

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

(21) **PI0905237-2 A2**

(22) Data de Depósito: 15/12/2009
(43) Data da Publicação: 22/03/2011
(RPI 2098)



(51) Int.Cl.:

A61K 8/44
A61K 8/37
A61K 8/40
A61Q 19/08

(54) Título: **COMPOSIÇÃO COSMÉTICA E/OU DERMATOLÓGICA, E, PROCESSO DE TRATAMENTO NÃO TERAPÊUTICO PARA CUIDAR E/OU REPARAR MATERIAIS DE QUERATINA**

(30) Prioridade Unionista: 15/12/2008 FR 08 58566, 15/12/2008 FR 08 58568, 15/12/2008 FR 08 58590, 15/12/2008 FR 08 58599, 22/12/2008 US 61/193761, 22/12/2008 US 61/193762, 22/12/2008 US 61/193763, 22/12/2008 US 61/193764

(73) Titular(es): L'oreal

(72) Inventor(es): Cécile Kermorvan, Véronique Chevalier

(57) Resumo: COMPOSIÇÃO COSMÉTICA E/OU DERMATOLÓGICA, E, PROCESSO DE TRATAMENTO NÃO TERAPÊUTICO PARA CUIDAR E/OU REPARAR MATERIAIS DE QUERATINA. A presente invenção refere-se a uma composição cosmética e dermatológica que compreende, em um meio fisiologicamente aceitável contendo pelo menos um óleo: (a) pelo menos um composto de fórmula geral (Ia); e (b) uma quantidade eficiente de pelo menos um solvente selecionado de: (i) isononanoato de isononila; (ii) isossorbeto de dimetila; (iii) os ésteres de aminoácido de fórmula (II) ; e (iv) uma mistura dos mesmos.

“COMPOSIÇÃO COSMÉTICA E/OU DERMATOLÓGICA, E, PROCESSO DE TRATAMENTO NÃO TERAPÊUTICO PARA CUIDAR E/OU REPARAR MATERIAIS DE QUERATINA”

A presente invenção diz respeito às composições cosméticas e/ou dermatológicas compreendendo pelo menos um éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetolenodiaminadiacético e pelo menos um solvente particular.

As composições de acordo com a invenção são em particular destinadas para cuidar e/ou reparar os materiais de queratina, e especialmente a pele.

Os ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenidiaminadiacético são descritos no documento WO 94/11338 como quelantes e descontaminantes de ferro contra a formação de radicais livres de hidroxila, tornando-os vantajosos para a proteção de materiais de queratina, e especialmente a pele, contra o estresse oxidativo causado especialmente por raios ultravioletas. Estes derivados são desta maneira úteis na prevenção de fotoenvelhecimento cutâneo.

No entanto, estes compostos possuem o aspecto particular de serem sólidos em temperatura ambiente e de serem moderadamente solúveis ou insolúveis nas matérias primas líquidas comumente usadas nos cosméticos e/ou na dermatologia. Em particular, estes compostos são insolúveis em água, e são moderadamente solúveis em polióis tais como glicerol ou propileno glicol, e também moderadamente solúveis em óleos apolares, por exemplo, isodocecano, poliisobuteno hidrogenado (Parleam da NOF Corporation) ou ciclopentasiloxano.

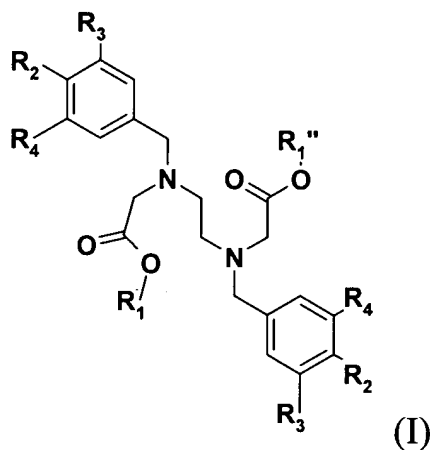
Agora, é necessário para estes compostos serem formulados em uma forma solubilizada de modo a completamente explorar sua atividade, e também é preferível para a sua solubilização ser mantido durante um tempo de modo a evitar qualquer recristalização durante a armazenagem das composições compreendendo tais compostos.

O objetivo da presente invenção é, exatamente, propor uma nova formulação galênica de ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminodiacético que supere os inconvenientes acima mencionados, e assim permita que estas composições sejam incorporados em uma forma dissolvida duradoura.

Especificamente, os inventores descobriram, inesperadamente, que a combinação de certos ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminodiacético com pelo menos um solvente particular permite que estes compostos sejam dissolvidos enquanto evita sua recristalização, especialmente após a armazenagem durante dois meses em temperatura ambiente (25°C).

