



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

(21) **PI1000367-3 A2**



(22) Data de Depósito: 01/02/2010  
(43) Data da Publicação: 22/03/2011  
(RPI 2098)

(51) *Int.Cl.:*  
A61K 8/03  
A61K 8/92  
A61K 8/19  
A61K 8/30  
A61Q 17/04

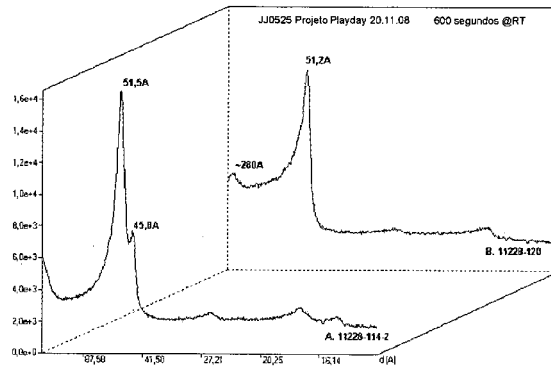
(54) Título: **COMPOSIÇÕES DE FILTRO SOLAR PARA CUIDADOS PESSOAIS COM REDUZIDA IRRITAÇÃO OCULAR**

(30) Prioridade Unionista: 30/01/2009 US 61/148,561

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

(72) Inventor(es): Blair Kim, Laurence Halimi

(57) Resumo: COMPOSIÇÕES DE FILTRO SOLAR PARA CUIDADOS PESSOAIS COM REDUZIDA IRRITAÇÃO OCULAR. A presente invenção refere-se a uma composição auto-organi-zável lamelar e esferulítica que é estável e requer uma quantidade mínima de energia, compreendendo: água para mistura, álcool graxo, ácido graxo, sal de ácido graxo, éster de ácido graxo de poliglicerita e óleos. A presente invenção refere-se a uma composição que pode oferecer os benefícios de suavidade no contato com os olhos, distribuição uniforme dos filtros solares físicos sobre a pele e estabilidade otimizada.





PI1000367-3

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**COMPOSIÇÕES DE FILTRO SOLAR PARA CUIDADOS PESSOAIS COM REDUZIDA IRRITAÇÃO OCULAR**".

Informações sobre pedido relacionado: este pedido é uma continuação em parte do pedido de patente de nº serial US 12/362.929 (Súmula do Advogado nº JBP5046USNP), depositado em 30 de janeiro de 2009 e é também relacionado ao US de nº serial 61/148.561 depositado em 30 de janeiro de 2009 e ao pedido de patente de nº serial \_\_\_\_\_ (Súmula do advogado nº JBP5046USNP1), depositado em 12 de janeiro de 2010, cujo assunto está aqui incorporado a título de referência.

CAMPO DA INVENÇÃO

A presente invenção refere-se a estruturas auto-organizáveis lamelares e esferulíticas, que proporcionam maior suavidade no contato com os olhos para produtos de filtro solar de uso tópico para cuidados pessoais, bem como distribuição uniforme do produto sobre a pele e estabilidade física otimizada.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

Os produtos para cuidados pessoais que são aplicados topicamente à pele, inclusive os hidratantes faciais, loções, cremes, xampus, filtros solares e similares, frequentemente entram em contato com o olho humano. Isto pode ocorrer através da aplicação direta, devido ao fato de o indivíduo colocar o produto nas mãos, aplicar o produto sobre a pele e, então, tocar inadvertidamente os olhos. Outra rota pela qual esses produtos podem chegar aos olhos é a perspiração, que ocorre quando um indivíduo aplica o produto à face, de onde o suor o carrega para dentro dos olhos. Os efeitos desse processo incluem lacrimejamento, comichão, vermelhidão e inchaço oculares.

Os consumidores ficam extremamente insatisfeitos com produtos de filtro solar durante os meses de verão, quando seus olhos ardem ou queimam devido aos produtos de filtro solar que entram em contato com os mesmos. Os consumidores de outros tipos de produtos, inclusive produtos com ou sem enxágue como cremes, agentes de limpeza e produtos de lavagem

para o rosto, podem sofrer dores devido à natureza irritante de muitos dos produtos para cuidados pessoais de aplicação tópica.

Para resolver esse problema na formulação de filtros solares, estes frequentemente contêm um sistema de liberação por veículo à base de água em óleo, para promover a resistência à água e para otimizar a oclusividade de um produto. Entretanto, quando produtos à base de água em óleo, altamente oclusivos, são usados diariamente, os mesmos podem impedir a regeneração da barreira lipídica natural da pele, gerando uma sensação cada vez maior de pele seca, após cada uso. A estética típica de produtos à base de água em óleo frequentemente deixa uma sensação cerosa ou oleosa após o uso, o que não é adequado ao uso diário.

Além disso, pode haver um limite no grau em que os veículos à base de água em óleo proporcionam eficácia ao filtro solar. Os filtros solares como dióxido de titânio e óxido de zinco, ou quaisquer outras partículas coloidais, podem estar situados principalmente na fase oleosa das formulações do tipo água em óleo, o que pode causar a aplicação irregular dos filtros solares sobre a pele.

Um outro problema associado à formulação com óxidos metálicos é a dificuldade de se estabelecer a estabilidade da formulação. Os óxidos metálicos, sejam estes hidrofobicamente ou hidrofílicamente revestidos, frequentemente se decantam da solução em produtos de filtro solar, devido a uma suspensão e/ou dispersão heterogênea.

Outros tipos de formulações, inclusive aquelas com e sem enxágue, podem causar os mesmos tipos de problema, especialmente quando um ingrediente particulado ativo está incluído nessas formulações. Muitos cremes, emulsões e loções, bem como xampus e outros agentes de limpeza, causam ardência e desconforto quando instilados nos olhos durante o uso.

A publicação de patente US n° US20050238677A1 refere-se a emulsões do tipo óleo em água, sendo que uma blenda de emulsificantes, compreendendo uma mistura de pelo menos dois ésteres de sacarose em combinação com pelo menos um álcool graxo sólido, forma uma rede cristalina líquida multilamelar. A produção dessas emulsões exige uma alta entra-

da de energia de cisalhamento. Adicionalmente, as composições descritas não atendem a preocupações associadas à instabilidade dos produtos de filtro solar inorgânico, ou sua suavidade no contato com a pele e os olhos.

A publicação de patente US n° US20050265936 refere-se a uma  
5 formulação de filtro solar que compreende um filtro solar, um estruturante e uma emulsão compreendendo uma mistura homogeneizada de componentes de cera e álcool, pelo menos um dos quais é um tensoativo, sendo que a formulação compreende uma fase lamelar ou esferulítica estável. Entretanto, as composições descritas naquele documento podem conter tensoativos que  
10 são irritantes para os olhos, como lauro anfoacetato de sódio, sulfato de sódio tridecet e cocamida MEA. Essas composições exigem, também, alta energia de cisalhamento adicional para formar as estruturas de esferulito.

É desejável a obtenção de composições para cuidados pessoais que possam minimizar a ocorrência de irritação dos olhos, ao mesmo tempo  
15 em que oferecem eficácia aprimorada de liberação de ativos e de processo de formulação. A presente invenção resolve esse problema.

