

70.574/SZE

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

A2

KIVONAT

Lipoprotein krémek

A találmány tárgyát az olaj-a-vízben formájú emulzióban lévő kozmetikai és gyógyszerészeti krémek képezik, amelyek olajkomponensként legalább egy poláros olajat tartalmaznak, ahol a vízzel szemben a szóban forgó poláros olaj határfelületi feszültsége (γ^1) 25 °C-on kevesebb mint 30 mN/m, és emulgeálóként legalább egy növényi fehérjét tartalmaznak, ahol az olajos komponenssel szemben a szóban forgó növényi fehérje 1 tömeg%-os oldatának határfelületi feszültsége 25 °C-on (γ^2) kevesebb mint az olaj és a víz közötti γ^1 határfelületi feszültség. Emulgeálóként előnyben részesítjük a zabból, a búzából vagy a borsóból készült fehérjéket és fehérjetartalmú liszteket. Az olajkomponensek előnyösen az egyértékű vagy többértékű C₂-C₂₂ alkanolok C₈-C₂₂ zsírsavésztereinek, vagy az egyértékű vagy többértékű C₂-C₆ hidroxi-karbonsavak C₈-C₂₂ alkanolésztereinek csoportjába tartoznak.

UT

70.574/SZE

S.B.G. & K.
Nemzetközi
Szabadalmi Iroda
H-1062 Budapest, Andrássy út 113.
Telefon: 34-24-950, Fax: 34-24-323

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

Lipoprotein krémek

A találmány poláros olajkomponensek olaj-a-vízben emulziós formájának kozmetikai és gyógyszerészeti krémeire vonatkozik, amelyek emulgeálóként növényi fehérjét vagy a szemes magvú növényekből nyert fehérjegazdag lisztet tartalmaz. Az ilyen krémeket a szokásos ionos vagy hidrofil nem-ionos emulgeálók nélkül szerelik ki és ezért a tapasztalat szerint a bőrre különösen jó hatással vannak.

A hagyományos etoxilezett emulgeálókkal és foszfolipidekkel kombinációban a szójafehérjék alkalmazása a lipoprotein emulziók előállításában, például a élelmiszer- és sütőiparban, a 4,360,537 számú Amerikai Egyesült Államok-beli szabadalmi bejelentésből ismert. A kozmetikai emulziókban is gyakran fehérje emulgeálóként írják le. Így, például a WO 94/21222 szabadalmi bejelentésből ismert, hogy emulgeálóként a napvédő készítményekben növényi magvakból nyert fehérjetartalmú lisztet használnak fel. Valóban az ilyen emulziókról köztudott, hogy ha kiegészítő hidrofil emulgeálókat nem tartalmaznak, akkor stabilitásuk igen behatárolt.

A jelen találmány azon megfigyelésre alapul, hogy bizonyos növényi fehérjék vizes oldatban nem csak a víz felületi feszültségét csökkentik, azaz a víz/levegő határfelületi feszültséget, hanem a víz és az olajfázis között meglévő határfelületi feszültséget



is. Ha az olajfázis bizonyos polaritással rendelkezik, azaz a víz/olaj határfelületi feszültség 25 °C-on kevesebb mint 30 mN/m, akkor az ilyen fehérje készítményekkel igen stabilis olaj-a-vízben emulziók állíthatók elő. A jelen találmány feladata tehát abban áll, hogy megfelelő fehérje készítményeket és azoknak megfelelő olajkomponenseket találjon, melyek határfelületi tulajdonságaik alapján az O/V emulgeálók szokásos mellékhatásai nélkül stabilis emulziók előállítását lehetővé tegyék. Az ehhez alkalmas növényi fehérjét lipofil sajátosságai miatt a következőkben lipoproteinek nevezzük.

A találmány tárgyához tartoznak azok az olaj-a-vízben formájú emulzióban lévő kozmetikai és gyógyszerészeti krémek, amelyek legalább egy poláros olajat, melynek határfelületi feszültsége (γ^1) a vízzel szemben 25 °C-on kevesebb mint 30 mN/m, és emulgeálóként legalább egy növényi fehérjét tartalmaznak, mely 1 tömeg%-os oldatának (vagy diszperziójának) az olajos komponenssel szemben 25 °C-on a határfelületi feszültsége (γ^2) kevesebb mint az olaj és a víz közötti γ^1 határfelületi feszültség.