Assim, de acordo com uma de seus aspectos, a invenção diz respeito a uma composição cosmética e/ou dermatológica compreendendo, em um meio fisiologicamente aceitável contendo pelo menos um óleo:

(a) pelo menos um composto de fórmula geral (I) :



em que:

- cada grupo R_1 e R''_1 independentemente representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 6 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 6 átomos de carbono, com a condição de que os dois grupos R_1 e R''_1 simultaneamente não representem um átomo de hidrogênio,

- R_2 , R_3 e R_4 representam, independentemente um do outro,

um átomo de hidrogênio ou um radical $-OR_5$, e

- R_5 representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 5 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 5 átomos de carbono,

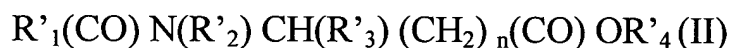
5 ou sais dos mesmos, e

(b) uma quantidade eficaz de pelo menos um solvente selecionado de:

(i) isononanoato de isononila;

(ii) isossorbeto de dimetila;

10 (iii) ésteres de aminoácido de fórmula (II) :



em que:

- n é um número inteiro igual a 0, 1 ou 2,

15 - R'_1 representa um radical de alquila ou alquenila linear ou ramificado C_5 a C_{21} ,

- R'_2 representa um átomo de hidrogênio ou um grupo de alquila C_1 a C_3 ,

20 - R'_3 representa um radical selecionado do grupo formado por um átomo de hidrogênio, um grupo de metila, um grupo de etila e um radical de alquila linear ou ramificado C_3 ou C_4 , e

- R'_4 representa um radical de alquila linear ou ramificado C_1 a C_{10} , um radical de alquenila linear ou ramificado C_2 a C_{10} ou um resíduo de esterol; e

(iv) uma mistura dos mesmos.

25 Como especificado mais abaixo, o dito composto de fórmula geral (I) está vantajosamente presente nas composições de acordo com a invenção em uma forma dissolvida.

As composições de acordo com a invenção são vantajosamente usadas cuidar e/ou repor materiais de queratina, e especialmente a pele.

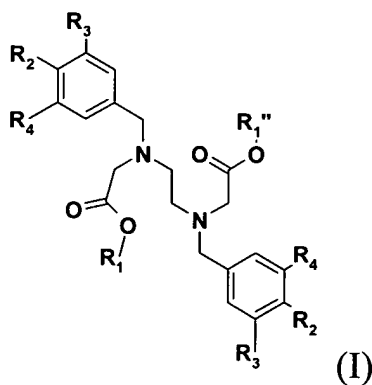
A combinação de um éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminodiacético de acordo com a invenção com um tal solvente torna possível obter composições cosméticas ou dermatológicas que são notavelmente eficazes para as aplicações acima mencionadas.

5 As composições de acordo com a invenção podem ser especialmente destinadas para o tratamento e/ou proteção dos materiais de queratina humanos, em particular a pele, contra o envelhecimento causado especialmente pela exposição à luz do sol (raios ultravioletas).

10 Assim, de acordo com outro de seus aspectos, a presente invenção refere-se a um processo de tratamento não terapêutico para cuidar e/ou repor os materiais de queratina, especialmente a pele, compreendendo pelo menos a etapa de aplicação nos ditos materiais de queratina, e especialmente na pele, de pelo menos uma composição como definida anteriormente.

15 ÉSTER DE ÁCIDO N,N'-DIARILMETILENOETILENODIAMINADIACÉTICO

Os ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminodiacético sob consideração de acordo com a invenção são compostos de fórmula geral (I) :



20 em que:

- cada grupo R_1 e R''_1 independentemente representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 6 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de

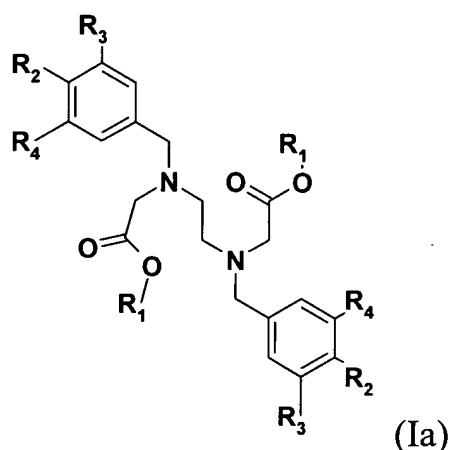
3 a 6 átomos de carbono, com a condição de que os dois grupos R_1 e R''_1 simultaneamente não representem um átomo de hidrogênio,

- R_2 , R_3 e R_4 representam, independentemente um do outro, um átomo de hidrogênio ou um radical $-OR_5$, e

5 - R_5 representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 5 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 5 átomos de carbono.

Estes compostos podem ser obtidos através de qualquer método conhecido por aqueles versados na técnica, por exemplo, de acordo com a preparação dos processos descritos no documento WO 94/11338.

De acordo com uma primeira forma de realização, eles são mais particularmente ésteres de ácido N,N' -diarilmetilenoetilenodiaminadiacético de fórmula geral (Ia) :



em que:

15 - R_1 representa um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 6 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 6 átomos de carbono,

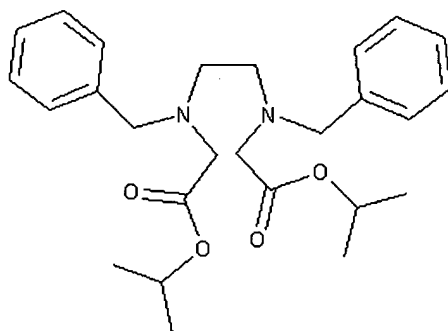
- R_2 , R_3 e R_4 representam, independentemente um do outro, um átomo de hidrogênio ou um radical $-OR_5$, e

20 - R_5 representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 5 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 5 átomos de carbono.