### SUMÁRIO DA INVENÇÃO

Esta invenção refere-se a composições para cuidados pessoais que têm pelo menos duas fases e a métodos de preparo das ditas composi-  
20 ções, as quais são inesperadamente suaves no contato com os olhos. As composições da presente invenção referem-se, mais especificamente, a composições contendo componentes que, quando combinados um com o outro, e sem a aplicação de energia à composição, organizam-se a si mesmos em lamelas e uma fase G esferulítica.

O termo "fase G" refere-se a uma fase lamelar de cristal líquido, do tipo conhecido na literatura como "fase pura" ou "fase lamelar", e suas texturas características podem ser identificadas sob um microscópio com polarização cruzada. Os termos "lamelas" ou "estrutura lamelar", para uso na presente invenção, referem-se uma fase cristalina líquida ordenada na qual  
25 uma pluralidade de camadas duplas estão dispostas em matrizes paralelas separadas por camadas de água.  
30

O termo "fase G esferulítica", para uso na presente invenção,

refere-se a camadas duplas concêntricas alternadas com fase aquosa, com um espaçamento de fase G ou de fase G expandida, por exemplo, corpos pequenos e arredondados presentes na composição, que pode ter uma estrutura fibrosa radial. O termo refere-se, também, a camadas de corpos esféricos ou esferoidais conformando a estrutura.

De preferência, as composições da presente invenção contêm água e pelo menos um éster de ácido graxo de poliglicerila, um ácido graxo e um sal do dito ácido graxo, bem como um componente de filtro solar. As composições da presente invenção podem, de preferência, conter também um agente umectante, um álcool graxo saturado de cadeia única, poliésteres, óleos de natureza hidrofóbica e outros ingredientes cosméticos ou para cuidados pessoais. De preferência, o ácido graxo é um ácido graxo saturado de cadeia única. Para a obtenção das estruturas autoformantes das composições da presente invenção, a razão adequada entre o ácido graxo saturado de cadeia única e seu sal é, de preferência, de cerca de 1:2 a cerca de 1:4. De preferência, para a obtenção das estruturas autoformantes das composições da presente invenção, a razão adequada entre o éster de ácido graxo de poliglicerila, o ácido graxo e o sal do ácido graxo precisa ser de cerca de 1:1:2 ou maior.

## BREVE DESCRIÇÃO DOS DESENHOS

A figura 1 é um gráfico representando os padrões de difração de raios X das composições descritas no Exemplo 8.

A figura 2 é uma fotografia de microscopia eletrônica de varredura ambiental (ESEM) da composição comparativa descrita no exemplo 9.

A figura 3 é uma fotografia de ESEM de uma composição comparativa descrita no exemplo 9.

A figura 4 é uma fotografia de ESEM de uma composição em branco do exemplo 9.

A figura 5 é uma fotografia de ESEM de uma composição da invenção descrita no exemplo 9.

## DESCRIÇÃO DETALHADA DAS MODALIDADES PREFERENCIAIS

As composições da presente invenção estão, de preferência,

sob a forma de uma composição com pelo menos duas fases, com mais preferência uma blenda estruturante de água em óleo. Estas contêm, de preferência, pelo menos um éster de ácido graxo de poliglicerila, um ácido graxo e um sal do dito ácido graxo, bem como um componente de filtro solar. Esses elementos, quando combinados, formam estruturas multilamelares e esferulíticas auto-organizáveis. Descobriu-se, inesperadamente, que os sais de ácidos graxos produzem emulsões estáveis ao longo de uma faixa de viscosidades com perfis estéticos e características reológicas distintos.

Com mais preferência, as composições da presente invenção contêm, ainda, pelo menos um álcool graxo saturado de cadeia única, pelo menos um óleo de natureza hidrofóbica e água.

A rede lamelar das composições da presente invenção mascara, ou "oculta", os ingredientes oleosos e pesados presentes nas composições, como filtro solar e petrolato, resultando em um "toque da pele" mais leve após a aplicação. Portanto, quando aplicada à pele, a composição não é oleosa ou pesada, e não se apresenta como uma camada oleosa e pegajosa sobre a pele. As disposições em bicamada da estrutura lamelar e esferulítica promovem a espalhabilidade do produto por toda a pele, e aumenta a compatibilidade do óleo com a pele, resultando assim em um toque não-gorduroso e/ou não-pegajoso.

A fase oleosa das composições da presente invenção precisa conter pelo menos um álcool graxo, pelo menos um éster de ácido graxo de poliglicerila, pelo menos um ácido graxo, pelo menos um sal metálico de ácido graxo e pelo menos um óleo, ou mistura de óleos, de natureza hidrofóbica.

As composições de cuidados pessoais auto-organizáveis da presente invenção também incluem, de preferência, pelo menos um éster de ácido graxo de poliglicerila. Esses ésteres de ácido graxo de poliglicerila podem ser saturados ou insaturados e ramificados. Com mais preferência, os ésteres de ácido graxo de poliglicerila usados nas composições da presente invenção precisam ser ésteres de poliglicerila tendo de 16 a 22 átomos de carbono. Com mais preferência, os ésteres de ácido graxo de poliglicerila

usados nas composições da presente invenção precisam ser ésteres de ácido graxo de mono, di ou tripoliglicerila. Com a máxima preferência, é um éster de ácido graxo de cadeia saturada ou insaturada e ramificada, como isoestearato de poliglicerila-2, isoestearato de poliglicerila-4, triestearato de poliglicerila-4, oleato de poliglicerila-3, mono-oleato de diglicerol, monoestearato de diglicerol e similares.

De preferência, os ésteres de ácido graxo de mono, di ou tripoliglicerila usados nas composições da presente invenção precisam ter um valor de HLB de cerca de 2 a cerca de 8.

Os ésteres de ácido graxo de poliglicerila precisam estar presentes nas composições desta invenção a uma razão, em relação ao componente de ácido graxo, de cerca de 6:1 a cerca de 1:1.

As composições auto-organizáveis para cuidados pessoais da presente invenção também incluem, de preferência, pelo menos um álcool graxo sólido cadeia única com hidrocarbonetos alifáticos contendo de cerca de 14 a cerca de 22 átomos de carbono, e com pontos de fusão na faixa de cerca de 38°C a cerca de 71°C. Com mais preferência, esses álcoois graxos sólidos de cadeia única têm de 16 a cerca de 20 átomos de carbono. Com a máxima preferência, esses álcoois graxos sólidos de cadeia única são selecionados a partir do grupo consistindo em álcool cetílico, álcool esteárico e álcool araquidílico. A quantidade de álcool graxo nas composições da presente invenção pode, de preferência, estar na faixa de cerca de 0,5% a cerca de 10% e, com mais preferência, de cerca de 1,5% a cerca de 5%, em peso da composição. A quantidade precisa de álcool graxo irá variar dependendo das características desejadas de estética, reologia, dispersão e compatibilidade dos componentes nas composições da presente invenção, bem como da liberação dos ingredientes ativos escolhidos e da quantidade de ingrediente ativo a ser liberada. O álcool graxo, se estiver presente, e o ácido graxo são de preferência combinados, nas composições da presente invenção, a uma razão de cerca de 1:2 a cerca de 1:4 (álcool graxo:ácido graxo).

De preferência, as composições da presente invenção precisam

conter um ácido graxo saturado com um ponto de fusão na faixa de cerca de 31°C a cerca de 80°C. Com mais preferência, os ácidos graxos usados nas composições da presente invenção precisam ter de cerca de 10 a cerca de 22 átomos de carbono. Estes precisam se ácidos graxos de cadeia reta.

