

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 797 094**

51 Int. Cl.:

A61K 9/16 (2006.01)
A61K 36/18 (2006.01)
A23L 5/00 (2006.01)
A23L 27/00 (2006.01)
A23L 33/105 (2006.01)
A23P 10/40 (2006.01)
A61K 36/736 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **09.09.2016 PCT/EP2016/071320**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **16.03.2017 WO17042340**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.09.2016 E 16766894 (6)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.05.2020 EP 3346992**

54 Título: **Procedimiento de producción de una formulación que comprende extractos vegetales terapéuticamente activos o nutritivos**

30 Prioridad:

09.09.2015 EP 15184393

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
01.12.2020

73 Titular/es:

**DSM IP ASSETS B.V. (100.0%)
Het Overloon 1
6411 TE Heerlen, NL**

72 Inventor/es:

**BECK, MARKUS;
BULBARELLO, ANDREA;
PRUDENCE, KEVIN;
SCHWEIKERT, LONI y
URBAN, KAI**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 797 094 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

Procedimiento de producción de una formulación que comprende extractos vegetales terapéuticamente activos o nutritivos

5 Esta invención se refiere a un procedimiento para producir formulaciones sólidas. Estas formulaciones sólidas comprenden extractos vegetales terapéuticamente activos o nutritivos, que son conocidos por ser de mal sabor. Estas nuevas formulaciones sólidas tienen un sabor neutro. Además, la presente invención se refiere a estas formulaciones sólidas, así como a su uso en la producción de alimentos, piensos, suplementos nutricionales y productos para el cuidado personal.

10 Los extractos vegetales terapéuticamente activos o nutritivos son importantes, y algunos de ellos incluso esenciales para una dieta buena y saludable (tanto para seres humanos como para animales). Se sabe formular tales extractos vegetales en diversas formas.

Con la expresión "extractos vegetales terapéuticamente activos o nutritivos" queremos decir que los extractos vegetales tienen un efecto positivo (en seres humanos y/o animales) cuando se administran por vía oral o externa.

15 El extracto de la planta puede ser de cualquier parte de una planta, tal como las raíces, las hojas, las varillas, las bayas, etc.

Los extractos vegetales se pueden obtener mediante procedimientos comúnmente conocidos. Dichos procedimientos pueden ser químicos y/o físicos. El extracto puede obtenerse por extracción química (por ejemplo, de las raíces u hojas) o puede ser el jugo de una baya (exprimida), que entonces se seca.

20 El problema que ocurre con la formulación sólida de tales extractos vegetales es que necesitan protegerse contra la descomposición (para que el contenido del extracto vegetal sea estable durante un período de tiempo razonable), pero también algunos de los extractos vegetales terapéuticamente activos o nutritivos saben horrible o muy fuerte (especialmente para los seres humanos). La estabilidad de almacenamiento, así como el problema del sabor, es un problema cuando el extracto de la planta se formula en una composición, que es utilizada (o consumida) por un cliente. Una formulación sólida, que está "libre de sabor", se puede aplicar mejor en productos de consumo.

25 El extracto es de acerola. La acerola (*Malpighia puniceifolia*) es un arbusto frutal o árbol pequeño, que generalmente es nativo de América del Sur, Méjico y América Central. El extracto se obtiene de las bayas de la planta.

Un problema importante es que algunos de los extractos vegetales terapéuticamente activos o nutritivos tienen un sabor horrible (cuando se toman por vía oral).

30 Por lo tanto, existe la necesidad de una formulación sólida mejorada, en la que los extractos vegetales terapéuticamente activos o nutritivos no interactúen significativamente con ingredientes sensibles en alimentos, piensos, suplementos nutricionales o aplicaciones de cuidado personal, así como también, cuando se añade a un producto final de mercado, no tiene un sabor horrible para el consumidor.

Sorprendentemente, encontramos una forma de producir tales formulaciones sólidas que pueden evitar las desventajas mencionadas anteriormente.