De acordo com uma forma de realização, R_2 , R_3 e R_4 representam um átomo de hidrogênio.

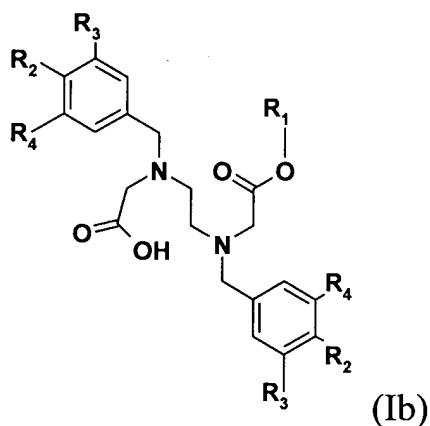
De acordo com outra forma de realização, R_1 significa um radical de isopropila.

5 Pode ser especialmente o composto de fórmula geral (Ia) em que R_2 , R_3 e R_4 representam um átomo de hidrogênio e R_1 significa um radical de isopropila, isto é, o éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético de fórmula:



10 Este composto é mais particularmente descrito no Exemplo 16 de documento WO 94/11338.

De acordo com uma segunda forma de realização, eles também podem ser ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético de fórmula geral (Ib) :



em que:

15 - R_1 representa um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 6 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado

contendo de 3 a 6 átomos de carbono,

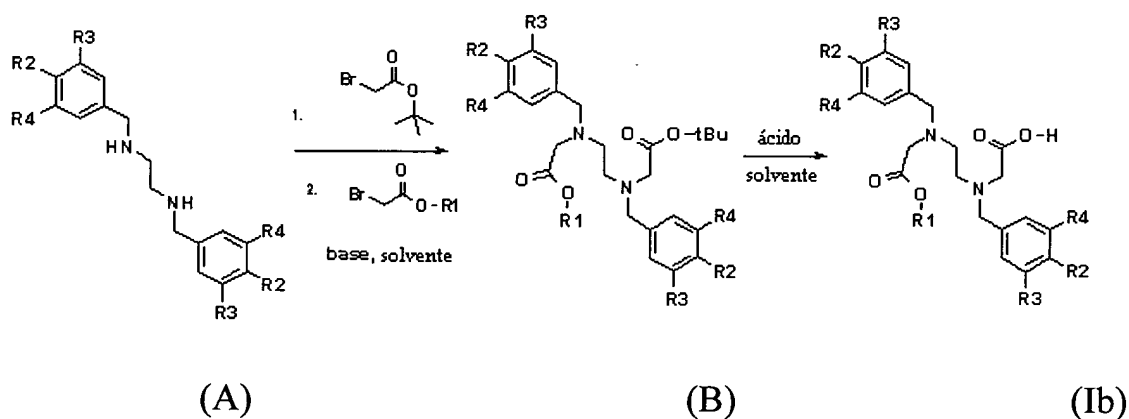
- R_2 , R_3 e R_4 representam, independentemente um do outro, um átomo de hidrogênio ou um radical $-OR_5$, e

- R_5 representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 5 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 5 átomos de carbono.

Os compostos de fórmula (Ib) são novos compostos não descritos na técnica anterior. A invenção também se refere a tais compostos.

Um composto de fórmula (Ib) que pode ser mencionado é o éster isopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético.

Os compostos de fórmula (Ib) podem ser obtidos de acordo com o esquema sintético I mediante a reação de uma etilenodiamina submetida a dibenzila (A) com um equivalente molar de bromoacetato de terc-butila na presença de uma base, por exemplo, carbonato de potássio, em um solvente polar, por exemplo, dimetilformamida, e depois mediante a reação de um equivalente molar do bromoacetato derivado do álcool R_1OH . O diéster intermediário (B) obtido é então seletivamente hidrolisado na sua parte terc-butila em meio ácido (por exemplo, ácido clorídrico ou ácido trifluoroacético) para fornecer o hemiéster de fórmula (Ib).



Esquema I

Os sais de compostos (I), (Ia) e (Ib) descritos anteriormente incluem sais não tóxicos convencionais dos ditos compostos, tais como

aqueles formados de ácidos orgânicos ou minerais. Exemplos que podem ser mencionados incluem os sais de ácidos minerais, tais como ácido sulfúrico, ácido clorídrico, ácido bromídrico, ácido hidroiodico, ácido fosfórico ou ácido bórico. Menção pode ser feita dos sais de ácidos orgânicos, que podem compreender um ou mais grupos de ácido carboxílico, sulfônico ou fosfônico. Eles podem ser ácidos alifáticos lineares, ramificados ou cíclicos, ou alternativamente ácidos aromáticos. Estes ácidos também podem incluir um ou mais heteroátomos selecionados de O e N, por exemplo, na forma de grupos de hidroxila. Menção pode ser feita especialmente de ácido propiônico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tereftálico, ácido cítrico e ácido tartárico.

Os sais preferidos são aqueles obtidos de ácido clorídrico, ácido sulfúrico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tartárico e ácido cítrico.

