



República Federativa do Brasil
Ministério do Desenvolvimento, Indústria
e do Comércio Exterior
Instituto Nacional da Propriedade Industrial.

(21) **PI0906282-3 A2**

(22) Data de Depósito: 18/12/2009
(43) Data da Publicação: 26/04/2011
(RPI 2103)



(51) Int.Cl.:
A61K 8/35
A61K 8/97
A61Q 19/04

(54) Título: **COMPOSIÇÕES QUE COMPREENDEM AGENTES DE AUTOBRONZEAMENTO E EXTRATOS DE PLANTAS**

(30) Prioridade Unionista: 19/12/2008 US 12/339,550,
30/11/2009 US 12/627,164

(73) Titular(es): Johnson & Johnson Consumer Companies, Inc.

(72) Inventor(es): Melba L. Kiser, Rudy Clemente

(57) Resumo: COMPOSIÇÕES QUE COMPREENDEM AGENTES DE AUTOBRONZEAMENTO E EXTRATOS DE PLANTAS A presente invenção refere-se a uma composição para escurecimento da pele. A composição inclui um agente de autobronzeamento e um extrato de planta selecionado do grupo que consiste em extrato de sementes de soja pré-germinada, extrato de semente de noz, extrato de artemísia, e combinações dos mesmos. Em um outro aspecto, um método de escurecimento da pele inclui aplicar topicamente a composição acima à pele.



PI0906282-3

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para
**"COMPOSIÇÕES QUE COMPREENDEM AGENTES DE AUTOBRONZE-
AMENTO E EXTRATOS DE PLANTAS".**

CAMPO DA INVENÇÃO

5 A presente invenção refere-se a uma composição e a um método para escurecimento da pele. A composição inclui um agente de autobronzeamento e uma quantidade eficaz para o escurecimento da pele de um extrato selecionado do grupo que consiste em extrato de sementes de soja pré-germinada, extratos de árvore de noz, extrato de artemísia, e
10 combinações dos mesmos.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

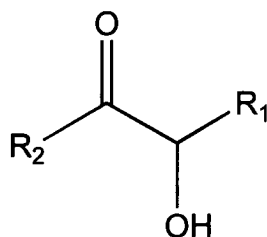
 Muitos indivíduos desejam o escurecimento da cor da pele. A maioria das pessoas obtêm uma pele mais escura através da exposição à luz UV (por exemplo, bronzamento solar ou lâmpadas UV). A exposição
15 UV, entretanto, resulta em um acelerado envelhecimento da pele e aumenta a incidência de câncer de pele. A capacidade de gerar uma aparência bronzeada ou escurecida sem incorrer em fotodano é, portanto, importante. Consequentemente, métodos alternativos para o "bronzamento sem sol" têm evoluído.

20 Produtos contendo di-hidroxiacetona (DHA) são bem conhecidos como bronzadores sem sol. Esses produtos, entretanto, produzem uma cor que em geral desenvolve-se muito lentamente e/ou é bastante intensa ou tem uma aparência que é de certa forma diferente de um bronzeado natural "derivado da luz solar".

25 Os requerentes descobriram inesperadamente que extrato de sementes de soja pré-germinada, extrato de árvore de noz e extrato de artemísia fornecem benefícios de escurecimento da pele quando usados topicamente em conjunto com um agente de autobronzeamento.

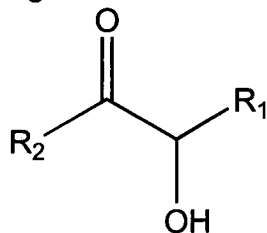
SUMÁRIO DA INVENÇÃO

30 A invenção fornece uma composição que compreende: (a) um agente de autobronzeamento que tem a seguinte fórmula:



em que R_1 é H, CH_2OH , CHOHCH_2OH , $\text{CH}(\text{OH})\text{CH}(=\text{O})$, $\text{CH}(\text{NH}_2)\text{CH}(=\text{O})$, $\text{CH}(\text{OCH}_3)\text{CH}(=\text{O})$, ou $\text{CH}(\text{NH-fenil})\text{CH}(=\text{O})$; e R_2 é H ou CH_2OH ; e (b) um extrato selecionado do grupo que consiste em extrato de sementes de soja pré-germinada, extrato de árvore de noz, extrato de artemísia, e combinações dos mesmos. Em uma modalidade específica o extrato inclui um extrato de sementes de soja pré-germinada.

De acordo com um outro aspecto, a invenção apresenta um método para escurecimento da pele, o dito método compreendendo a administração tópica na pele de uma composição compreendendo (a) um agente autobronzeador que tem a seguinte fórmula:



em que R_1 é H, CH_2OH , CHOHCH_2OH , $\text{CH}(\text{OH})\text{CH}(=\text{O})$, $\text{CH}(\text{NH}_2)\text{CH}(=\text{O})$, $\text{CH}(\text{OCH}_3)\text{CH}(=\text{O})$, ou $\text{CH}(\text{NH-fenil})\text{CH}(=\text{O})$; e R_2 é H ou CH_2OH ; e

(b) um extrato selecionado do grupo que consiste em extrato de sementes de soja pré-germinada, extrato de árvore de noz, extrato de artemísia, e combinações dos mesmos.

Outras características e vantagens da presente invenção serão aparentes a partir da descrição detalhada da invenção e das reivindicações.

DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

Acredita-se que o versado na técnica poderá, com base na presente descrição, utilizar a presente invenção em sua mais completa extensão. As seguintes modalidades específicas devem ser construídas como meramente ilustrativas e não como limitativas do restante da descrição em qualquer maneira que seja.

A menos que seja definido de outro modo, todos os termos técnicos e científicos usados aqui têm o mesmo significado conforme compreendido pelo versado na técnica à qual a invenção pertence. Também, todas as publicações, pedidos de patentes, patentes e outras referências mencionadas na presente invenção estão aqui incorporadas a título de referência. Exceto onde indicado em contrário, uma porcentagem refere-se a uma porcentagem em peso (isto é, % (p/p)).

As composições da presente invenção são geralmente adequadas para o escurecimento da pele. Para uso na presente invenção, "escurecimento" é escurecer a aparência da pele ou cabelo humanos, incluindo, mas não se limitando a, escurecimento da pele humana para alcançar um efeito "bronzeado solar" para cobrir áreas claras da pele (por exemplo, como resultado de uma cicatriz ou doença ou terapia) ou escurecimento da cor natural do cabelo ou restauração de cabelos descoloridos devido ao envelhecimento (por exemplo, cabelo grisalho ou branco) ou agressões externas (por exemplo, exposição excessiva ao sol ou cloro). Embora toda a referência do relatório descritivo seja feita ao escurecimento da pele, acredita-se que outros materiais corporais queratinosos, como o cabelo, possam também ser escurecidos.

Para uso na presente invenção, "produto" é um produto acabado na forma embalada. Em uma modalidade, a embalagem é um recipiente como um plástico, metal ou tubo de vidro ou pote contendo a composição. O produto pode, ainda, conter uma embalagem adicional como uma caixa de papelão ou de plástico para armazenar o recipiente. Em uma modalidade, o produto compreende uma composição da invenção e contém instruções de direcionamento do usuário para aplicação da composição na pele ou cabelo para escurecer a pele (por exemplo, para bronzear a pele), igualar a tonalidade da pele (por exemplo, escurecer áreas claras da pele ou tratar ou evitar a hiperpigmentação mosqueada), ou escurecer o cabelo (por exemplo, para escurecer cabelos castanhos claros, louros, grisalhos ou brancos). Tais instruções podem estar impressas no recipiente, no elemento de inserção de rótulo, ou sobre qualquer embalagem adicional.

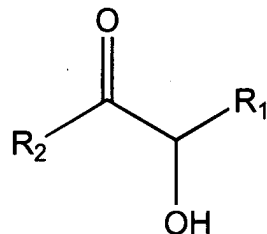
Para uso na presente invenção, "aplicar topicamente" significa pôr diretamente ou espalhar sobre a pele externa, couro cabeludo, ou cabelo, por exemplo, pelo uso das mãos ou com um aplicador como um lenço, um aplicador de esfera, ou por aspersão.

5 Para uso na presente invenção, "cosmeticamente aceitável" significa que os ingredientes que o termo descreve são adequados ao uso em contato com tecidos (por exemplo, pele ou cabelo) sem toxicidade, incompatibilidade, instabilidade, irritação, ou respostas alérgicas, ou similares.

10 Para uso na presente invenção, uma "quantidade eficaz para o escurecimento da pele significa uma quantidade suficiente para induzir um escurecimento da pele ou cabelo humanos. Essa quantidade variará com a área que está sendo tratada, a idade e o tipo de pele ou cabelo do usuário final, a duração e a natureza do tratamento, a composição específica
15 empregada, o veículo utilizado, e fatores similares.

Agente de autobronzeamento

As composições da invenção compreendem um agente de autobronzeamento, isto é, uma agente químico capaz de produzir ou induzir o processo de bronzeamento artificial da pele pela formação de pigmentos
20 marrons na pele, por exemplo, através de reação de Maillard relatada em Bobin, et al., J. Soc. Cosmet. Chem., 35:265 a 72 (1984). Em particular, o agente de autobronzeamento é uma α -hidróxi cetona ou aldeído com a seguinte fórmula:



em que R_1 é H, CH_2OH , CHOHCH_2OH , $\text{CH}(\text{OH})\text{CH}(\text{=O})$,
25 $\text{CH}(\text{NH}_2)\text{CH}(\text{=O})$, $\text{CH}(\text{OCH}_3)\text{CH}(\text{=O})$, ou $\text{CH}(\text{NH-fenil})\text{CH}(\text{=O})$; e R_2 é H ou CH_2OH . Exemplos desse composto incluem 1,3-di-hidroxiacetona (isto é, di-hidroxiacetona, DHA) e 1,3,4-tri-hidróxi-2-butanona (isto é, eritrulose). Em uma modalidade preferencial, o agente de autobronzeamento é 1,3-di-

hidroxiacetona.

A quantidade de agente de autobronzeamento nas composições da invenção varia de cerca de 0,1 a cerca de 10, de preferência de cerca de 1 a cerca de 5, com mais preferência de cerca de 2 a cerca de 5 por cento em peso com base no peso total da composição.

Extrato de planta

De acordo com a invenção, a composição também compreende um extrato de planta em quantidade eficaz para o escurecimento da pele. O extrato de planta (filo *Plantae*) é selecionado do grupo que consiste em extrato de sementes de soja pré-germinada, extrato de árvore de noz, extrato de artemísia e combinações dos mesmos. Os requerentes encontraram que pela utilização dos extratos acima mencionados um é capaz de acentuar significativamente os efeitos do agente de autobronzeamento.