35 La presente invención se refiere, según las reivindicaciones adjuntas, a un procedimiento para la producción de una formulación sólida, en el que la formulación sólida comprende al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo y al menos un material lipófilo (especialmente monoestearato de glicerol, cuyo nombre IUPAC es octadecanoato de 2,3-dihidroxipropilo).

40 Por lo tanto, la presente invención se refiere a un procedimiento (P) para la producción de una formulación sólida, en el que la formulación sólida comprende

(i) 20 - 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo, en el que el extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo es un extracto vegetal de acerola, y

45 (ii) 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un material lipófilo, en el que el material lipófilo son ceras y grasas escogidas del grupo que consiste en monoestearato de glicéridos, cera de carnauba, cera de candelilla, ácido palmítico, ácido esteárico, aceite de semilla de algodón hidrogenado, y aceite de colza hidrogenado, caracterizado por que

(a) al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo se suspende en el al menos un material lipófilo líquido, y

(b) esta suspensión se atomiza en una torre de pulverización, en la que el aire tiene una temperatura de -10° a 40°C, en la que el material lipófilo solidifica.

5 La nueva y mejorada formulación sólida también tiene las ventajas adicionales de que la formulación sólida es fácil de producir (tecnología de pulverización convencional), la formulación sólida tiene excelentes propiedades para enmascarar los sabores agrios/amargos, la formulación sólida es un polvo no pegajoso, y el extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo está muy bien protegido contra la humedad.

El extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo es un extracto vegetal de acerola.

En una realización preferida, la cantidad de este extracto vegetal es 20 - 35% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida.

10 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P1), que es el procedimiento (P), en el que el extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo es un extracto vegetal de acerola.

En una realización preferida, la cantidad del extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo en la formulación sólida es 20 - 35% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida.

15 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P2), que es el procedimiento (P) o (P1), en el que la cantidad de la planta terapéuticamente activa o nutritiva en la formulación sólida es 20 - 35% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida.

En una realización preferida, la cantidad del material lipófilo en la formulación sólida es 65 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida.

20 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P3), que es el procedimiento (P), (P1) o (P2), en el que el material lipófilo en la formulación sólida es 65 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida.

El material lipófilo, en el contexto de la presente invención, son ceras así como también grasas.

25 Las ceras son compuestos orgánicos que característicamente consisten en largas cadenas de alquilo. Las ceras naturales (plantas, animales) son típicamente ésteres de ácidos grasos y alcoholes de cadena larga. Las ceras sintéticas son hidrocarburos de cadena larga que carecen de grupos funcionales.

30 Las grasas consisten en un amplio grupo de compuestos que generalmente son solubles en disolventes orgánicos y en gran medida insolubles en agua. Las grasas hidrogenadas (o grasas saturadas), en el contexto de la presente invención, son generalmente triésteres de glicerol y ácidos grasos. Los ácidos grasos son cadenas de átomos de carbono e hidrógeno, con un grupo de ácido carboxílico en un extremo. Dichas grasas pueden tener origen natural o sintético. Es posible hidrogenar una grasa (poli)insaturada para obtener una grasa hidrogenada (saturada).

Las ceras y grasas especialmente adecuadas tienen un punto de goteo de 30 a 90°C, preferiblemente 40 a 80°C. Las ceras, en el contexto de la presente invención, son compuestos orgánicos que característicamente consisten en largas cadenas de alquilo. Las ceras naturales (plantas, animales) son típicamente ésteres de ácidos grasos y alcoholes de cadena larga. Las ceras sintéticas son hidrocarburos de cadena larga que carecen de grupos funcionales.

35 El punto de goteo de un material es aquella temperatura (en °C) cuando el material comienza a fundirse en condiciones estandarizadas. El material se calienta tanto tiempo hasta que cambia el estado de la materia de sólido a líquido. El punto de goteo es la temperatura a la que se libera la primera gota del material. La determinación del punto de goteo (Tropfpunkt) se lleva a cabo como se describe en la norma estándar DIN ISO 2176.