A kozmetikai krémek olyan összetételek, amelyek az olajkomponens tartalma alapján, vagy az olajkomponensben vagy a vizes fázisban feloldott hatóanyag révén a bőrre vagy a hajra fejti ki hatásukat. Így, bizonyos olajkomponensekről kimutatták, hogy hajlágító hatásúak. A megfelelő olajos kozmetikai hatóanyagok például a következők: ceramidok, ceramid analógok, vitaminok, például tokoferol vagy tokoferolészter, retionolészter,



például retionol-palmitát, szterinek, biszabolol, illatanyagok, olajos napfényvédő anyagok, seborr-statikumok és mások, ezek a bőr vagy a haj érzéki tulajdonságait javító, vagy a bőrt vagy a hajat védő anyagok. A megfelelő vízoldékony kozmetikai hatóanyagok például a karbamid, az allantoin, a vízoldékony vitaminok (aszkorbinsav), magnéziumsók, cukrok és poliolok, mint például a glicerín, a szorbit vagy a propilénglikol és a vízoldékony növényi kivonatok. Végül a vízoldékony fehérjékről magukról is köztudott, hogy kozmetikailag előnyösen hatnak a bőrre, amennyiben a bőrön nem zsíros, lipoprotein filmet alakítanak ki, ami jobb vízvisszatartási képességhez vezet.

Ezenkívül a találmány szerinti krémek a bőr vagy a fejbőr betegségeinek kezelésére olajban vagy vízben oldódó gyógyszerészeti vagy dermatológiai hatóanyagot is tartalmazhatnak.

Olajkomponensként különösen jó sajátságúak azok az olajok vagy olajkeverékek, melyek határfelületi feszültsége (γ^1) a vízhez 25 °C-on 5 és 20 mN/m közötti tartományban van, előnyösek a 6-tól 15 mN/m-t mutatók, tehát a közepestől a magasig terjedő polaritású olajok.

A megfelelő olajkomponensek azok, amelyek molekulájukban észtercsoportot tartalmaznak, például az egyértékű C₂-C₁₈-alkoholok zsírsavészterei, mint például az etil-sztearát, izopropil-sztearát, izopropil-mirisztát, butil-sztearát, hexil-laurát vagy sztearil-izononanoát, valamint a dikarbonsavészterek, mint például a di-n-butil-adipát vagy a diizooktil-szukcinát.

Előnyben részesítjük azokat az olajkomponenseket, amelyek az egy vagy többértékű C_2-C_6 alkoholok C_8-C_{22} zsírsavésztereinek, vagy az egyértékű vagy többértékű C_2-C_6 hidroxikarbonsavak $C_{12}-C_{22}$ alkoholésztereinek csoportjába tartoznak, vagy ezek keverékeit.

A többértékű C_2-C_6 -alkoholok C_8-C_{22} zsírsavésztereiknek például azok a zsírsavglicerid olajok felelnek meg, amelyek a növényi vagy állati olajokban előfordulnak, mint például az olivaolaj, a napraforgóolaj, a szójaolaj, a szezámolaj, a mogyoróolaj, a mandulaolaj, a bogáncsolaj. Kevésbé alkalmas például a ligetszépe olaja, melynek polaritása olyan magas, hogy magában is jelentős határfelületi feszültséget mutat (lásd a 07. készítményt). Az ilyen típusú észterek további megfelelő példái a következők: az 1,2-propilén-glikolok, a neopentil-glikolok, a trimetilolpropánok és a pentaeritrit-észterek zsírsavészterei.

Az egyértékű vagy többértékű hidroxikarbonsavak C_8-C_{22} zsíralkoholésztereinek példái közé mindenek előtt a glikolsav-, a tejsav-, az almasav- és a citromsav-észterei tartoznak.

Az ilyen észtereket, amelyek a $C_{14/15}$ -alkanolokon, valamint 2. helyzetben elágazó $C_{12/13}$ -alkanolokon alapulnak, a kereskedelemben a Fa-tól (Nordmann, Rassmann, GmbH & Co, Hamburg) Cosmacol®-Ester márkaneven szerezhetők be (előállító: Eni Chem. Augusta Industriale). A találmány szerinti lipoprotein krémek előállításához az ilyen észterek nem különösen jók, bár az is ismeretes, hogy további nagyon előnyös bőrkosmetikai hatásokat



mutatnak, mint például a sejtmegújulás gyorsítása és a bőréregedés lelassítása.

