s.
	Florapearls Jojoba STD	Ésteres de jojoba	Floratech	c.s
	Florabeads Jojoba 28/60	Ésteres de jojoba	Floratech	c.s,
TOTAL				100,0

Procedimiento de mezcla

20 1. Se pone Versene EDTA en agua y se mezcla hasta que se disuelva. Se añade el polímero Aqua SF-1 con agitación media del propulsor. Se mezcla en PEG-16 Macadamia y laurethsulfato sódico y se deja durante 30 minutos para asegurar una mezcladura completa.

2. Se mezcla con la Fase B junta a temperatura ambiente dejando un tiempo suficiente para que el K-20W se disuelva completamente en el líquido. Se añade la Fase B a la Fase A mezclando lentamente a mano para evitar que quede atrapado en la mezcla un exceso de burbujas de aire.

3. Se añade la Fase C a la Fase AB mezclando suavemente a mano.

25 4. Se mezcla la fragancia en el Polisorbato 20 y se añade la Fase D a la Fase ABC mezclando tranquilamente a mano.

5. Se añade la Fase E a la Fase ABCD mezclando completamente a mano para asegurar una distribución total de las Florapearls y Florabeads en la mezcla de base.

REIVINDICACIONES

- 5 1. Uso de una composición que comprende sales alcalinas de ácidos grasos, glicerina y como mínimo 6% en peso de materiales insaponificables, composición que tiene un pH mayor que 7, como agente neutralizante para soluciones ácidas gelificantes, y un agente vehículo para aplicación tópica de materiales cosméticos, de productos farmacéuticos o agentes bioactivos.
- 10 2. El uso de la reivindicación 1, en el que los mencionados ácidos grasos son obtenibles del grupo que consiste en por aceite de semilla de amaranto, aceite de semilla de anís, aceite de semilla de aguacate, aceite de cebada, aceite de briza, aceite de trigo de ciervo, cera candelilla, cera carnauba, aceite de casia occidentales, aceite de haba de café, lecitina desoleada, aceite de cazón, cera de esparto, aceites de hongos y otros microorganismos, extracto de planta de guayule, aceite de jojoba, aceite de jurinea, lanolina, aceite de bayas de laurel, olestra, concentrado de aceite de oliva, aceite de semilla de oliva, aceite basto de naranja, cera de ouricuri, aceite de semilla de quinoa, aceite de germen de centeno, aceite de hígado de tiburón, manteca de karité, aceite de esperma de ballena, cera de caña de azúcar, cera de girasol, aceite de talol, destilado de aceite de talol y aceite de germen de trigo.
- 15 3. El uso de la reivindicación 1 o 2, en el que la composición comprende como mínimo 20% en peso de insaponificables.
4. El uso de la reivindicación 1 o 2, en el que la composición se añade a un agente gelificante ácido con el fin de neutralizar el agente gelificante y seguidamente se aplica la composición gelificada neutralizada resultante al cabello, la piel, las escamas o plumas de un sujeto animal.
- 20 5. Los usos de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en los que la composición se aplica a la piel humana, a superficies de plantas o superficies de madera, fibra o plástico.