- 5 Com a máxima preferência, os ácidos graxos úteis nas composições da presente invenção precisam incluir ácido mirístico, ácido palmítico, ácido esteárico, ácido araquídico e similares. O ácido graxo da máxima preferência é o ácido esteárico.

- A fase oleosa das composições da presente invenção precisam, também, conter pelo menos um óleo. Para uso na presente invenção, o termo "óleo" significa um material hidrofóbico que pode ajudar a equilibrar as forças intermoleculares, para formar agregados de micela ou para limitar os tamanhos das mesmas. Os óleos servem, também, como ingredientes emolientes para otimizar a espalhabilidade do produto, o toque da pele e a liberação de ingredientes ativos hidrofóbicos por exemplo, mas não se limitando a, vitaminas D, E, K e A, bem como filtros solares. Os óleos que são úteis para uso nas composições da presente invenção incluem uma variedade de óleos à base de hidrocarboneto, silicones, derivados de ácido graxo, glicerídeos, óleos vegetais, derivados de óleo vegetal, ésteres de alquila, ésteres de cera, derivados de cera de abelha, esteróis e fosfolipídeos, bem como combinações dos mesmos, na faixa de aproximadamente 20% a 50%, com base no peso total da composição.
- 10  
15  
20

- Os óleos de hidrocarboneto adequados para uso preferencial nas composições e métodos da presente invenção incluem petrolato, óleo mineral, ceras microcristalinas, esqualeno e combinações dos mesmos. O exemplo de óleos de silicone adequados ao uso como materiais hidrofóbicos na presente invenção incluem dimeticona, dimeticonol, fenil dimeticona e polissiloxanos cíclicos, bem como combinações dos mesmos. Os óleos de silicone com viscosidades de cerca de 0,5 a cerca de 100.000 centistokes a 25°C podem, também, ser úteis à composição.
- 25  
30

Os glicerídeos úteis às composições da presente invenção incluem óleo de rícino, óleo de semente de girassol, óleo de coco e seus deri-

vados, óleos vegetais e seus derivados, óleo de babaçu, óleo de jojoba, manteiga de carité, lanolina e combinações dos mesmos.

Os óleos de éster alquílico incluindo, mas não se limitando a, ésteres isopropílicos de ácidos graxos e ésteres de ácidos graxos de cadeia  
5 longa podem, também, ser adequados ao uso nas composições da presente invenção. Com mais preferência, os seguintes ésteres alquílicos podem ser úteis nas composições da presente invenção: palmitato de isopropila, miristato de isopropila, miristato de miristila, palmitato de isoexila, oleato de decila, isononanoato de isononila e uma combinação dos mesmos.

10 Os agentes condicionadores para cabelos ou pele podem ser usados nas composições da presente invenção, incluindo, mas não se limitando a, umectantes, proteína e derivados de proteína como proteína de trigo, proteína de arroz e proteína do leite, agentes condicionadores à base de silicone e lipídios, bem como combinações dos mesmos. Uma variedade  
15 desses materiais pode ser empregada, seja na fase oleosa das composições, seja em sua fase aquosa, dependendo de sua capacidade hidrofóbica. De preferência, esses agentes condicionadores precisariam estar presentes nas composições desta invenção em uma quantidade de cerca de 0,01% a cerca de 30%, com mais preferência de cerca de 0,1% a cerca de 20% e,  
20 com a máxima preferência, de cerca de 0,5% a cerca de 10%, em peso da composição.

A fase aquosa das composições da presente invenção está, de preferência, presente em quantidades de cerca de 30% a cerca de 50%, em peso, em relação ao peso total da composição. A fase aquosa contém, de  
25 preferência, água ou uma combinação de água e pelo menos um álcool polihídrico. De preferência, esses álcoois polihídricos podem ser escolhidos do grupo consistindo em glicóis, gliceróis, polietileno glicol, propileno glicol, outros ingredientes solúveis em água e similares. As composições da presente invenção podem também incluir, de preferência, pequenas porcentagens de  
30 agentes espessantes, inclusive polímeros para a fase aquosa, de cerca de 0,01% a cerca de 0,5% peso/peso, inclusive as famílias de celulose e/ou carbômero, bem conhecidas na técnica. De preferência, a fase aquosa das

composições da presente invenção precisa ter um pH de pelo menos 5.

Os espessantes são selecionados, de preferência, do grupo consistindo em espessantes de água inorgânicos, materiais poliméricos carregados, polímeros solúveis em água e misturas dos mesmos. Os espessantes de água inorgânicos incluem, de preferência, ingredientes selecionados do grupo consistindo em sílicas, argilas como laponita, amidos modificados e misturas dos mesmos. Os espessantes de água poliméricos carregados incluem, de preferência, polímero cruzado de acrilatos/acrilato de alquila C10-30, carbômeros, copolímero de acrilóil dimetil taurato de amônio/VP, acrilóil dimetil taurato de amônio, poliacrilamida e misturas dos mesmos. Os polímeros solúveis em água incluem, de preferência, géis celulósicos, fosfatos de hidroxil propil amido e misturas dos mesmos.

Quando presentes, os agentes espessantes hidrofílicos ajudam na suspensão e/ou na liberação eficaz dos ingredientes hidrofílicos sobre a pele ou o couro cabeludo. A fase aquosa precisa ter, de preferência, um pH de cerca de 5 a cerca de 8, com mais preferência de cerca de 6 a cerca de 7. O pH adequado pode ser obtido mediante o uso de ajustadores de pH para facilitar a obtenção de uma faixa de pH adequada.

A fase oleosa das composições da presente invenção precisa também incluir, de preferência, pelo menos um composto de eletrólito. Esse composto de eletrólito precisa incluir, de preferência, pelo menos um sal de ácido graxo contendo íons metálicos alcalinos ou alcalino-terrosos, inclusive íons metálicos bivalentes como magnésio, cálcio, amônio e misturas dos mesmos, bem como similares. Com mais preferência, esses eletrólitos precisam ser estearato de magnésio. De preferência, os compostos de eletrólito úteis nas composições da presente invenção precisam ser adicionados à fase oleosa da composição. A quantidade de eletrólito nas composições da presente invenção situa-se, de preferência, na faixa de cerca de 0,1% a cerca de 20%, com base no peso total da composição. Com mais preferência, os mesmos precisam estar presentes em uma quantidade de cerca de 1% a cerca de 10%, em peso da composição. Os respectivos ácido graxo e íons metálicos são tipicamente combinados a uma razão de cerca de 1:4 a cerca

de 1:2. Os ácidos graxos saturados preferenciais têm entre 10 e 22 carbonos, conforme acima descrito.

Sem se ater à teoria, acredita-se que a natureza auto-organizável das composições da presente invenção tem por base as relações estruturais e químicas apresentadas a seguir. Os sais metálicos de ácido graxo de cadeia longa são moléculas compostas de íons carregados e uma cauda hidrofóbica com uma ligação iônica que impede a separação entre o íon metálico e a cauda do hidrocarboneto de cadeia longa. Como uma unidade, os sais metálicos de ácidos graxos de cadeia longa influenciam fortemente uma maior compactação da estrutura como um todo, e um grau mais alto de organização cristalina das composições, pelo fato de haver uma menor inclinação das cadeias de hidrocarbonetos, o que diminui a área ocupada por cada molécula.