A találmány szerinti krémek emulgeálóként egy felületaktív növényi fehérjét (lipoproteint) tartalmaznak, amelyek az olajos komponenshez képest 1 tömeg%-os vizes oldatban az olaj és a víz határfelületi feszültségét csökkentik. Előnyben részesítjük az olyan növényi fehérje tartalmat, amely 1 tömeg%-os oldatban 25 °C-on a víz és az olajkomponens közötti határfelületi feszültséget ($\gamma^1 - \gamma^2$) legalább 2 mN/m-rel csökkenti.

A találmány szerinti olajkomponens követelményeinek megfelelő növényi fehérje bizonyítottan mindenek előtt a zabból, a borsóból, a szójából és a búzából nyerhető. De az is nyilvánvaló, hogy sok növényi eredetű fehérje, mint például mandulafehérje, mogyorófehérje és mindenek előtt gabonafehérje, hasonló módon megfelelhet.

A találmány szerinti fehérjék különböző tisztaságúak lehetnek. De a fehérjetartalomnak legalább 10 tömeg%-nak vagy annál magasabbnak kell lennie. A növényi fehérjék tisztítási és izolálási eljárásainak leírásai a szabadalmi szakirodalomban sok helyen megtalálhatók. Így, például az EP 620 979 A1 számú szabadalmi leírásban a zsírszegény zabfehérjék oldatainak előállítását ismerhetjük meg. Az EP 371 601 A2 számú szabadalmi bejelentésből egy másik felületaktív fehérjefrakció izolálási eljárása ismerhető meg, melyhez szintén zabot használtak fel. A 10-20 tömeg%-os fehérje koncentrátumok előállításának egyik eljárását,



melyet a lipid kísérőanyag hexános kivonatolásával állítanak elő, a WO 94/21222 A1 számú szabadalmi bejelentésben is leírták.

Nem szükséges, hogy a találmány szerinti fehérje vízben átlátszóan oldódjék. Ellenkezőleg, sokszor teljesen elegendő, ha a vízben 25 °C-on annyi fehérje oldódik fel, hogy a feloldódó fehérje tartalom révén a tiszta vízben oldott olajkomponenshez képest legalább 2mN/m határfelületi feszültsége legyen. Általában a vízben oldódó, illetve a vízben oldott fehérje a vizes fázisban legalább 0,1 tömeg%-os.

A találmány szerinti krémekben előnyben részesítjük a körülbelül 1-10 tömeg%-ban a fehérjék, vagy a fehérje tartalmú lisztek felhasználását. A találmány szerinti krémekben az olajkomponensek előnyösen 1-20 tömeg%-ban fordulnak elő.

Szükséges mennyiségben, további adalékanyagként, a találmány szerinti lipoprotein krémek szokásos gyógyszerészeti segédanyagokat tartalmazhatnak. Az ilyen segédanyagok például a vizes fázis sűrítőszerei, mint például a növényi gumi, a vízoldékony cellulózészter, a vízoldékony biopolimerek vagy a vízoldékony szintetikus polimerek, a rétegszilikátok vagy a pirogén kovasavak. A további segédanyagok közé a következők tartoznak: poliolok vagy glikolok, mint például a glicerin, az 1,2-propilén-glikol, az 1,3-butilén-glikol vagy a szorbit; konzerváló szerek, mint például az 1,5-pentándiol, a p-hidroxibenzoésav-észter, glicin vagy szorbinsav; komplexképzők (például Trilon B) és az antioxidánsok, valamint szín- és illatanyagok.

Bár sok esetben nem szükséges, mégis az emulziók stabilizálásának növelése érdekében előnyös lehet a poláros zsír vagy a víz-az-olajban emulgeálók együttes felhasználása. Előnyben részesítjük azokat koemulgeálókat, melyek a C₁₂-C₂₂ zsíralkoholok csoportjából származnak, mint például a cetil-/sztearilalkohol, vagy a C₂-C₆ poliolok részleges C₁₂-C₂₂ zsírsavészterei, amelyek az olajkomponensre vonatkoztatva 0,1-1 tömegrészben vannak.