O que entende-se por um "extrato a partir de sementes de soja pré-germinada" é uma mistura de compostos isolados a partir de sementes de planta de soja, por exemplo de *Glycine soya*). O extrato de semente de soja pré-germinada pode ser preparado de maneira suave de modo a omitir uma ou mais de certas etapas (por exemplo, extração de solvente não-aquoso, processamento de álcali, e/ou aquecimento em alta temperatura) comumente usadas para produzir hidrolisados de proteína de soja total convencional.

Em uma outra modalidade o processo para extração de proteína de soja é o assim chamado processo de "suspensão de células únicas" que inclui a separação das células individuais por meio de um processo enzimático para degradar a celulose na parede celular externa, mas deixar as paredes celulares internas intactas.

Um extrato particularmente adequado de sementes de soja pré-germinada é disponível comercialmente junto a Gattefosse de Saint-Priest, França, e vendido sob o nome de "Phylderm Vegetal C," e é descrito como um complexo amino-peptídico produzido a partir de tecidos embrionários de soja preparados com técnicas de seleção molecular e enzimática.

A quantidade do extrato de sementes de soja pré-germinada presente na composição para escurecimento da pele desta invenção é de cerca de 0,001% a cerca de 20%, e de preferência cerca de 0,01% a cerca de 10% e, com mais preferência ainda, de cerca de 1,5% a cerca de 3% em peso da composição.

A expressão "extrato de semente de noz" significa um extrato de uma semente de qualquer uma das espécies de plantas da família *Juglandaceae*. Exemplos incluem: *Juglans regia*, *Juglans sigillata*, *Juglans australis*, *Juglans brasiliensis*, *Juglans californica*, *Juglans hindsii*, *Juglans hirsuta*, *Juglans jamaicensis*, *Juglans major*, *Juglans microcarp*, entre outras.

Um extrato de semente de noz adequado é uma mistura de água e semente de *Juglans regia* (noz) com um conteúdo de matéria seca de 27% a 33%, comercialmente disponível junto a Gattefosse de Saint-Priest, França e vendido sob o nome "Gatuline Age Defense."

A quantidade de extrato de semente de noz presente na composição para o escurecimento da pele desta invenção é de cerca de 0,001% a cerca de 20%, de preferência cerca de 0,01% a cerca de 10% e, com mais preferência ainda, de cerca 1,5% a cerca de 3% em peso, em peso da composição.

A expressão "extrato de artemísia" significa um extrato de uma planta a partir do gênero *Artemesia*, como *Artemesia vulgaris* e também chamada de losna comum, erva de felon, semente de crisântemo, losna selvagem, ou planta de São João (não-erva de São João). O extrato pode ser de qualquer das várias partes da planta incluindo sementes, folhas, caules, ou de outras partes da planta. O extrato de artemísia pode ser combinado com extratos de outras plantas como, por exemplo, um extrato de alga verde. Um extrato de artemísia particularmente adequado é uma mistura de extrato de artemísia e extrato de alga verde (família *Ulvaceae*) e comercialmente disponível como "Complexo Triplo A," junto a Barnet Products Corporation de Englewood Cliffs, New Jersey, EUA.

A quantidade de extrato de artemísia presente na composição para escurecimento da pele desta invenção é de cerca de 0,001% a cerca

DE 20%, de preferência 0,01% a cerca de 10% e, com mais preferência ainda, de cerca de 1,5% a cerca 3% em peso, em peso da composição.

Em uma modalidade da invenção, a composição inclui um agente de autobronzeamento, como DHA, um primeiro extrato de planta e um segundo extrato de planta. O primeiro extrato de planta é selecionado do grupo que consiste em extrato de artemísia, extrato de árvore de noz, e combinações dos mesmos. O primeiro extrato de planta é particularmente adequado para fornecer um escurecimento acentuado da pele em 3 horas ou menos após a aplicação tópica. O segundo extrato de planta é o extrato de sementes de soja pré-germinada. O extrato da segunda planta é particularmente adequado para fornecer um escurecimento acentuado da pele em 24 horas após a aplicação tópica. Portanto, a composição resultante tem um escurecimento que, quando comparado ao da DHA sozinha, desenvolve-se mais rapidamente e mantém uma intensidade mais forte durante um período de tempo prolongado.

Outros ingredientes de acentuação do bronzeamento

Em uma modalidade, as composições da presente invenção incluem outros compostos acentuadores do bronzeamento, isto é, outros compostos além de extratos de plantas que são úteis para acentuar o desenvolvimento da cor/bronzeamento. Exemplos de outros compostos acentuadores do bronzeamento incluem amino-açúcares. O amino-açúcar pode ser de origem natural ou sintética e pode ser um composto puro ou misturas de compostos (por exemplo, extratos de fontes naturais ou misturas de materiais sintéticos). De preferência, o amino-açúcar compreende glicosamina, N-acetil glicosamina, manosamina, N-acetil manosamina, galactosamina, N-acetil galactosamina, isômeros dos mesmos (por exemplo, estereoisômeros), sais dos mesmos (por exemplo, sal de HCl), ou combinações dos mesmos. Em uma modalidade preferencial, o amino-açúcar inclui glicosamina. A composição cosmética de acordo com a invenção pode compreender cerca de 0,01% a 15%, de preferência de 0,1% a 10% e com mais preferência de 0,5% a 5% de pelo menos um amino-açúcar em peso da composição.