40 Las ceras y grasas adecuadas para la presente invención son monoestearato de glicerina, cera de carnauba, cera de candelilla, ácido palmítico, ácido esteárico, aceite de semilla de algodón hidrogenado y aceite de colza hidrogenado. Estos compuestos pueden usarse como tales o como mezclas.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P4), que es el procedimiento (P), (P1), (P2) o (P3), en el que el material lipófilo son ceras y grasas que tienen un punto de goteo de 30 a 90°C, preferiblemente 40 a 80°C.

45 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P4'), que es el procedimiento (P4), en el que el material lipófilo son ceras y grasas escogidas del grupo que consiste en monoestearato de glicerina, cera de carnauba, cera de candelilla, ácido palmítico, ácido esteárico, aceite de semilla de algodón hidrogenado y aceite de colza hidrogenado. Estos compuestos pueden usarse como tales o como mezclas.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P4''), que es el procedimiento (P4) o (P4'), en el que el material lipófilo es monoestearato de glicerina.

Está claro que el material lipófilo, que no está en estado líquido, necesita fundirse antes de usarse en el procedimiento según la presente invención.

- 5 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P5), que es el procedimiento (P), (P1), (P2), (P3), (P4), (P4') o (P4''), en el que el material lipófilo, que es sólido a temperatura ambiente, se funde antes de usarse en el procedimiento.

10 Para fundir el material lipófilo, generalmente se escoge una temperatura superior a 30°C. La temperatura depende del punto de fusión o goteo del material lipófilo. Un intervalo habitual y también preferido está entre 50°C y 100°C (más preferiblemente 60°C-100°C).

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P5'), que es el procedimiento (P5), en el que el material lipófilo, que es sólido a temperatura ambiente, se calienta a una temperatura superior a 30°C antes de usarse en el procedimiento.

- 15 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P5''), que es el procedimiento (P5), en el que el material lipófilo, que es sólido a temperatura ambiente, se calienta hasta una temperatura de entre 50°C y 100°C (más preferiblemente entre 60°C y 100°C).

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P5'''), que es el procedimiento (P5), en el que el material lipófilo, que es sólido a temperatura ambiente, se calienta hasta una temperatura de entre 60°C y 100°C.

- 20 Los tamaños promedio de partícula (d50) de las partículas de la formulación sólida obtenida por cualquiera de los procedimientos (P), (P1), (P2), (P3), (P4), (P4'), (P4''), (P5), (P5'), (P5'') y/o (P5''') generalmente están entre 40 y 500 µm. Los tamaños promedio de partícula (d50) se mide con un MALVERN MasterSizer3000 (para todos los valores de la presente solicitud de patente).

- 25 El extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo se suspende usual y preferiblemente en el material lipófilo líquido bajo agitación.

En la etapa (b) del procedimiento según la presente invención, la suspensión (formada a partir del al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo y el al menos un material lipófilo) se atomiza en una torre de pulverización, en la que el aire (dentro de la torre de pulverización) tiene una temperatura tal que el material lipófilo solidifica.

Esta temperatura es de -10° a 40°C.

- 30 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P6'), que es el procedimiento (P), (P1), (P2), (P3), (P4), (P4'), (P4''), (P5), (P5'), (P5'') o (P5'''), en el que la suspensión se atomiza en una torre de pulverización, en la que el aire tiene una temperatura inferior a 40°C.

- 35 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P6'''), que es el procedimiento (P), (P1), (P2), (P3), (P4), (P4'), (P4''), (P5), (P5'), (P5'') o (P5'''), en el que la suspensión se atomiza en una torre de pulverización, en la que el aire tiene una temperatura de -10° a 40°C.

La formulación sólida según la presente invención también puede comprender otros ingredientes, que pueden ser útiles para la formulación sólida, para la producción de la formulación sólida, y/o el uso de la formulación sólida.