Ezzel szemben a találmány szerinti krémek stabilizálásához az O/V típusú vízoldékony felületaktív anyagokra vagy emulgeálókra nincs szükség, és előnyösen ezek az 5 vagy annál magasabb HLB értékek esetében az ionos vagy hidrofil emulgeálóktól alapvetően mentesek.

A következő példák a találmány tárgyának részletesebb ismertetésére szolgálnak, anélkül hogy azt korlátoznák.

Példák

1. Példa

A határfelületi feszültség vizsgálata a olajkomponensek és a víz között 1 tömeg%-os vízben oldott fehérje oldatoknál

A következő kereskedelmi termékeket használtuk fel:

Fehérje készítmények:

P1	: Tech-O-6-020 MC	: hidrolizált zabfehérje
P2	: COS-152-11-A	: zabfehérje
P3	: COS-152-IS-A	: búzafehérje
P4	: Tech-O-6-40-L	: zab-fehérjekivonat
PS	: COS-151-2-A	: borsófehérje

P6 : Tech-O-11-070 : zabliszt (körülbelül 13 tömeg% fehérje).

Olajkomponensek:

Myritol®PC : Propilén-glikol dikaprilát/dikaprát

Kessco®IPS : Izopropil-sztearát

IPIS : Izopropil-izosztearát

Cetiol®MM : Mirisztil-mirisztát

Kevert olajkomponens:

Cosmacol®PLG : amely a következő vegyületek keveréke: di-C₁₂₋₁₃-alkil-tartarát, tri-C₁₂₋₁₃-alkil-citrát és kóvasav.

A további olajkomponensek összetételei (tömegrészben) :

	01	02	03	04	05	06	07	08
Myritol PC	1	1	1	1	1	1	1	1
Kessco IPS	2	2	-	2	2	2	2	1
IPIS	-	-	2	-	-	-	-	-
Cosmacol PLG	1	1	1	1	1	1	1	-
Bogáncsolaj	-	1	1	-	-	-	-	-
Mandulaolaj	-	-	-	1	-	-	-	-
Szezámolaj	-	-	-	-	1	-	-	-
Ricinusolaj	-	-	-	-	-	1	-	-
Ligetszépe olaj	-	-	-	-	-	-	1	-

A határfelületi feszültség mérése:

Olajkomponens	Határfelületi feszültség (mN/m) 25 °C	
	Víz (γ^1)	A vízben 1 tömeg% fehérje (γ^2)
Kessco IPS	27,8	17,7 (P1 fehérje)
		15,5 (P2 fehérje)
		15,8 (P3 fehérje)
		20,7 (P4 fehérje)
		11,4 (P5 fehérje)
		19,2 (P6 fehérje)
01	7,1	3,8 (P6 fehérje)
02	10,8	5,1 (P6 fehérje)
03	10,9	4,4 (P6 fehérje)
04	10,4	3,9 (P6 fehérje)
05	10,8	4,1 (P6 fehérje)
06	14,1	5,9 (P6 fehérje)
07	4,5	4,7 (P6 fehérje)
08	24,8	14,0 (P1 fehérje)
		15,3 (P2 fehérje)
		13,4 (P3 fehérje)
		18,6 (P4 fehérje)
		8,9 (P5 fehérje)
		9,4 (P6 fehérje)

A méréseket gyűrűs tenziométerrel mértük.

2. Példa

A találmány szerinti krémek (1-8)

Olajkomponens (01-08)	3,0 tömeg%
Myritol PC	3,5 tömeg%
Kessco IPS	6,0 tömeg%
Cosmacol PLG	3,0 tömeg%
Cetiol MM	2,5 tömeg%
Cutina MD-A	2,5 tömeg%
Stenol 16/18	2,0 tömeg%
Crodamol PMP	1,0 tömeg%
P6 vagy P5 fehérje	3,0 tömeg%
1,3-butilén-glikol	10,0 tömeg%
Glicin	1,0 tömeg%
Trilon B (EDTA)	0,2 tömeg%
Víz	kiegészítés 100 %-ig

A következő koemulgeálókat használtuk:

(1) Cutina®MD-A : Glicerín-mono-/di-palmitát/sztearát

(2) Stenol®1618 : Cetil-/sztearil-alkohol (1:2)

(3) Crodamol®PMP : PPG-2-mirisztol-éter-propionát

Előállítás:

A fehérje készítményt 60-80 °C-os meleg vízben, homogenizátor (Ultramax) segítségével feloldottuk (vagy duzzasztottuk). Majd a fehérjeforrást a 60-80 °C-ra melegített vizes fázissal (víz, 1,3-butilén-glikol, glicin, Trilon B) keveréssel egyesítettük.