Outros agentes de escurecimento

Em uma modalidade, a composição tópica contém ainda um agente de escurecimento adicional como, mas não se limitando a, ácido enotânico, eritrulose, melanina, peptídeos, derivados de melanina sintética, polímeros de vanilina, pigmentos, extratos como, mas não se limitando a, extrato de *Coleus Forskoli*, extratos de fontes naturais contendo pigmentos (por exemplo, pigmentos marrons a partir de plantas do gênero *Hedychium* ou do gênero da uva ursina, ou pigmentos amarelos, laranjas e vermelhos de plantas que contêm carotenoides ou cantaxantinas); ou produtos químicos sintéticos como compostos contendo cobre (por exemplo, sais de cobre contendo CuCl_2) ou caratenoides sintéticos ou cantaxantinas. O que se entende por "extrato" é uma mistura de compostos isolados a partir de uma fonte natural (por exemplo, uma planta).

Exemplos de derivados de melanina sintética são descritos nas Patentes US nº 5.618.519, 5.384.116 e 5.227.459. Exemplos de derivados de melanina solúvel são descritos nas Patentes US nº 5.744.125, 5.225.435, 5.218.079 e 5.216.116. Exemplos de derivados de melanina solúvel disponíveis para comercialização incluem Melasyn-100™ junto a San-mar laboratories, Inc. (Elmsford, NY, EUA) e MelanZe™ junto a Zylepsis (Ashford, Kent, Reino Unido).

Esses agentes adicionais de escurecimento estarão presentes tipicamente na composição em uma quantidade de cerca de 0,001% a cerca de 10% em peso.

Em uma outra modalidade, a composição pode incluir um peptídeo. Exemplos de peptídeos adequados são descritos por exemplo, nas patentes US nº 7.081.442, 7.214.655, 6.797.697 e 7.025.951.

Composições tópicas

As composições da presente invenção são aplicadas topicamente sobre a pele ou cabelo humanos. Em uma modalidade, a composição contém uma quantidade eficaz do agente de autobronzeamento descrito acima para o escurecimento da pele, um extrato selecionado do grupo que consiste em extrato de sementes de soja pré-germinada, extrato

de árvore de noz, extrato de artemísia, e combinações dos mesmos; e um veículo tópico cosmeticamente adequado. Em uma modalidade, o veículo tópico cosmeticamente aceitável é de cerca de 50% a cerca de 99,99%, em peso da composição (por exemplo, de cerca de 80% a cerca de 99%, em peso da composição). Em uma modalidade preferencial da invenção, o veículo tópico cosmeticamente aceitável consiste essencialmente em ou inclui água.

As composições podem ser usadas para fabricar uma ampla variedade de tipos de produtos que incluem, porém sem caráter limitativo, loções, cremes, géis, bastões, aspersões, pomadas, sabonetes em barra e líquidos, xampus e condicionadores de cabelo, fixadores de cabelos, pastas, espumas, pós, mousses, cremes de barbear, lenços umedecidos, esparadrapos, hidrogéis, produtos formadores de película, máscaras faciais e de pele, películas e maquilagem como bases, e rímel. Esses tipos de produtos podem conter vários tipos de veículos tópicos cosmeticamente aceitáveis, incluindo, mas não se limitando a, soluções, suspensões, emulsões como microemulsões e nanoemulsões, géis, sólidos e lipossomas. Os seguintes são exemplos não-limitadores de tais veículos. Outros veículos podem ser formulados pelos elementos versados na técnica.

As composições úteis na presente invenção podem ser formulados como soluções. As soluções incluem tipicamente um solvente orgânico ou aquoso (por exemplo, de cerca de 50% a cerca de 99,99% ou de cerca de 90% a cerca de 99% de um solvente orgânico ou aquoso cosmeticamente adequado). Exemplos de solventes orgânicos aceitáveis incluem propileno glicol, polietileno glicol (200-600), polipropileno glicol (425-2025), glicerol, 1,2,4-butanotriol, ésteres de sorbitol, 1,2,6-hexanotriol, etanol, e misturas dos mesmos.

Composições úteis na presente invenção podem ser formuladas como uma solução que compreende um emoliente. Tais composições contêm, de preferência, de cerca de 2% a cerca de 50% de um emoliente(s). Para uso na presente invenção, "emolientes" referem-se a materiais usados para a prevenção ou alívio da secura, como pela prevenção da perda

transepidérmica de água da pele. Exemplos de emolientes incluem, porém sem caráter limitativo, aqueles estabelecidos no International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook, editores Pepe, Wenninger e McEwen, páginas 2930 a 36 (The Cosmetic, Toiletry, and Fragrance Association, 5 Washington, D.C., 9ª Edição, 2002) (deste ponto em diante no presente documento "Manual ICI"). Exemplos de emolientes particularmente aceitáveis incluem óleos vegetais, óleos minerais, ésteres graxos, e similares.

Uma loção pode ser produzida a partir de uma solução. As 10 loções contêm tipicamente cerca de 1% a cerca de 20% (por exemplo, de cerca de 5% a cerca de 10%) de um emoliente(s) e de cerca de 50% a cerca de 90% (por exemplo, de cerca de 60% a cerca de 80%) de água.