As composições de acordo com a invenção podem compreender de 0,01% a 5% em peso, preferivelmente de 0,1% a 2,5% em peso e especialmente de 0,5% a 1% em peso de composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib), em particular de fórmula (Ia), em relação ao peso total da dita composição.

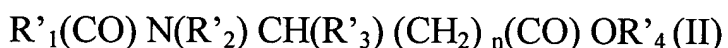
SOLVENTE

As composições de acordo com a invenção compreendem uma quantidade suficiente de pelo menos um solvente selecionado de:

(i) isononanoato de isononila;

(ii) isossorbeto de dimetila;

(iii) ésteres de aminoácido de fórmula (II) :



em que:

- n é um número inteiro igual a 0, 1 ou 2,

- R'₁ representa um radical de alquila ou alquenila linear ou

ramificado C₅ a C₂₁,

- R'₂ representa um átomo de hidrogênio ou um grupo de alquila C₁ a C₃,

5 - R'₃ representa um radical selecionado do grupo formado por um átomo de hidrogênio, um grupo de metila, um grupo de etila e um radical de alquila linear ou ramificado C₃ ou C₄, e

- R'₄ representa um radical de alquila linear ou ramificado C₁ a C₁₀, um radical de alquênica linear ou ramificado C₂ a C₁₀ ou um resíduo de esterol; e

10 (iv) uma mistura dos mesmos.

De acordo com uma primeira forma de realização da invenção, o solvente é isononanoato de isononila.

De acordo com uma segunda forma de realização da invenção, o solvente é isossorbeto de dimetila.

15 De acordo com uma terceira forma de realização, o solvente é um éster de aminoácido de fórmula (II) como indicado anteriormente.

Os ésteres de aminoácido que são adequados para uso na invenção, e o processo para a sua sintetização, são especialmente descritos nos pedidos de patente EP 1 044 676 e EP 0 928 608 da companhia
20 Ajinomoto Co.

Nos ésteres de aminoácido de fórmula (II), o grupo R'₁(CO) - é preferivelmente um grupo de acila de um ácido preferivelmente selecionado do grupo formado por ácido cáprico, ácido láurico, ácido mirístico, ácido palmítico, ácido esteárico, ácido beênico, ácido linoléico, ácido linolênico,
25 ácido oléico, ácido isoesteárico, ácido 2-etilexanóico, ácidos graxos de óleo de coco e ácidos graxos de óleo de palmiste. Estes ácidos graxos também podem conter um grupo de hidroxila. Ainda mais preferivelmente, será ácido láurico.

A parte -N(R'₂) CH(R'₃) (CH₂)_n(CO) - do éster de aminoácido

é preferivelmente selecionado dos seguintes aminoácidos: glicina, alanina, valina, leucina, isoleucina, serina, treonina, prolina, hidroxiprolina, β -alanina, ácido aminobutírico, ácido aminocapróico, sarcosina, N-metil- β -alanina.

Ainda mais preferivelmente, será sarcosina.

5 A parte dos ésteres de aminoácido que correspondem ao grupo OR'₄ pode ser obtida de alcoóis selecionados do grupo formado por metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, terc-butanol, isobutanol, 3-metil-1-butanol, 2-metil-1-butanol, álcool amílico, pentanol, hexanol, cicloexanol, octanol, 2-etilexanol, decanol, álcool laurílico, álcool miristílico, álcool
10 cetílico, álcool cetoestearílico, álcool estearílico, álcool oleílico, álcool beenílico, álcool de jojoba, álcool 2-hexadecílico, álcool 2-octildodecanol e álcool isostearílico.

Estes ésteres de aminoácido podem ser obtidos em particular a partir de fontes naturais de aminoácidos. Neste caso, os aminoácidos se
15 originam da hidrólise de proteínas vegetais naturais (aveia, trigo, feijão de soja, palmeira ou coco) e depois necessariamente levam as misturas de aminoácidos que subsequenteiramente necessitam de serem esterificadas e depois N-aciladas. A preparação de tais aminoácidos é mais particularmente descrita no pedido de patente FR 2 796 550, que é aqui incorporado por
20 referência.

O éster de aminoácido mais particularmente preferível para o seu uso na presente invenção é N-lauroilsarcosinato de isopropila de fórmula $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_{10}\text{CO}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{COO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$.

Um exemplo de um N-lauroilsarcosinato de isopropila que
25 pode ser mencionado é o produto vendido pela companhia Ajinomoto sob a referência Eldew SL-205®.

No contexto da presente invenção, a expressão “quantidade eficaz de solvente ou de mistura de solventes” de acordo com a invenção significa uma quantidade suficiente deste solvente ou mistura de solventes

para dissolver o éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético de fórmula (I), (Ia) ou (Ib) e assim impedir qualquer recristalização, especialmente durante a armazenagem.

5 Por razões óbvias, a quantidade de solvente de acordo com a invenção que é suficiente para dissolver o éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético é propensa a variar dentro de uma ampla faixa como uma função especialmente da natureza química e/ou da quantidade do dito éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético a ser dissolvido e da natureza do solvente ou mistura de solventes usada. O
10 ajuste da quantidade de solvente de acordo com a invenção forma parte da competência de uma pessoa versada na técnica.