Az olajkomponenseket és a koemulgeálókat összekevertük, és körülbelül 80 °C-ra felmelegítettük. Végül az olajfázist a melegített vizes fázissal egyesítettük és emulgeáltuk.

A stabilis emulzió kialakulása után, a készítményt 20 °C-ra lehűtve, egy nagy stabilitású sima krémet kaptunk. A 07-es olajkomponesszel labilis krém alakult ki.

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Olaj-a-vízben emulzió formában lévő kozmetikai és gyógyszerészeti krémek, amelyek olajkomponensenként legalább egy poláros olajat, ahol a vízzel szemben a poláros olaj határfelületi feszültsége (γ^1) 25 °C-on kevesebb mint 30 mN/m, és emulgeálóként legalább egy növényi fehérjét tartalmaz, ahol az olajkomponenssel szemben a növényi fehérje 1 tömeg%-os oldatának határfelületi feszültsége 25 °C-on (γ^2) kevesebb mint az olaj és a víz közötti γ^1 határfelületi feszültség, és amelyek alapvetően mentesek az ionos vagy hidrofil emulgeálóktól, amelyek 5 vagy annál magasabb HLB értékűek.

2. Az 1. igénypont szerinti kozmetikai és gyógyszerészeti krémek, melyekben poláros olajkomponensként különösen jó sajátságúak azok az olajok vagy olajkeverékek, melyek határfelületi feszültsége (γ^1) a vízhez 25 °C-on 5 és 20 mN/m közötti tartományban van, előnyösek a 6-tól 15 mN/m-t mutatók.

3. Az 1. vagy a 2. igénypont szerinti kozmetikai és gyógyszerészeti krémek, melyekben emulgeálóként egy felületaktív növényi fehérjét tartalmaznak, amely 1 tömeg%-os oldatban 25 °C-on a víz és az olajkomponens közötti határfelületi feszültséget ($\gamma^1 - \gamma^2$) legalább 2 mN/m-rel csökkenti.

4. Az 1-3. igénypontok bármelyike szerinti kozmetikai és gyógyszerészeti krémek, amelyek a fehérjét a zabból, búzából vagy borsóból készült fehérje kivonatként, vagy ezen növények

fehérjetartalmú lisztjeként több mint 10 tömeg%-ban tartalmaz-
zák.

5. Az 1-4. igénypontok bármelyike szerinti kozmetikai és
gyógyszerészeti krémek, amelyekben az olajkomponensek elő-
nyösen az egy vagy többértékű C_2 - C_6 alkoholok C_8 - C_{22} zsírsavész-
tereinek, vagy az egyértékű vagy többértékű C_2 - C_6 hidroxikar-
bonsavak C_{12} - C_{22} alkoholésztereinek csoportjába tartoznak, vagy
ezek keverékei.

6. Az 1-5. igénypontok bármelyike szerinti kozmetikai és
gyógyszerészeti krémek, amelyekben a koemulgeátorok a C_{12} - C_{22}
zsíralkoholok csoportjából származnak, vagy a C_2 - C_6 poliolok
részleges C_{12} - C_{22} zsírsavészterei, amelyek a szóban forgó koemul-
geálókból az olajkomponensre vonatkoztatva 0,1-1 tömegrészt
tartalmaznak.

7. Az 1-6. igénypontok bármelyike szerinti kozmetikai és
gyógyszerészeti krémek, amelyek alapvetően mentesek az ionos
vagy hidrofil emulgeálóktól, amelyek 5 vagy annál magasabb HLB
értékűek.

A meghatalmazott

ifj. Szentpéteri Ádám
szabadalmi ügyvivő
S. G. & K. Nyelvtörőzi
Szabadalmi Iroda tagja
H-1032 Budapest, Andrássy út 113.
Telefon: 34-24-950; Fax: 34-24-323

vaj nem
CT