A correlação entre o sal metálico de ácido graxo e seu comportamento na fase pode ser compreendida por meio de um modelo geométrico bem conhecido: o parâmetro crítico de compactação. Nas composições da presente invenção, o sal metálico de ácido graxo desempenha um papel importante na formação de uma estrutura auto-organizável, ao contribuir com um "fator crítico de compactação" para os estruturantes (incluindo os ingredientes como ácido graxo, álcool graxo, óleo hidrofóbico e éster de ácido graxo) próximo de 1. O "parâmetro crítico de compactação" é definido conforme exposto a seguir:  $v/aolc$ , em que  $ao$ =área do grupo principal,  $v$ =volume da cauda hidrofóbica e  $lc$ =comprimento da cauda hidrofóbica.

De acordo com esse modelo, o comprimento da cauda hidrofóbica da estrutura como um todo precisa ser de cerca de  $4/3$  daquele do raio de uma micela, para formar uma estrutura lamelar. O sal metálico de ácido graxo proporciona esse comprimento extra necessário para formar uma estrutura bidimensional espontânea. Além disso, ao contrário das moléculas anfifílicas, que podem ser separadas dependendo do ambiente hidrofóbico ou hidrofílico, a forte ligação iônica entre o grupo polar metálico e a cauda de hidrocarboneto impede a separação ao mesmo tempo em que aumenta a estabilidade da bicamada lamelar.

Os ingredientes ativos de filtro solar adequados ao uso nas composições da presente invenção incluem, de preferência, filtros solares físicos como dióxido de titânio e óxido de zinco. Esses óxidos metálicos precisam ter um tamanho de partícula na faixa de cerca de 10 nm a cerca de 100 nm. Os

5 óxidos metálicos que são úteis nas composições da presente invenção podem ser revestidos com dimeticona, alcóxi titanatos, metil polissiloxanos, sílica e/ou alumina, bem como misturas dos mesmos. Há uma ampla variedade de ativos químicos de filtro solar adequados ao uso nesta invenção, incluindo as classes químicas principais dos filtros UV: PABA e p-aminobenzoatos, silicila-

10 tos, cinamatos, benzofenonas, antranilatos, dibenzoil metanenos, derivados de cânfora e misturas dos mesmos, bem como similares. A quantidade adequada de filtro solar presente nas composições da presente invenção irá variar dependendo dos tipos de filtros solares escolhidos, bem como dos valores para UVB e/ou UVA desejados.

15 Os ingredientes adicionais que podem ser incorporados às composições da presente invenção incluem conservantes, ativos antimicrobianos e fungicidas, que são capazes de destruir micróbios, evitar o desenvolvimento de micróbios ou evitar a ação patogênica de micróbios. Estes podem estar presentes em quantidades eficazes para impedir a proliferação de micróbios

20 nas composições da presente invenção, de modo a conservar sua estabilidade microbiológica por longos períodos de tempo e sob diferentes condições ambientais.

De preferência, os ativos antimicrobianos ou fungicidas podem estar presentes nas composições da presente invenção em quantidades de

25 cerca de 0,001% a cerca de 5,0%, em peso da composição. Com a máxima preferência, esses ativos podem estar presentes nas composições da presente invenção em quantidades de cerca de 0,1% a cerca de 2%, em peso da composição. Esses ingredientes ativos antimicrobianos e fungicidas incluem, de preferência, fenóxi etanol, parabenos, metil isotiazolinona, clorofenesina e similares. Além disso, hidrocortisona, tetraciclina, ibuprofeno, naproxeno, acetaminofeno, peróxido de benzoíla, ácido salicílico, ácido lipoico,

30 zinco piritiona, cloridrato de lidocaína, clotrimazol, ácido araquidônico e mis-

turas dos mesmos podem estar incluídos nas composições da presente invenção.

5 Acredita-se que as composições da presente invenção possam, também, ser usadas para conferir suavidade no contato com os olhos a composições contendo tensoativos, como produtos de lavagem e xampus. Essas composições podem conter, em adição a ácidos graxos, o sal do dito ácido graxo e éster de ácido graxo de poliglicerila, ingredientes tensoativos incluindo, mas não se limitando a, aqueles apresentados a seguir.

10 Em uma modalidade, a composição contém um ou mais tensoativos. Em uma modalidade, a composição contém um tensoativo formador de espuma. Para uso na presente invenção, o termo "tensoativo formador de espuma" significa um tensoativo que gera espuma quando combinado com água e mecanicamente agitado. Em uma modalidade, o tensoativo formador de espuma tem uma leitura inicial quanto à altura da espuma de pelo menos  
15 20 mm, como pelo menos 50 mm, no método de teste padrão para propriedades de formação de espuma de agentes ativos de superfície, D1173-53, apresentado em "ASTM Annual Book of ASTM Standards 1001", seção 15, Volume 15.04 (usando-se uma concentração de 5 gramas por litro, uma temperatura de 49°C, e teor de dureza da água de 2,1 grãos por litro (8  
20 grãos por galão)). Os exemplos de tensoativos formadores de espuma incluem, mas não se limitam a, tensoativos formadores de espuma aniônicos, não-iônicos, catiônicos e anfotéricos.

25 Alguns exemplos não-limitadores de tensoativos aniônicos formadores de espuma incluem aqueles selecionados do grupo consistindo em sarcosinatos, sulfatos, isetionatos, tauratos, fosfatos, lactilatos e glutamatos. Os exemplos específicos incluem, mas não se limitam a, aqueles selecionados do grupo consistindo em lauril sulfato de sódio, lauril sulfato de amônio, lauret sulfato de amônio, lauret sulfato de sódio, tridecet sulfato de sódio, cetil sulfato de amônio, cetil sulfato de sódio, cocoil isetionato de amônio, lauroil isetionato de sódio, lauroil lactilato de sódio, lauroil lactilato trietanolamina, caproil lactilato de sódio, lauroil sarcosinato de sódio, miristoil sarcosinato de sódio, cocoil sarcosinato de sódio, lauroil metil taurato de sódio,

cocoil metil taurato de sódio, lauroil glutamato de sódio, miristoil glutamato de sódio e cocoil glutamato de sódio, bem como misturas dos mesmos.

Alguns exemplos não-limitadores de tensoativos não-iônicos formadores de espuma incluem aqueles selecionados do grupo consistindo em glicosídeos de alquila, poliglicosídeos de alquila, poli-hidróxi amidas de ácido graxo, ésteres de ácido graxo alcoxilados, ésteres de sacarose formadores de espuma, óxidos de amina e misturas dos mesmos. Os exemplos específicos incluem, mas não se limitam a, tensoativos não-iônicos como aqueles selecionados do grupo consistindo em C8-C14 glicose amidas, C8-C14 poliglicosídeos de alquila, cocoato de sacarose, laurato de sacarose, óxido de lauramina, óxido de cocoamina e misturas dos mesmos.

Alguns exemplos não-limitadores de tensoativos anfotéricos formadores de espuma (que incluem, também, tensoativos zwitteriônicos formadores de espuma) são aqueles selecionados do grupo consistindo em betaínas, sultaínas, hidróxi sultaínas, alquiliminoacetatos, iminodialcanoatos, aminoalcanoatos e misturas dos mesmos.