Um outro tipo de produto que pode ser formulado a partir de uma solução é um creme. Um creme contém tipicamente de cerca de 5% a 15 cerca de 50% (por exemplo, de cerca de 10% a cerca de 20%) de um emoliente(s) e de cerca de 45% a cerca de 85% (por exemplo, de cerca de 50% a cerca de 75%) de água.

Embora seja preferencial que a composição da presente —invenção— inclua água, a composição pode ser alternativamente anidra, ou 20 uma pomada que não inclui água, porém solventes de silicone e/ou orgânicos, óleos, lipídios e ceras. Uma pomada pode conter uma base simples de óleos animais ou vegetais ou hidrocarbonetos semissólidos. Uma pomada pode conter de cerca de 2% a cerca de 10% de um emoliente mais cerca de 0,1% a cerca de 2% de um agente(s) espessante. Exemplos de 25 agentes espessantes incluem, porém sem caráter limitativo, aqueles apresentados no Manual ICI páginas 2979 a 84.

A composição pode ser formulada como uma emulsão. Se o veículo tópico é uma emulsão, de cerca de 1% a cerca de 10% (por exemplo, de cerca de 2% a cerca de 5%) do veículo tópico contém um 30 emulsificante(s). Emulsificantes podem ser não-iônicos, aniônicos, ou catiônicos. Exemplos de emulsificantes incluem, porém sem caráter limitativo, aqueles apresentados no Manual ICI páginas 2962 a 71.

Loções e cremes podem ser formulados como emulsões. Tipicamente tais loções contêm de 0,5% a cerca de 5% de um emulsificante(s). Tais cremes contêm tipicamente de cerca de 1% a cerca de 20% (por exemplo, de cerca de 5% a cerca de 10%) de um emoliente(s); de
5 cerca de 20% a cerca de 80% (por exemplo, de 30% a cerca de 70%) de água; e de cerca de 1% a cerca de 10% (por exemplo, de cerca de 2% a cerca de 5%) de um emulsificante(s).

Preparações de emulsões simples para o tratamento da pele, como loções e cremes, do tipo óleo em água e água em óleo são bem
10 conhecidas da técnica cosmética e são úteis na presente invenção. As composições de emulsão multifase, como do tipo água em óleo em água ou do tipo óleo em água em óleo, são também úteis na presente invenção. Em geral, tais emulsões simples ou multifase contêm água, emolientes e emulsificantes como ingredientes essenciais.

15 As composições desta invenção podem também ser formuladas como um gel (por exemplo, um gel aquoso, em álcool, álcool/água, ou óleo usando-se um agente(s) gelificante adequado). Os agentes gelificantes adequados para géis aquosos e/ou alcoólicos incluem, porém sem caráter limitativo, ~~gomas naturais, ácido acrílico, e~~ polímeros e copolímeros de
20 acrilato, e derivados de celulose (por exemplo, hidroximetil celulose e hidroxipropil celulose). Os agentes gelificantes adequados para óleos (como óleo mineral) incluem, porém sem caráter limitativo, copolímero de butileno/etileno/estireno hidrogenado e copolímero de etileno/propileno/estireno hidrogenado. Estes géis contêm tipicamente cerca
25 de 0,1% e 5%, em peso, de tais agentes gelificantes.

As composições da presente invenção podem também ser formuladas em uma formulação sólida (por exemplo, bastão com base em cera, composição em barra de sabão, pó, ou um lenço contendo pó).

30 As composições úteis na presente invenção podem conter, em adição aos componentes supracitados, uma ampla variedade de materiais adicionais solúveis em óleo e/ou materiais solúveis em água usados convencionalmente em composições para uso na pele ou cabelo, nos níveis

estabelecidos na técnica.

Agentes adicionais cosmeticamente ativos

Em uma modalidade, a composição ainda inclui um outro agente cosmeticamente ativo. Para uso na presente invenção, um "agente cosmeticamente ativo" é um composto (por exemplo, um composto sintético ou um composto isolado a partir de uma fonte natural ou extrato natural) que tem um efeito cosmético ou terapêutico sobre a pele ou cabelo, incluindo, mas sem limitar-se a, agentes antiacne, agentes de controle de brilho, agentes antimicrobianos, agentes anti-inflamatórios, agentes antimicóticos, agentes antiparasitas, analgésicos externos, filtros solares, fotoprotetores, antioxidantes, agentes queratolíticos, tensoativos, hidratantes, nutrientes, vitaminas, intensificadores de energia, agentes antitranspirantes, adstringentes, desodorantes, agentes firmadores, agentes anticalosidades, e agentes condicionadores para cabelos e/ou pele.