É claro que, nas formas de realização em que estas características de solvente entre um dos três solventes acima mencionados ou uma mistura dos mesmos, a presença combinada de um outro solvente pode
15 ser considerada, com a condição, naturalmente, que este composto adicional não prejudique a solubilidade proporcionada pelo solvente requerido de acordo com a invenção.

Como uma ilustração, o solvente de acordo com a invenção pode estar presente em uma quantidade variando de 0,05% a 25% em peso, mais preferivelmente de 0,5% a 12,5% em peso e mais particularmente de
20 2,5% a 5% em peso em relação ao peso total da composição.

De acordo com uma forma de realização, o solvente de acordo com a invenção e o composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib) podem estar presente em uma relação de massa [solvente/composto de fórmula geral (I),
25 (Ia) ou (Ib)] pelo menos igual a 1,5, especialmente variando de 1,5 a 15 e preferivelmente variando de 1,5 a 10.

De acordo com uma forma de realização, o solvente de acordo com a invenção e o composto de fórmula geral (Ia) podem estar presentes em uma relação de massa [solvente/composto de fórmula geral (Ia)] pelo menos

igual a 1,5, especialmente variando de 1,5 a 15 e preferivelmente variando de 1,5 a 10.

Quando o solvente for isononanoato de isononila, a relação de massa [isononanoato de isononila/composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib)]
5 pode especialmente ser pelo menos igual a 5,25, por exemplo, variando de 5,25 a 8 e preferivelmente variando de 5,25 a 6,5.

Em particular, a relação de massa [isononanoato de isononila/composto de fórmula geral (Ia)] pode especialmente ser pelo menos igual a 5,25, por exemplo, variando de 5,25 a 8 e preferivelmente variando de
10 5,25 a 6,5.

Quando o solvente for isossorbeto de dimetila, a relação de massa [isossorbeto de dimetila/composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib)] pode especialmente ser pelo menos igual a 1,6, por exemplo, variando de 1,6 a 10 e preferivelmente variando de 1,6 a 6.

15 Em particular, a relação de massa [isossorbeto de dimetila/composto de fórmula geral (Ia)] pode especialmente ser pelo menos igual a 1,6, por exemplo, variando de 1,6 a 10 e preferivelmente variando de 1,6 a 6.

Quando o solvente for um éster de aminoácido de fórmula (II),
20 a relação de massa [éster de aminoácido de fórmula (II) /composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib)] pode ser especialmente pelo menos igual a 4,5, por exemplo, variando de 4,5 a 10 e preferivelmente variando de 4,5 a 6.

Em particular, a relação de massa [éster de aminoácido de fórmula (II) /composto de fórmula geral (Ia)] pode especialmente ser pelo
25 menos igual a 4,5, por exemplo, variando de 4,5 a 10 e preferivelmente variando de 4,5 a 6.

Em particular, a relação de massa [N-lauroilsarcosinato de isopropila/éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etileno diamina-N,N'-diacético] pode ser pelo menos igual a 4,5, por exemplo, variando de

4,5 a 10 e preferivelmente variando de 4,5 a 6.

MEIO FISIOLÓGICAMENTE ACEITÁVEL

5 As composições usadas de acordo com a invenção contêm um meio fisiologicamente aceitável, isto é, um meio que é compatível com os tecidos cutâneos tais como a pele e o couro cabeludo.

Além dos solventes de acordo com a invenção mencionados anteriormente, este meio fisiologicamente aceitável compreende pelo menos um óleo diferente dos solventes anteriormente descritos.

10 Como óleos que podem ser usados na composição da invenção, exemplos que podem ser mencionados incluem:

- óleos com base em hidrocarboneto de origem animal, tais como peridrosqualeno;

- óleos com base em hidrocarboneto de origem vegetal, tais como triglicerídeos líquidos de ácidos graxos contendo de 4 a 10 átomos de carbono, por exemplo, triglicerídeos de ácido heptanóico ou octanóico, ou
15 alternativamente, por exemplo, óleo de girassol, óleo de milho, óleo de soja, óleo de polpa, óleo de semente de uva, óleo de semente de gergelim, óleo de avelã, óleo de damasco, óleo de macadâmia, óleo de arara, óleo de mamona, óleo de abacate, triglicerídeos de ácido caprílico/cáprico, por exemplo,
20 aqueles vendidos pela companhia Stearineries Dubois ou aqueles vendidos sob os nomes Miglyol 810, 812 e 818 pela companhia Dynamit Nobel, óleo de jojoba e óleo de manteiga de karité;

- ésteres e éteres sintéticos, especialmente de ácidos graxos, por exemplo, os óleos de fórmulas R_1COOR_2 e R_1OR_2 em que R_1 representa
25 um resíduo de ácido graxo contendo de 8 a 29 átomos de carbono e R_2 representa uma cadeia com base em hidrocarboneto ramificada ou não ramificada contendo de 3 a 30 átomos de carbono, por exemplo, óleo Purcellin, miristato de isopropila, palmitato de 2-etilexila, estearato de 2-octildodecila, erucato de 2-octildodecila ou isoestearato de isoestearila;