Alguns exemplos não-limitadores de tensoativos anfotéricos da presente invenção incluem lauroanfodiacetato dissódico, lauroanfoacetato sódico, cetil dimetil betaína, cocoamidopropil betaína, cocoamido propil hidróxi sultaina e misturas dos mesmos.

Na formulação da composição de filtro solar da presente invenção, descobriu-se que a composição de filtro solar da invenção, que inclui filtros solares inorgânicos, tem estabilidades de fase substanciais ao longo do tempo, ou falta de sinérese. Por exemplo, as amostras foram colocadas em um forno a 40°C, 50°C e 60°C pela duração de 6 meses, sem apresentar qualquer sinérese ou separação de fases, mantendo propriedades reológicas constantes. Um método para fabricação de uma composição de acordo com a presente invenção inclui as seguintes etapas: a fase oleosa precisa ser preparada mediante a mistura de pelo menos um ácido graxo, pelo menos um sal de ácido graxo metálico e pelo menos um éster de ácido graxo de poliglicerila. Opcionalmente, a fase oleosa pode conter, com mais preferência, pelo menos um álcool graxo, e óleos de hidrocarboneto e/ou glice-

rídeos. A mistura é então aquecida até a temperatura de fusão de cerca de 60°C a cerca de 75°C. É importante que a temperatura seja mantida inferior àquela do ponto de fusão dos componentes de ácido graxo e álcool graxo das composições da presente invenção. Separadamente, uma fase aquosa é preparada mediante a combinação de espessantes, conservantes e agentes umectantes. Os espessantes são selecionados, de preferência, do grupo consistindo em espessantes de água inorgânicos, materiais poliméricos carregados, polímeros solúveis em água e misturas dos mesmos. Os espessantes de água inorgânicos adequados ao uso nas composições da presente invenção incluem sílicas, argilas como laponita, amido modificado ou misturas dos mesmos. Os espessantes de água poliméricos incluem polímero cruzado de acrilatos/acrilato de alquila C10-30, carbômeros, copolímero de acrilóil dimetil taurato de amônio/VP, acrilóil dimetil taurato de amônio, poliacrilamida, carbopóis ou misturas dos mesmos. Os polímeros solúveis em água podem incluir polímeros como gel celulósico, fosfato de hidroxilpropil amido e misturas dos mesmos.

A fase aquosa é então adicionada à fase oleosa, sob misturação. Os filtros solares inorgânicos podem, então, ser adicionados à composição como ingredientes ativos de filtro solar. De preferência, esses filtros solares inorgânicos são pré-dispersos em óleos, glicerídeos e/ou derivados de ácido graxo separadamente, antes da adição aos demais ingredientes da fase oleosa, de modo a garantir uma dispersão uniforme das partículas.

De preferência, usando o método de distribuição definido no Exemplo 9, as partículas de filtro solar contidas nas composições desta invenção são distribuídas de modo que o índice de distribuição seja ao menos 70%, com mais preferência ao menos cerca de 80%.

Os exemplos a seguir servem para exemplificar as composições e os métodos desta invenção, mas não devem ser considerados como limitando de qualquer modo o escopo ou a abrangência da invenção.

#### 30 Exemplo 1:

Uma composição de acordo com esta invenção foi produzida da seguinte forma: foram adicionados a um recipiente, um de cada vez, os in-

5 gredientes isoestearato de poliglicerila-4, álcool cetílico, ácido esteárico, estearato de magnésio e óleos. Os ingredientes foram aquecidos entre 60°C e 75°C, sob agitação. Em um béquer separado foram adicionados água e espessante e, uma vez obtida a hidratação, um ajustador de pH foi adicionado para se obter um pH de cerca de 6 a cerca de 7. Um outro espessante, hidroxietilcelulose modificada, foi adicionado à mistura sob agitação. Uma vez obtida uma uniformidade, umectantes e conservantes foram adicionados sob aquecimento até 60 a 75°C. A fase aquosa foi, então, adicionada à fase oleosa sob misturação. A composição foi resfriada até a temperatura ambiente.

10 A seguinte formulação básica foi criada com o uso do mesmo processo descrito acima, com os ingredientes expostos a seguir.

#### Fórmula A

<b>Ingrediente</b>	<b>Fórmula 1</b>
Água	q.s.
Espessante	0,07
Ajustador de pH	0,03
Umectante	3
Conservante	0,6
Isoestearato de poliglicerila-4	6,6
Álcool cetílico	1,65
Ácido esteárico	3,3
Estearato de magnésio	6,6
Óleo	34

15 Exemplo 2: formulações de filtro solar. As formulações de filtro solar podem ser criadas com o uso do mesmo processo descrito acima, com os ingredientes expostos a seguir.

<b>Fase</b>	<b>Ingrediente</b>	<b>% em peso</b>
Água	Água	q.s.
	Espessante	0,02 a 0,09
	Umectante	1 a 3
	Conservantes	0,5 a 0,6

Ajustador de pH	Hidróxido de sódio	q.s. para pH 6 a 7
Óleo	Éster de ácido graxo	1 a 6,6
	Álcool graxo	0,5 a 1,65
	Ácido graxo	1 a 3,3
	Sal de ácido graxo	2 a 6,6
	Óleo	22 a 34
Filtro solar	Dióxido de titânio	8 a 11
	Óxido de zinco	4 a 5

### Exemplo 3: Filtro solar com óleo de fragrância

As formulações de loção apresentadas a seguir podem ser criadas com o uso do mesmo processo descrito no exemplo 1, com os ingredientes expostos a seguir.

Fase	Ingrediente	% em peso
Água	Água	q.s.
	Espessante	0,02 a 0,09
	Umectante	1 a 3
	Conservantes	0,5 a 0,6
Ajustador de pH	Hidróxido de sódio	q.s. para pH 6 a 7
Óleo	Éster de ácido graxo	1 a 6,6
	Álcool graxo	0,5 a 1,65
	Ácido esteárico	1 a 3,3
	Sal de ácido graxo	2 a 6,6
	Óleo	21,8 a 34
Filtro solar	Dióxido de titânio	8 a 11
	Óxido de zinco	4 a 5
Fragrância	Fragrância	0,2

### 5 Exemplo 4: Filtro solar com óleo ativo

As formulações de loção apresentadas a seguir podem ser criadas com o uso do mesmo processo descrito no Exemplo 1, com os ingredientes expostos a seguir.

Fase	Ingrediente	% em peso
Água	Água	q.s.
	Espessante	0,02 a 0,09
	Umectante	1 a 3
	Conservantes	0,5 a 0,6
Ajustador de pH	Hidróxido de sódio	q.s. para pH 6 a 7
	Éster de ácido graxo	1 a 6,6
	Álcool graxo	0,5 a 1,65
	Ácido esteárico	1 a 3,3
	Sal de ácido graxo	2 a 6,6
Filtro solar	Óleo	21,8 a 34
	Dióxido de titânio	8 a 11
	Óxido de zinco	4 a 5
Fragrância	Fragrância	0,2
Óleo ativo	Óleo ativo	0,1 a 1

### Exemplo 5

As formulações de creme para a pele apresentadas a seguir podem ser criadas com o uso do mesmo processo descrito no exemplo 1, com os ingredientes expostos a seguir.