- 40 Estos otros ingredientes se pueden añadir en cualquier etapa al procedimiento según la presente invención. Esto significa que se pueden añadir al extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo y/o al material lipófilo y/o a la suspensión. Opcionalmente, también se puede usar algún compuesto auxiliar en el procedimiento de secado por pulverización.

Además, la presente invención se refiere a un procedimiento en el que la formulación sólida consiste en

- 45 (i) 20 - 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo, en el que el extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo es un extracto vegetal de acerola, y

(ii) 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de monoestearato de glicerol.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P7), que es el procedimiento (P), (P1), (P2), (P3), (P4), (P4'), (P4''), (P5), (P5'), (P5''), (P5'''), (P6), (P6'), (P6'') o (P6'''), en el que la formulación sólida consiste en

(i) 20 – 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo, en el que el extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo es un extracto vegetal de acerola, y

(ii) 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de monoestearato de glicerol.

5 Una realización muy preferida es el siguiente procedimiento, en el que

(a) se funden 20 - 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de monoestearato de glicerol a una temperatura entre 60°C y 100°C, y

(b) se suspenden 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de extracto vegetal de acerola en el monoestearato de glicerol fundido (por agitación), y después posteriormente

10 (c) esta suspensión se atomiza en una torre de pulverización, en la que el aire (en la torre de pulverización) tiene una temperatura inferior a 40°C.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento (P8), en el que

(a) se funden 20 - 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de monoestearato de glicerol a una temperatura entre 60°C y 100°C, y

15 (b) se suspenden 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de extracto vegetal de acerola en el monoestearato de glicerol fundido (por agitación), y después posteriormente

(c) esta suspensión se atomiza en una torre de pulverización, en la que el aire (en la torre de pulverización) tiene una temperatura inferior a 40°C.

20 Como se señala anteriormente, la formulación sólida obtenida por el procedimiento según la presente invención está en forma de polvo.

También se describe en el presente documento una formulación sólida (F1), que comprende

(i) 20 - 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo, y

(ii) 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un material lipófilo.

25 La formulación sólida nueva y mejorada también tiene las ventajas adicionales de que la formulación sólida es fácil de producir (tecnología de pulverización convencional), la formulación sólida tiene excelentes propiedades para enmascarar sabores agrios/amargos o astringentes, la formulación sólida es un polvo no pegajoso, y el un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo está muy bien protegido contra la humedad.

El extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo es un extracto vegetal de acerola.

30 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una formulación sólida (F2), que es la formulación (F1), en la que el extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo es un extracto vegetal de acerola.

En una realización preferida, la cantidad de este extracto vegetal es 20 - 35% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida.

35 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una formulación sólida (F3), que es la formulación (F1) o (F2), en la que la cantidad de extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo es 20 - 35% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida.

En una realización preferida, la cantidad del material lipófilo es 65 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida.

40 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una formulación sólida (F4), que es la formulación (F1), (F2) o (F3), en la que el material lipófilo es 65 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una formulación sólida (F5), que es la formulación (F1), (F2), (F3) o (F4), en la que el material lipófilo son ceras y grasas que tienen un punto de goteo de 30 a 90°C, preferiblemente 40 a 80°C.

45 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una formulación sólida (F5'), que es la formulación (F5), en la que el material lipófilo son ceras y grasas escogidas del grupo que consiste en monoestearato de glicerina, cera de

carnauba, cera de candelilla, ácido palmítico, ácido esteárico, aceite de semilla de algodón hidrogenado y aceite de colza hidrogenado. Estos compuestos pueden usarse como tales o como mezclas.

Por lo tanto, la presente invención se refiere a una formulación sólida (F5''), que es la formulación (F5) o (F5'), en la que el material lipófilo es monoestearato de glicerina.

- 5 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una formulación sólida (F6), que es la formulación (F1), (F2), (F3), (F4) o (F5), en la que los tamaños promedio de partícula (d50) de las partículas de la formulación sólida según la presente invención están entre 40-500 µm.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una formulación sólida (F7), que consiste en

- 10 (i) 20 - 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo, y

(ii) 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de monoestearato de glicerol.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una formulación sólida (F7), que consiste en

- (i) 20 - 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de un extracto vegetal de acerola, y

- 15 (ii) 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de monoestearato de glicerol.