Em uma modalidade, o agente é selecionado a partir de, porém sem caráter limitativo, o grupo consistindo em hidroxiácidos, peróxido de benzoila, D-pantenol, octil metoxicinamato, dióxido de titânio, salicilato de octila, homossalato, avobenzona, carotenoides, limpadores de radicais livres, armadilhas de spin, aminas (por exemplo, DMAE e neutrol), retinoides como retinol e palmitato de retinila, ceramidas, ácidos graxos poli-insaturados, ácidos graxos essenciais, enzima, inibidores de enzimas, minerais, hormônios como estrogênios, esteroides como hidrocortisona, 2-dimetilaminoetanol, sais de cobre como cloreto de cobre, peptídeos contendo cobre como Cu:Gli-His-Lis, coenzima Q10, peptídeos, aminoácidos como prolina, vitaminas, ácido lactobiônico, acetil-coenzima A, niacina, riboflavina, tiamina, ribose, transportadores de elétron como NADH e FADH₂, e outros extratos botânicos como aloe vera, matricária, farinha de aveia e derivados e misturas do mesmos. O agente cosmeticamente ativo estará tipicamente presente na composição da invenção em uma quantidade de cerca de 0,001% a cerca de 20% em peso da composição, por exemplo, cerca de 0,005% a cerca de 10% como cerca de 0,01% a cerca de 5%.

Exemplos de vitaminas incluem, porém sem caráter limitativo,

vitamina A, vitamina B, como vitamina B3, vitamina B5, e vitamina B12, vitamina C, vitamina K, e diferentes formas de vitamina E como alfa, beta, gama ou delta tocoferóis ou misturas das mesmas, e derivadas das mesmas.

5 Exemplos de hidroxiácidos incluem, porém sem caráter limitativo, ácido glicólico, ácido láctico, ácido málico, ácido salicílico, ácido cítrico e ácido tartárico.

 Exemplos de antioxidantes incluem, porém sem caráter limitativo, antioxidantes solúveis em água como compostos sulfidríla e seus
10 derivados (por exemplo, metabissulfito de sódio e N-acetil-cisteína), ácido lipoico e ácido di-hidrolipoico, resveratrol, lactoferrina, e ácido ascórbico e derivados de ácido ascórbico (por exemplo, palmitato de ascorbila e polipeptídeo de ascorbila). Os antioxidantes solúveis em óleo adequados
15 para uso nas composições desta invenção incluem, porém sem caráter limitativo, hidroxitolueno butilado, retinoides (por exemplo, retinol e palmitato de retinila), tocoferóis (por exemplo, acetato de tocoferol), tocotrienóis e ubiquinona. Extratos naturais contendo antioxidantes adequados para uso
20 nas composições desta invenção incluem, porém sem caráter limitativo, extratos contendo flavonoides e isoflavonoides e seus derivados (por exemplo, genisteína e diadzeína), extratos contendo resveratrol e similares. Exemplos de extratos naturais incluem semente de uva, chá verde, cortiça de pinho e própolis.

Outros materiais

 Vários outros materiais podem também estar presentes na
25 composição, conforme conhecido na técnica. Esses incluem umectantes, ajustadores de pH, agentes quelantes (por exemplo, EDTA), minerais e conservantes (por exemplo, parabenos). Exemplos de tais agentes são mencionados nas páginas 2922 e 23, 2926 a 28, e 2892 do Manual ICI. Além disso, as composições úteis da presente invenção contêm adjuvantes
30 cosméticos convencionais, como opacificantes (por exemplo, dióxido de titânio) e fragrâncias.

 Corantes podem também ser adequados para o uso nas

composições da presente invenção. Exemplos de corantes adequados para as composições da invenção incluem caramelo, carmim, derivados de fluoresceína, metoxsaleno, trioxsaleno, carbono preto, corantes azo, corantes de antraquinona, azul azulenos, guajazuleno, camuzuleno, eritrosina, rosa bengala, floxina, cianosina, dafinina, eosina G, cosina 10B, 5 Ácido Vermelho 51, Corante Vermelho 4, Corante Vermelho 40, Corante Azul 1, e Corante Amarelo 5, ou misturas dos mesmos. Outros corantes são mencionados nas páginas 1628 a 30 do International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook, editores Wenninger e McEwen (The Cosmetic, 10 Toiletry, and Fragrance Assoc., Washington, D.C., USA, 7ª Edição, 1997) (deste ponto em diante no presente documento "Manual ICT"), cujos conteúdos estão aqui incorporados a título de referência.

Quando usados, a quantidade de corante na composição pode variar de cerca de 0,0001 a cerca de 0,1, de preferência 0,0025 a cerca de 15 0,025, por cento, em peso, com base no peso total da composição.

A composição, formulações e produtos contendo tais composições da presente invenção podem ser preparados com o uso de metodologia bem conhecida por um elemento de habilidade comum versado na técnica.

20 Os seguintes exemplos não-limitadores ilustram adicionalmente a invenção:

Exemplo A: Extrato de artemísia e extrato de semente de noz fornecem um bronzamento (escurecimento) superior em 3 horas

Foi preparada uma base ("Composição 1") com uma 25 concentração de 1,5%, em peso, de di-hidroxiacetona (DHA), propileno glicol, água e o etanol remanescente. Foi preparada uma série de composições similares com as mesmas concentrações de DHA, propileno glicol, água, e etanol, entretanto, para cada uma das composições adicionais foi também incluído 2% de um extrato particular.

30 Os seguintes extratos foram avaliados: Gatuline Age Defense (mistura de água e semente de Juglans regia (noz), disponível comercialmente junto à Gattefosse de Saint-Priest, França), Complexo Triplo

A (mistura de extrato de artemísia e extrato de alga verde *Ulvaceae*, disponível comercialmente junto à Barnet Products Corporation de Englewood Cliffs, New Jersey, EUA), Vegerysyl LP (uma proteína de soja hidrolisada convencionalmente processada), e leite de soja NA22077 (um
 5 hidrolisado de proteína total de soja convencionalmente processado, disponível comercialmente junto à Crodarom, de Les Plaines, Chanac, França).