### 5 Exemplo 2. Creme para a pele

Fase	Ingrediente	% em peso
Água	Água	q.s.
	Carbômero	0,04
	Glicerina	5
	Conservantes	0,8
Ajustador de pH	Hidróxido de sódio	q.s. para pH de 6 a 7
Óleo	Isoestearato de poliglicerila-4	3,2
	Álcool cetílico	0,8
	Ácido esteárico	1,6
	Estearato de magnésio	3,2
	Ácido triglicérido C18-C36	3
	Cera microcristalina	5
	Neopentanoato de isodecila	7
	Miristato de isopropila	8
	Dimeticona	1

Exemplo 6: Loção para bebês

A formulação de loção apresentada a seguir pode ser criada com o uso do mesmo processo descrito no exemplo 1, com os ingredientes expostos a seguir.

5 Loção para bebês

Fase	Ingrediente	% em peso
Água	Água	q.s.
	Hidróxi etil celulose	0,2
	Glicerina	5
	Fenóxi etanol	0,5
	Metil parabeno	0,2
	Etil parabeno	0,1
	Óleo	Isoestearato de poliglicerila-4
Álcool cetílico		0,9
Ácido esteárico		1,8
Estearato de magnésio		3,6
Palmitato de etilexila		3
Petrolato		6
Estearato de glicerila		2
Miristato de isopropila		8
	Dimeticona	1

Exemplo 7: Avaliação da estrutura física das composições

Para avaliar a presença de uma estrutura lamelar e esferulítica, a fórmula foi examinada mediante o uso de difração de raios X a baixo ângulo (SAXS, e microscopia eletrônica de varredura com criogenia (crio-SEM). O padrão de dispersão SAXS da amostra ilustra a existência de duas fases lamelares, sendo uma fase de natureza G esferulítica quanto a seu pico e sua intensidade, com espaçamento  $d$  de  $51,5 \text{ \AA}$  e  $45,8 \text{ \AA}$  respectivamente. A relação entre o pico de primeira ordem e os picos de baixa intensidade, segundo, terceiro e quarto, confirma a estrutura lamelar. Esse padrão é refletido na figura 1.

Exemplo 8: Avaliação quanto à suavidade no contato com os olhos

Um método *in vitro* usando o modelo de córnea Epi-Ocular foi usado para avaliar as composições da presente invenção quanto à suavidade no contato com os olhos. O modelo Epi-Ocular é um modelo de córnea derivado de queratinócitos humanos, que é então tratado com o item para teste durante 3, 30 e 60 minutos. A viabilidade da célula é, então, medida quantitativamente após extração a partir do tecido. É calculado o ponto no tempo em que 50% das células estão mortas (ET50), o que permite a classificação do item testado. O critério para aprovação no resultado do teste Epi-ocular é que o ponto no tempo de ET50 seja maior que ou igual a 24 horas.

Tabela 1 - Itens para teste

n°	Item
1	Fórmula A
2	Fórmula A com filtros solares físicos, TiO <sub>2</sub> e ZnO
3	Fórmula A com fragrância
4	Fórmula A com óleo ativo

Tabela 2 - Resultados

n°	Item
1	ET50 >/= 24 horas -- suave
2	ET50 >/= 24 horas -- suave
3	ET50 >/= 24 horas -- suave
4	ET50 >/= 24 horas -- suave

Exemplo 9: Avaliação da distribuição de partículas de filtro

A finalidade deste exemplo é mostrar como seria a distribuição das partículas de filtro se elas fossem espalhadas sobre um substrato ou sobre a pele. Uma vez que estudos anteriores, como o descrito em Teichmann et al. (J. Biomed. Opt., Vol. 11, 064005 (2006)) mostram a distribuição como vertical em relação à superfície da pele, foi desenvolvido um método que mostra a distribuição lateral.

Para se poder avaliar a espalhabilidade e a distribuição das partículas da presente invenção e de partículas de formulações de filtro solar

comparativas, usou-se microscopia eletrônica de varredura ambiental (ESEM - environmental scanning electron microscopy) para ver a distribuição das partículas inorgânicas do filtro solar. O instrumento de ESEM usado foi o microscópio TM-1000 Tabletop Microscope (Hitachi High Technologies America Inc, Schaumburg IL). Os parâmetros de coleta foram: tensão de aceleração: 15.000 V, ampliação: 10.000 X, corrente de emissão: 40,8 mA, velocidade de varredura: slow3, tamanho da imagem: 1280x1040 pixels. Filmes de formulações de filtro solar foram criadas da seguinte forma: 3 gotas de 50 uL da formulação foram depositadas em um padrão de coluna sobre VITRO-SKIN (IMS Inc, Portland ME) hidratado; as gotas foram espalhadas sobre um filme contínuo usando-se uma barra de nivelamento com um vão de 500 um; pequenas tiras do filme foram cortadas e montadas para análise por ESEM. Após a secagem de um dia para o outro, foram feitas micrografias por ESEM das amostras, com ampliação de 10.000 vezes, tanto para as amostras do filme com filtro solar, quanto para as amostras em branco de controle VITRO-SKIN. As micrografias foram analisadas no Adobe Photoshop 7.0 ou no Adobe Photoshop 11 (Adobe Systems Incorporated, San Jose, CA) usando-se o seguinte procedimento: para cada amostra, a intensidade do limiar foi gerada pela média da 97ª intensidade porcentual (do histograma) de três regiões de 300x300 pixels do controle VITRO-SKIN. Usando-se o limiar calculado, foi gerada uma imagem em preto e branco na qual as áreas brancas são mais claras que o controle e as áreas pretas são mais escuras que o controle. O "índice de distribuição" é a porcentagem de pixels brancos na imagem binária. As formulações testadas foram as seguintes: Fórmula A com 17,17% de partículas de filtro inorgânico de UV (Exemplo 1 da invenção), filtro solar Burt's Bees Chemical Free Sunscreen com FPS 15 (Burt's Bees, Durham, NC) (exemplo comparativo 1) e filtro solar hidratante California Baby Moisturizing Sunscreen No Fragrance com FPS 18 (California Baby, Los Angeles, CA) (exemplo comparativo 2). Os exemplos comparativos escolhidos como partículas de filtro usadas para fornecer proteção solar foram partículas inorgânicas. A Vitro Skin não tratada foi também analisada e é chamada de

“branco”. Todas as amostras foram testadas em triplicata.

	Índice de distribuição média	Desvio padrão do índice de distribuição
Fórmula A	83,3	11,6
Comparativo 1	45,4	11,1
Branco	2,3	1,4
Comparativo 2	8,9	8,3

Conforme mostrado nas figuras e nos dados acima, o exemplo 1 da presente invenção fornece uma distribuição de partículas de filtro de ao menos 70%. Os exemplos comparativos não apresentam uma distribuição como esta. Uma distribuição uniforme de partículas forneceria uma cobertura uniforme e completa da pele, fornecendo, portanto, uma proteção melhor contra radiação ultravioleta em uma proporção maior da pele exposta.

## REIVINDICAÇÕES

1. Composição de filtro solar para uso tópico, tendo pelo menos duas fases, que é uma estrutura autoformante lamelar e esferulítica que compreende: pelo menos um éster de ácido graxo de poliglicerila, pelo me-  
5 nos um ácido graxo, e pelo menos um sal de ácido graxo metálico, pelo me-  
nos um filtro solar e uma fase aquosa.

2. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o dito ácido graxo e o dito sal de ácido graxo metálico estão presentes na compo-  
sição a uma razão de cerca de 1:2 a cerca de 1:4.

10 3. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o dito ácido graxo, o dito éster de ácido graxo de poliglicerila e o dito sal de ácido gra-  
xo metálico estão presentes na composição a uma razão de cerca de 1:1:2.

4. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o dito éster de ácido graxo de poliglicerila e o dito ácido graxo estão presentes na  
15 dita composição a uma razão de cerca de 6:1 a cerca de 1:1.

5. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que a dita composição compreende, adicionalmente, um álcool graxo.

6. Composição, de acordo com a reivindicação 5, em que o dito álcool graxo é um álcool graxo de cadeia reta tendo de 14 a 22 átomos de  
20 carbono.

7. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o dito ácido graxo é um ácido graxo de cadeia reta tendo de 10 a 22 átomos de  
carbono.

8. Composição, de acordo com a reivindicação 7, em que o dito  
25 ácido graxo é selecionado do grupo que consiste em ácido mirístico, ácido  
palmítico, ácido esteárico e ácido araquídico.

9. Composição, de acordo com a reivindicação 8, em que o dito ácido graxo é ácido esteárico.

10. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o dito  
30 sal do dito ácido graxo é selecionado do grupo que consiste em sais de álcali  
e de metal alcalino.

11. Composição, de acordo com a reivindicação 10, em que o

dito sal do dito ácido graxo é um sal de metal alcalino.

12. Composição, de acordo com a reivindicação 11, em que o dito sal de metal alcalino é selecionado de magnésio, cálcio, amônio e misturas dos mesmos.

5 13. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que a dita fase aquosa tem um pH de pelo menos 5.

14. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que a dita composição compreende, adicionalmente, pelo menos um óleo.

10 15. Composição, de acordo com a reivindicação 14, em que o dito pelo menos um óleo é selecionado do grupo que consiste em vitaminas D, E, K e A, filtros solares, óleo à base de hidrocarboneto, silicones, derivados de ácido graxo, glicerídeos, óleos vegetais, derivados de óleo vegetal, ésteres de alquila, ésteres de cera, derivados de cera de abelha, esteróis e fosfolipídeos, e misturas dos mesmos.

15 16. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que a dita composição compreende, adicionalmente, pelo menos um álcool poli-hídrico.

17. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que a dita composição é fisicamente estável durante pelo menos 60 dias a 60°C.

20 18. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o dito componente de filtro solar é um filtro solar orgânico.

19. Composição de filtro solar, de acordo com a reivindicação 18, em que o dito componente de filtro solar orgânico é selecionado do grupo que consiste em PABA e p-aminobenzoatos, silicilatos, cinamatos, benzofenonas, antranilatos, dibenzoil metanenos, derivados de cânfora e misturas dos mesmos.

25 20. Composição de filtro solar, de acordo com a reivindicação 1, em que o dito componente de filtro solar é um filtro solar inorgânico.

21. Composição de filtro solar, de acordo com a reivindicação 20, em que o dito filtro solar inorgânico é selecionado do grupo que consiste em óxido de zinco, dióxido de titânio e misturas dos mesmos.

30 22. Composição de filtro solar, de acordo com a reivindicação 21, em que o filtro solar inorgânico fornece uma distribuição de ao menos 70%.