ésteres hidroxilados, por exemplo, lactato de isoestearila, hidroxiestearato de octila, hidroxiestearato de octildodecila, malato de diisoestearila ou citrato de triisocetila; heptanoatos, octanoatos ou decanoatos de alcoóis graxos; ésteres de poliol, por exemplo, dioctanoato de propileno glicol, dieptanoato de neopentil glicol e diisononanoato de dietileno glicol; e ésteres de pentaeritritol, por exemplo, tetraisoestearato de pentaeritritila;

- hidrocarbonetos lineares ou ramificados, de origem mineral ou sintética, tais como parafinas líquidas voláteis ou não voláteis, e derivados destes, vaselina, polidecenos, e poliisobuteno hidrogenado tal como óleo Parleam;

- alcoóis graxos contendo de 8 a 26 átomos de carbono, por exemplo, álcool cetílico, álcool estearílico e uma mistura dos mesmos (álcool cetilestearílico), octildodecanol, 2-butiloctanol, 2-hexildecanol, 2-undecilpentadecanol, álcool oleílico ou álcool linoleílico;

- óleos de silicona, por exemplo, polimetilsiloxanos voláteis ou não voláteis (PDMS) com uma cadeia de silicona linear ou cíclica, que são líquidos ou pastosos em temperatura ambiente, especialmente ciclopolidimetilsiloxanos (ciclometiconas) tais como cicloexassiloxano; polidimetilsiloxanos compreendendo grupos de alquila, alcóxi ou fenila, que são pendentos ou no final de uma cadeia de silicona, estes grupos contendo de 2 a 24 átomos de carbono; fenilsiliconas, por exemplo, fenil trimeticonas, fenil dimeticonas, feniltrimetilsiloxidifenilsiloxanos, difenil dimeticonas, difenilmetildifeniltrissiloxanos ou silicatos de 2-feniletil trimetilsilóxi, e polimetilfenilsiloxanos;

- misturas destes.

Na lista dos óleos mencionados acima, o termo “óleo com base em hidrocarboneto” significa qualquer óleo principalmente compreendendo carbono e átomos de hidrogênio, e possivelmente, éster, éter, ácido carboxílico e/ou grupos de álcool.

A composição de acordo com a invenção pode compreender substâncias que são sólidas em temperatura ambiente (25°C), por exemplo, ácidos graxos contendo de 8 a 30 átomos de carbono, tais como ácido esteárico, ácido láurico, ácido palmítico e ácido oléico; ceras tais como lanolina, cera de abelha, cera de carnaúba ou cera de candelila, ceras de parafina, ceras microcristalinas, ceresina ou ozocerita e ceras sintéticas tais como ceras de polietileno e ceras Fischer-Tropsch.

Estas substâncias gordurosas podem ser selecionadas em uma maneira variada por uma pessoa versada na técnica de modo a preparar uma composição tendo as propriedades desejadas, por exemplo, em termos de consistência ou textura.

A composição de acordo com a invenção pode compreender água e, opcionalmente, um solvente orgânico fisiologicamente aceitável selecionado, por exemplo, de alcoóis inferiores contendo de 1 a 8 átomos de carbono e, em particular, de 1 a 6 átomos de carbono, por exemplo, etanol, isopropanol, propanol ou butanol; polietileno glicóis contendo de 6 a 80 unidades de óxido de etileno, e polióis, por exemplo, propileno glicol, isopreno glicol, butileno glicol, glicerol e sorbitol.

Vantajosamente, as composições de acordo com a invenção podem estar na forma de uma emulsão, especialmente uma emulsão de óleo em água, uma emulsão de água em óleo, um emulsão tripla W/O/W ou O/W/O, dispersões de uma fase gordurosa em uma fase aquosa com o auxílio de esférulas, estas esférulas possivelmente sendo nanopartículas poliméricas tais como nanoesferas ou nanocápsulas, ou vesículas lipídicas do tipo iônico e/ou não iônico (lipossomas, niossomas ou oleossomas). Estas composições são preparadas de acordo com os métodos usuais.

Além disso, as composições de acordo com a invenção podem ser mais ou menos fluidas e podem ter a aparência de um creme branco ou colorido, uma pomada, um leite, uma loção, um soro, uma pasta ou um

musse. Elas podem ser opcionalmente aplicadas na pele em forma de aerossol. Elas também podem estar na forma sólida, por exemplo, na forma de um bastão.

De acordo com uma forma de realização particular da invenção, a composição de acordo com a invenção é uma emulsão de água em óleo (W/O) ou óleo em água (O/W), preferivelmente uma emulsão de óleo em água. A proporção da fase oleosa da emulsão pode variar de 5% a 80% em peso e preferivelmente de 5% a 50% em peso em relação ao peso total da composição.

As emulsões geralmente contêm pelo menos um emulsificante selecionado de emulsificantes anfotéricos, aniônicos, catiônicos e não iônicos, utilizados isoladamente ou como uma mistura, e opcionalmente um co-emulsificante. Os emulsificantes são selecionados de uma maneira apropriada de acordo com a emulsão a ser obtida (W/O ou O/W). O emulsificante e o co-emulsificante estão geralmente presentes na composição em uma proporção que varia de 0,3% a 30% em peso e preferivelmente de 0,5% a 20% em peso em relação ao peso total da composição.