Cada uma dessas composições foi testada de acordo com o "teste in vivo de escurecimento da pele" para avaliar a capacidade de induzir
 10 o escurecimento da pele em seres humanos.

Teste in vivo de escurecimento da pele

Foram identificados dois seres humanos tendo tipos de pele I a III, de acordo com a classificação de Fitzpatrick, com idade variando de 21 a 50 anos. Para cada indivíduo, foi determinada uma localização para cada
 15 uma das composições a ser testada e foram tomadas leituras X iniciais de cromômetro com o uso de um cromômetro Minolta, disponível junto à Konica Minolta Sensing, de Ramsey, NJ, EUA. Foi calculada a média dessas leituras para chegar à leitura de referência para cada indivíduo. Cada uma das composições descritas acima foi aplicada, por esfregação, a uma área
 20 distinta do antebraço de cada indivíduo em uma quantidade de 18 mg sobre uma área de pele de 9 cm². As composições foram deixadas para secar e após três períodos de tempo: 3 horas, 6 horas e 24 horas, foram tomadas leituras adicionais de cromômetro. A mudança de intensidade (dL) foi calculada como a diferença entre a leitura média após o tratamento e a
 25 leitura média da referência.

As leituras de dL foram registradas. Além disso, para permitir uma melhor comparação entre os testes feitos em diferentes períodos de tempo, o aumento percentual no escurecimento para cada um foi normalizado em relação àquele da composição controle (Composição 1) que
 30 tinha DHA e base, mas não extrato. A mudança normalizada de intensidade foi calculada como:

$$\% dL_{\text{norm}} = 100 * (dL - dL_{\text{Comp. 1}}) / dL_{\text{Comp. 1}}$$

Os resultados do teste são mostrados na tabela 1.

Tabela 1

Exemplo	Descrição	dL (3 h)	% dL _{norm} (3 h)	dL (6 h)	% dL _{norm} (6 h)	dL (24 h)	% dL _{norm} (24 h)
Comp. 1	Nenhum extrato	0,118	0,0	-1,474	0,0	3,190	0,0
Ex. 1	Gatuline Age Defense	-0,605	411	-1,506	2,2	-3,625	13,6
Ex. 2	Complexo Triplo A	-0,320	170	-1,689	14,6	-3,050	-4,4
Comp. 2	Vegerysyl	-0,0673	43,2	-0,485	-67,1	-3,075	-3,6
Comp. 3	Leite de soja NA22077	0,5342	54,9	-0,918	-37,7	-3,617	13,4

Como pode ser visto claramente na % dL_{norm}(3 horas), o extrato de semente de noz (Gatuline Age Defense) e o extrato de artemísia (Complexo Triplo A) forneceram efeitos de escurecimento de ação rápida. Quando combinados independentemente com DHA, esses extratos agem dentro de 3 horas para fornecer um aumento dramático no escurecimento em relação ao escurecimento da DHA sozinha. A % dL_{norm}(3 horas) de 411 para a composição incluindo Gatuline Age Defense indica que ela forneceu 4,11 vezes a quantidade de escuridão quando comparada à mesma composição sem qualquer extrato (Composição 1). Similarmente, o Complexo Triplo A forneceu 1,70 vezes o efeito de escurecimento da Composição 1. Além disso o efeito de escurecimento medido pela % dL_{norm}(3 horas) foi muito mais alto (cerca de 4 a 10 vezes melhor) para o Exemplo 1 e o Exemplo 2 quando comparado à Composição 2 e à Composição 3 (contendo outros extratos - soja convencional Vegerysyl e leite de soja, respectivamente).

Exemplo B: O extrato de sementes de soja pré-germinada fornece um bronzeamento (escurecimento) da pele superior em 24 horas

Foi realizada uma segunda avaliação, similar à avaliação do exemplo A acima. A base ("Composição 2.2") foi preparada com uma concentração de 1,5% de di-hidroxiacetona (DHA), água desionizada, propileno glicol, e o etanol remanescente. Foi preparada uma série de composições similares com as mesmas concentrações de DHA e mistura de

óleo, entretanto, em cada uma das composições adicionais foi também incluído 2% de um extrato natural particular. Os seguintes extratos foram analisados: Phyltherm Vegetal C (um extrato de semente de soja pré-germinada disponível junto a Gattefosse de Saint-Priest, França), Seda

5 Marinha (um extrato de alga verde aquática hidrolisado de *Enteromorpha* compressa e *Himantalia elongata*, disponível junto a Biotech Marine of Poitrieux, França), Phycolanina (uma laminaria ocreleuca aquática, extrato de alga marinha marrom, também disponível junto a Biotech Marine), e Aosaina (uma *Ulva lactuca* hidrolisada, extrato de alga marinha marrom,

10 também disponível junto à Biotech Marine).