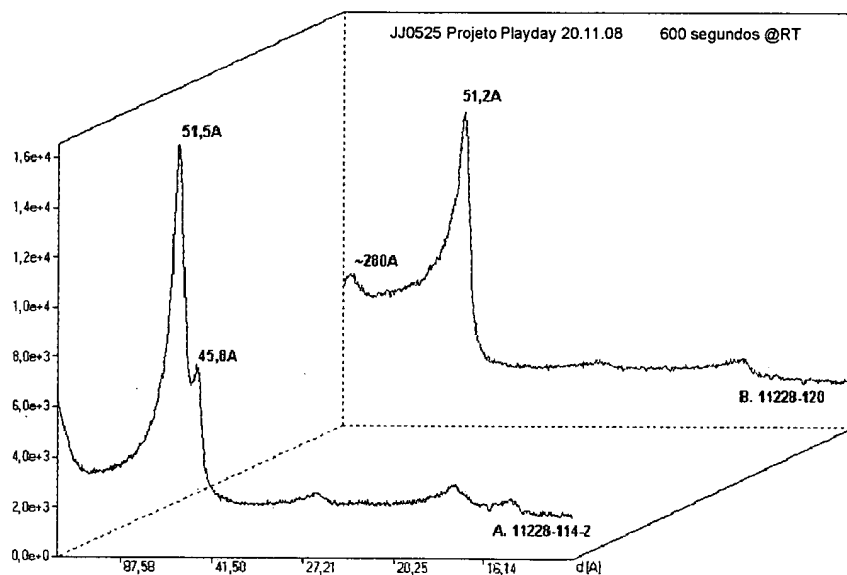


Fig .1

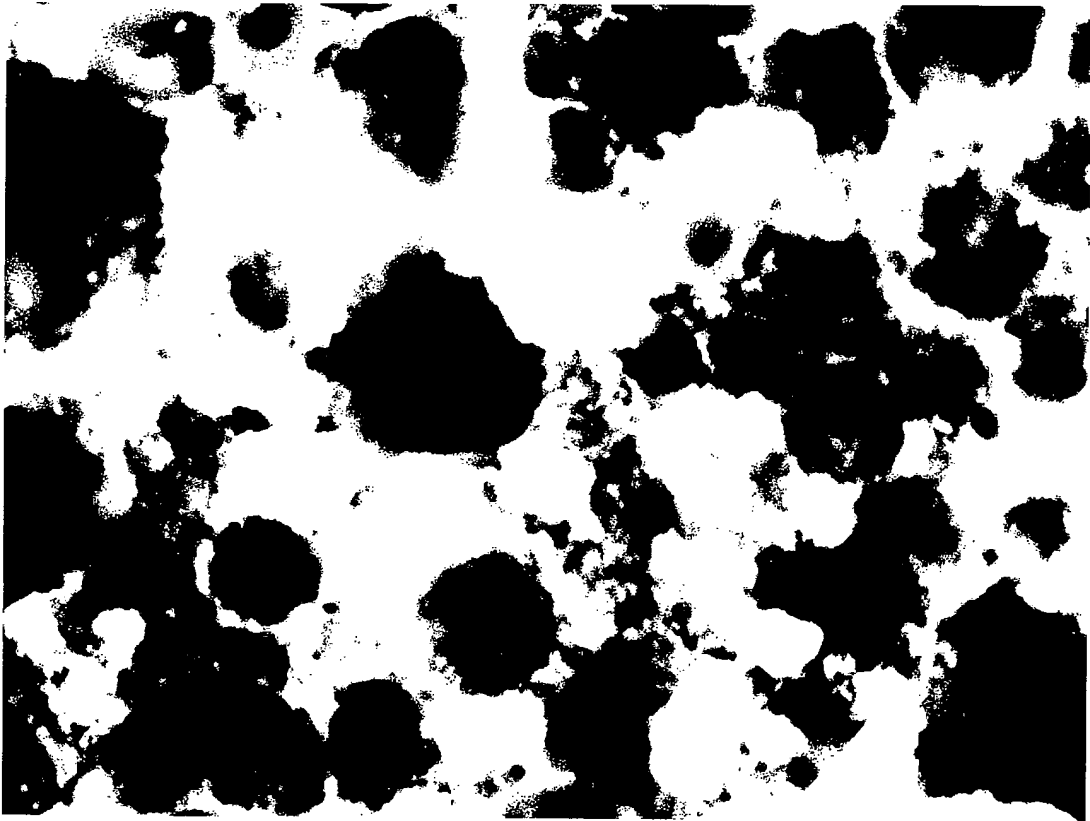


Fig. 2

Exemplo comparativo 1

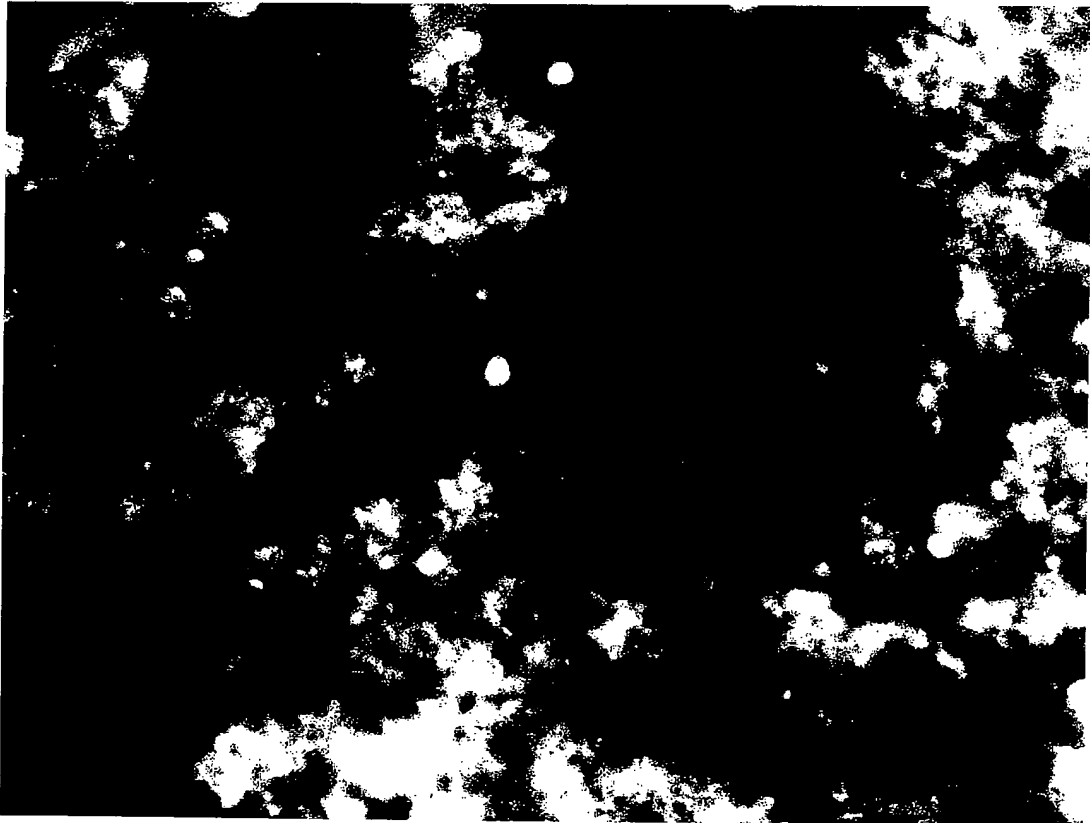


Fig. 3

Exemplo comparativo 2



Fig. 4

Branco processado

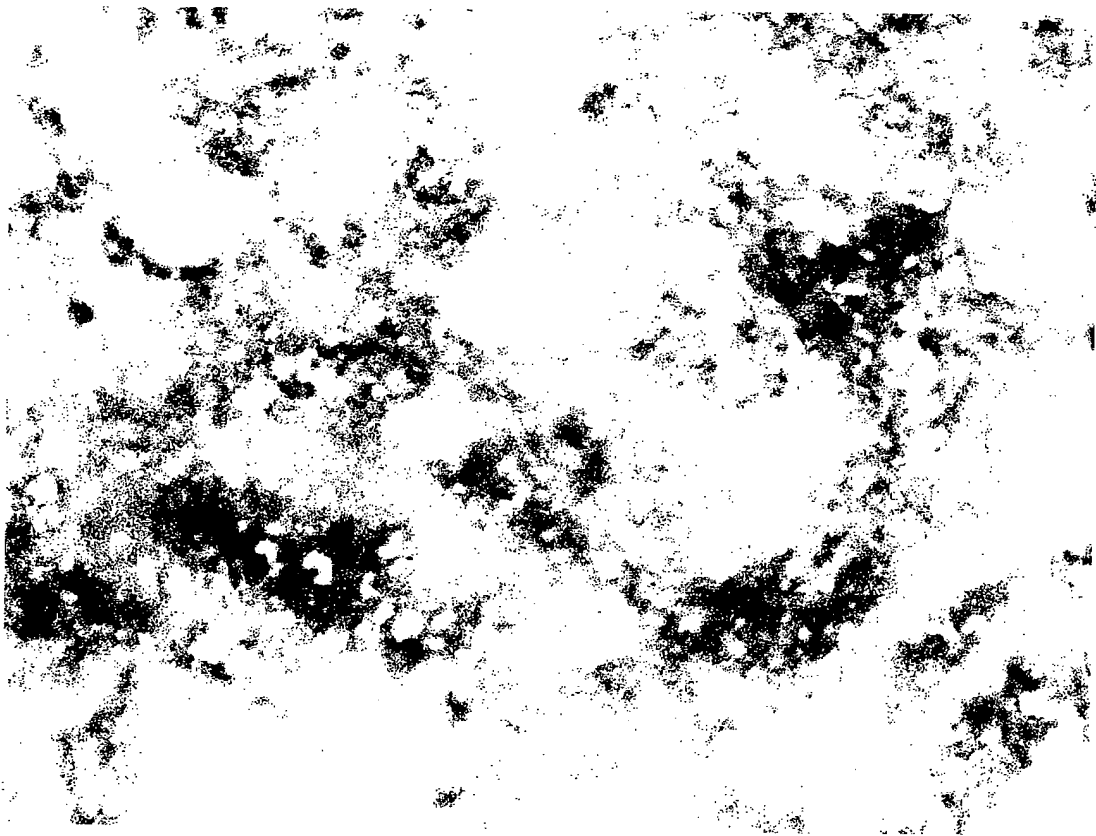


Fig. 5  
Exemplo 1 da invenção

R 1000362-3

## RESUMO

Patente de Invenção: "COMPOSIÇÕES DE FILTRO SOLAR PARA CUIDADOS PESSOAIS COM REDUZIDA IRRITAÇÃO OCULAR".

5 A presente invenção refere-se a uma composição auto-organi-  
zável lamelar e esferulítica que é estável e requer uma quantidade mínima  
de energia, compreendendo: água para mistura, álcool graxo, ácido graxo,  
sal de ácido graxo, éster de ácido graxo de poliglicerila e óleos. A presente  
invenção refere-se a uma composição que pode oferecer os benefícios de  
10 suavidade no contato com os olhos, distribuição uniforme dos filtros solares  
físicos sobre a pele e estabilidade otimizada.