Para as emulsões de W/O, exemplos de emulsificantes que podem ser mencionados incluem copolióis de dimeticona tais como a mistura de copoliol de ciclometicona e dimeticona vendida sob o nome DC 5225 C pela empresa Dow Corning, e copolíis de alquil dimeticona tais como o copoliol de laurilmeticona vendido sob o nome da Dow Corning 5200 Formulation Aid pela empresa Dow Corning e o copoliol de cetil dimeticona vendido sob o nome Abil EM 90® pela empresa Goldschmidt.

Os tensoativos para emulsões de W/O que também podem ser usados incluem um organopolissiloxano sólido elastomérico reticulado compreendendo pelo menos um grupo de oxialquilenos, tal como aqueles obtidos de acordo com o procedimento dos Exemplos 3, 4 e 8 do documento US-A-5 412 004 e dos Exemplos do documento US-A-5 811 487,

especialmente o produto do Exemplo 3 (exemplo de síntese) da patente US-A-5 412 004 e tal como aquele vendido sob a referência KSG 21 pela empresa Shin-Etsu.

5 Para as emulsões de O/W, exemplos de emulsificantes que podem ser mencionados incluem emulsificantes não iônicos tais como ésteres de ácido graxo oxialquilenados (mais particularmente polioxietilenados) de glicerol; ésteres de ácido graxo oxialquilenados de sorbitano; ésteres de ácido graxo oxialquilenados (oxietilenados e/ou oxipropilenados) ; éteres de alquila graxos oxialquilenados (oxietilenados e/ou oxipropilenados), ésteres de
10 açúcar, por exemplo, estearato de sacarose, e suas misturas tais como a mistura de estearato de glicerila e de estearato de PEG 40.

De uma maneira conhecida, a composição cosmética ou dermatológica para a utilização de acordo com a invenção também pode conter adjuvantes que são comuns em produtos cosméticos ou dermatologia,
15 tais como agentes gelificantes, polímeros formadores de película, agentes conservantes, aromas, cargas, agentes filtrantes de UV, bactericidas, absorventes de odores, matérias corantes, extratos vegetais, agentes ativos cosméticos e dermatológicos, e sais. As quantidades destes vários adjuvantes são aquelas convencionalmente usadas na área de atuação sob consideração,
20 por exemplo, de 0,01% a 20% do peso total da composição. Dependendo de sua natureza, estes adjuvantes podem ser introduzidos na fase gordurosa e/ou na fase aquosa.

A composição de acordo com a invenção também pode compreender pelo menos um agente fotoprotetor orgânico e/ou agente pelo
25 menos um fotoprotetor mineral que é ativo na faixa de UVA e/ou UVB (absorventes), que pode ser solúvel em água ou lipossolúvel, ou então insolúvel nos solventes cosméticos comumente utilizados.

Preferivelmente, um sistema que filtra tanto a radiação UVA quanto a radiação UVB será utilizado.

Os filtros solares são moléculas que absorvem a radiação UV e assim evitam esta radiação de alcançar as células da pele. Eles podem absorver principalmente UVB ou principalmente UVA, dependendo da sua natureza. Existem duas categorias principais de proteção solar, orgânica ou mineral (óxido de zinco ou óxido de titânio). Mediante o seu uso nas composições cosméticas em combinação e em quantidade suficiente, eles bloqueiam grande proporção da radiação UV.

No entanto, é comumente aceito que para ser eficiente, estas formulações devem ser utilizadas sob condições de boa aplicação (quantidade suficiente, renovação freqüente, espalhamento uniforme). Os usuários nem sempre cumprem estas condições de aplicação, o que aumenta o risco de uma quantidade apreciável de radiação UV alcançar as células da pele e assim dar origem aos efeitos biológicos mencionados acima. Além disso, a fim de obter a absorção no que diz respeito a faixa de comprimento de onda inteira do espectro de UV solar de UVA + UVB, várias moléculas que absorvem nas faixas de comprimento de onda complementares necessitam ser combinadas.

Os agentes de filtração orgânicos adicionais são selecionados especialmente de antranilatos; derivados cinâmicos; derivados salicílicos; derivados de cânfora; derivados de benzofenona; derivados de β,β -difenilacrilato; derivados de triazina; derivados de benzotriazol; derivados de benzalmalonato, especialmente aqueles mencionados na patente US 5 624 663; derivados de benzimidazol; imidazolinas; derivados de bis-benzazolila como descritos nas patentes EP 0 669 323 e US 2 463 264; derivados de ácido p-aminobenzóico (PABA) ; derivados de metilenobis-(hidroxifenilbenzotriazol) como descritos nos pedidos de patente US 5 237 071, US 5 166 355, GB 2 303 549, DE 197 26 184 e EP 893 119; derivados de benzoxazol como descritos nos pedidos de patente EP 0 832 642, EP 1 027 883, EP 1 300 137 e DE 101 62 844; polímeros de filtração e siliconas de filtração tais como aqueles descritos especialmente no pedido de

patente WO 93/04665; dímeros com base em α -alquilestireno, tais como aqueles descritos no pedido de patente DE 198 55 649; 4,4-diarilbutadienos tais como aqueles descritos nos pedidos de patente EP 0 967 200, DE 197 46 654, DE 197 55 649, EP-A-1 008 586, EP 1 133 980 e EP 133 981; derivados de merocianina tais como aqueles descritos nos pedidos de patente WO 04/006 878, WO 05/058 269 e WO 06/032 741; e misturas destes.