Tabela 2

Exemplo	Descrição	DL (3 h)	% dL _{norm} (3 h)	dL (6 h)	% dL _{norm} (6 h)	dL (24 h)	% dL _{norm} (24 h)
Composição 2-2	Nenhum extrato	-1,569	0,0	-3,056	0,0	-2,284	0,0
Exemplo 3	Phyltherm Vegetal C	-1,422	-9,4	-2,594	-15,1	-3,116	36,5
Composição 2-3	Seda marinha	-1,751	11,7	-2,903	-5,0	-2,583	13,1
Composição 2-4	Phycolanina	-1,610	2,7	-2,070	-32,3	-2,542	11,3
Composição 2-5	Aosaina	-0,350	-77,7	-1,140	-62,7	-1,519	-33,5

Como pode ser visto claramente na % dL_{norm}(24 horas) o extrato de semente de soja pré-germinada (Phyltherm Vegetal C) forneceu efeitos de

15 escurecimento intensos e duradouros. Quando combinado independentemente com DHA, esse extrato agiu dentro de 24 horas para fornecer um aumento dramático no escurecimento em relação ao escurecimento da DHA sozinha. A % dL_{norm}(24 horas) de 36,5 para a composição incluindo Phyltherm Vegetal C (Exemplo 3) indica que ela

20 aumentou a capacidade de escurecimento em 36,5%, quando comparada à mesma composição sem qualquer extrato (Composição 2-2). Em 24 horas, esse aumento foi de aproximadamente 3 vezes o aumento dos melhores outros extratos remanescentes (Gatuline e leite de soja convencional no

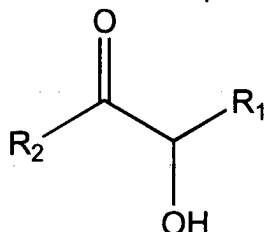
Exemplo A e Leite Marinho e Phycolanina no Exemplo B). Deve ser também observado que alguns dos extratos comparativos, Aosina e Vegerysyl, realmente retardaram o desenvolvimento do escurecimento em 24 horas (a % de aprimoramento em relação à DHA foi negativa).

- 5 Entende-se que embora a invenção tenha sido descrita em conjunto com a descrição detalhada da mesma, a descrição supracitada pretende ilustrar e não limitar o escopo da invenção, que é definido pelo escopo das reivindicações em anexo. Outros aspectos, vantagens e modificações estão contidas nas reivindicações.

REIVINDICAÇÕES

1. Composição, compreendendo:

agente de autobronzeamento que tem a seguinte fórmula:



em que R₁ é H, CH₂OH, CHOHCH₂OH, CH(OH)CH(=O),
5 CH(NH₂)CH(=O), CH(OCH₃)CH(=O), ou CH(NH-fenil)CH(=O); e R₂ é H ou
CH₂OH; e

um extrato selecionado do grupo que consiste em extrato de
sementes de soja pré-germinada, extrato de árvore de noz, extrato de
artemísia, e combinações dos mesmos.

10 2. Composição, de acordo com a reivindicação 1,
compreendendo extrato de sementes de soja pré-germinada.

3. Composição, de acordo com a reivindicação 1,
compreendendo extrato de árvore de noz.

15 4. Composição, de acordo com a reivindicação 1,
compreendendo extrato de artemísia.

5. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o
agente de autobronzeamento é di-hidroxiacetona.

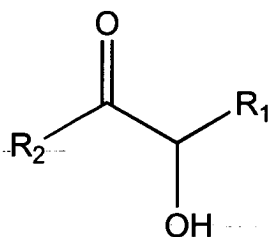
20 6. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o
agente de autobronzeamento está presente na composição em uma
quantidade de cerca de 1% em peso a 5% em peso da composição.

7. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o
extrato está presente na composição em uma quantidade de cerca de 0,01%
em peso a cerca de 10% em peso da composição.

25 8. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o
extrato está presente na composição em uma quantidade de cerca de 1,5%
a cerca de 3% da composição.

9. Método de escurecimento da pele, o dito método
compreendendo aplicar topicamente à dita pele uma composição

compreendendo um agente de autobronzeamento que tem a seguinte fórmula:



em que R₁ é H, CH₂OH, CHOHCH₂OH, CH(OH)CH(=O), CH(NH₂)CH(=O), CH(OCH₃)CH(=O), ou CH(NH-fenil)CH(=O); e R₂ é H ou CH₂OH; e um extrato selecionado do grupo que consiste em extrato de sementes de soja pré-germinada, extrato de árvore de noz, extrato de artemísia, e combinações dos mesmos.

10. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que a composição compreende extrato de sementes de soja pré-germinada.

10 11. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que a composição compreende extrato de árvore de noz.

12. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que a composição compreende extrato de artemísia.

15 13. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que o agente de autobronzeamento é di-hidroxiacetona.

14. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que o agente de autobronzeamento está presente na composição em uma quantidade de cerca de 1% em peso a 5% em peso da composição.

20 15. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que o extrato está presente na composição em uma quantidade de cerca de 0,01% em peso a cerca de 10% em peso da composição.

16. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que o extrato está presente na composição em uma quantidade de cerca de 1,5% a cerca de 3% da composição.

RESUMO

Patente de Invenção **"COMPOSIÇÕES QUE COMPREENDEM AGENTES DE AUTOBRONZEAMENTO E EXTRATOS DE PLANTAS"**.

5 A presente invenção refere-se a uma composição para escurecimento da pele.

A composição inclui um agente de autobronzeamento e um extrato de planta selecionado do grupo que consiste em extrato de sementes de soja pré-germinada, extrato de semente de noz, extrato de artemísia, e combinações dos mesmos. Em um outro aspecto, um método de
10 escurecimento da pele inclui aplicar topicamente a composição acima à pele.