Las formulaciones sólidas (F1), (F2), (F3), (F4), (F5), (F6), (F6'), (F6''), (F7) y (F8) según la presente invención pueden usarse como tales, o pueden usarse en cualquier otra composición.

- 20 Las formulaciones sólidas (F1), (F2), (F3), (F4), (F5), (F6), (F6'), (F6''), (F7) y (F8) como tales, o preferiblemente las formulaciones (F1), (F2), (F3), (F4), (F5), (F6), (F6'), (F6''), (F7) y (F8) incorporadas en otra composición, pueden usarse como alimento, piensos, suplementos nutricionales y/o productos para el cuidado personal.

Se prefiere el uso de al menos una formulación sólida (F1), (F2), (F3), (F4), (F5), (F6), (F6'), (F6''), (F7) y (F8) en la producción de composiciones alimentarias y/o de piensos.

La cantidad de la formulación sólida (F1), (F2), (F3), (F4), (F5), (F6), (F6'), (F6''), (F7) y/o (F8), en el producto del consumidor final, depende de la aplicación y la demanda del consumidor.

- 25 Además, la presente invención se refiere a alimentos, piensos, suplementos nutricionales y/o productos para el cuidado personal que comprenden al menos una formulación sólida (F1), (F2), (F3), (F4), (F5), (F6), (F6'), (F6''), (F7) y (F8).

Estos productos pueden estar en cualquier forma comúnmente conocida y utilizada.

Los siguientes ejemplos sirven para ilustrar la invención.

30 Ejemplos

Ejemplo 1: Acerola 33%

Derrítanse 16,00 kg de monoestearato de glicerol en una vasija agitada a 65-85°C.

- 35 Suspéndanse 8,00 kg de acerola en polvo al 20% de vitamina C en el monoestearato de glicerol fundido mediante agitación normal hasta que se forme una suspensión homogénea (aprox. 20 - 40 min). Manténgase una temperatura del producto de 65 - 85°C.

Aliméntese la suspensión a una torre de pulverización en la que un atomizador generará gotas de un tamaño adecuado fuera de la suspensión. La torre de pulverización debe funcionar a una temperatura del aire de 25°C para solidificar las gotas atomizadas de la suspensión.

Recójase el producto solidificado (polvo).

40

REIVINDICACIONES

1. Procedimiento para la producción de una formulación sólida, que comprende
- 5 (i) 20 - 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo, en el que el extracto vegetal terapéuticamente activo nutritivo es un extracto vegetal de acerola, y
- (ii) 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un material lipófilo, en el que el material lipófilo son ceras y grasas escogidas del grupo que consiste en monoestearato de glicerina, cera de carnauba, cera de candelilla, ácido palmítico, ácido esteárico, aceite de semilla de algodón hidrogenado y aceite de colza hidrogenado, caracterizado por que
- 10 (a) el material lipófilo se añade en su estado líquido, y
- (b) al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo se suspende en el material lipófilo fundido, y
- (c) la suspensión se atomiza en una torre de pulverización, en la que el aire tiene una temperatura de -10° a 40°C.
- 15 2. El procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que el material lipófilo es monoestearato de glicerol.
3. El procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que se usa 20 - 35% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo.
- 20 4. El procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que se usa 65 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un material lipófilo.
5. El procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que los tamaños promedio de partícula (d50) de las partículas de la formulación sólida están entre 40 - 500 µm.
6. El procedimiento según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que la formulación sólida consiste en
- 25 (i) 20 - 40% en peso (% en peso), basado en el peso total de la formulación sólida, de al menos un extracto vegetal terapéuticamente activo o nutritivo, y
- (ii) 60 - 80% en peso, basado en el peso total de la formulación sólida, de monoestearato de glicerol.