Como exemplos de agentes fotoprotetores adicionais, menção pode ser feita daqueles indicados mais abaixo sob seu nome INCI:

10 Derivados cinâmicos:

Metoxicinamato de etilexila vendido em particular sob o nome comercial Parsol MCX by DSM Nutritional Products, Inc.,

Metoxicinamato de isopropila,

Metoxicinamato de isoamila vendido sob o nome comercial

15 Neo Heliopan E 1000 da Symrise,

Metoxicinamato DEA,

Metilcinamato de diisopropila,

Dimetoxicinamato de gliceril etilexanoato.

Derivados de ácido para-aminobenzóico:

20 PABA,

Etil PABA,

Etil diidroxipropil PABA,

Etilexil dimetil PABA vendido em particular sob o nome Escalol 507 da ISP,

25 Gliceril PABA,

PEG-25 PABA vendido sob o nome Uvinul P25 da BASF.

Derivados salicílicos:

Homossalato vendido sob o nome Eusolex HMS da Rona/EM Industries,

Salicilato de etilexila vendido sob o nome Neo Heliopan OS da Symrise,

Salicilato de dipropileno glicol vendido sob o nome Dipsal da Scher,

5 Salicilato TEA vendido sob o nome Neo Heliopan TS da Symrise.

Derivados de β,β -difenilacrilato:

Octocrileno vendido em particular sob o nome comercial Uvinul N539 da BASF,

10 Etocrileno vendido em particular sob o nome comercial Uvinul N35 da BASF.

Derivados de benzofenona:

Benzofenona-1 vendido sob o nome comercial Uvinul 400 da BASF,

15 Benzofenona-2 vendido sob o nome comercial Uvinul D50 da BASF,

Benzofenona-3 ou Oxibenzona vendido sob o nome comercial Uvinul M40 da BASF,

20 Benzofenona-4 vendido sob o nome comercial Uvinul MS40 da BASF,

Benzofenona-5,

Benzofenona-6 vendido sob o nome comercial Helisorb 11 da Norquay,

25 Benzofenona-8 vendido sob o nome comercial Spectra-Sorb UV-24 da American Cyanamid,

Benzofenona-9 vendido sob o nome comercial Uvinul DS-49 da BASF,

Benzofenona-12

n-hexil 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil) benzoato vendido

sob o nome comercial Uvinul A+ da BASF.

Derivados de benzilidenocânfora:

3-Benzilidenocânfora fabricado sob o nome Mexoryl SD da Chimex,

5 4-Metilbenzilidenocânfora vendido sob o nome Eusolex 6300 da Merck,

Ácido benzilidenocanforassulfônico fabricado sob o nome Mexoryl SL da Chimex,

10 Metossulfato de cânfora benzalcônio fabricado sob o nome Mexoryl SO da Chimex,

Ácido tereftalilidenodicanforassulfônico fabricado sob o nome Mexoryl SX da Chimex,

Poliacrilamidometilbenzilidenocânfora fabricado sob o nome Mexoryl SW da Chimex.

15 Derivados de fenilbenzimidazol:

Ácido fenilbenzimidazolssulfônico vendido em particular sob o nome comercial Eusolex 232 da Merck,

Tetrassulfonato de dissódio fenil dibenzimidazol vendido sob o nome comercial Neo Heliopan AP da Symrise.

20 Derivados de fenilbenzotriazol:

Trissiloxano de drometrizol vendido sob o nome Silatrizole da Rhodia Chimie,

25 Metilenobis(benzotriazolil) tetrametilbutilfenol vendido na forma sólida sob o nome comercial MIXXIM BB/100 da Fairmount Chemical, ou na forma micronizada como uma dispersão aquosa sob o nome comercial Tinosorb M da Ciba Specialty Chemicals.

Derivados de triazina:

Bis(etilexiloxifenol) metoxifeniltriazina vendido sob o nome comercial Tinosorb S da Ciba Geigy,

Etilexiltriazona vendido em particular sob o nome comercial Uvinul T150 da BASF,

Dietilexilbutamidotriazona vendido sob o nome comercial Uvasorb HEB da Sigma 3V,

- 5 2,4,6-tris(dineopentil 4'-aminobenzalmalonato) -s-triazina
 2,4,6-tris(diisobutil 4'-aminobenzalmalonato) -s-triazina,
 2,4-bis(n-butil 4'-aminobenzoato) -6-(aminopropiltrissiloxano)
 -s-triazina,
 2,4-bis(dineopentil 4'-aminobenzalmalonato) -6-(n-butil 4'-
 10 aminobenzoato) -s-triazina,

os agentes de filtração de triazina simétrica descritos na patente US 6 225 467, pedido de patente WO 2004/085 412 (ver os compostos 6 e 9) ou o documento Symmetrical Triazine Derivatives IP.COM Journal, IP.COM INC West Henrietta, NY, US (20 de setembro de 2004),
 15 especialmente 2,4,6-tris(bifenil) -1,3,5-triazinas (em particular 2,4,6-tris(bifenil-4-il-1,3,5-triazina) e 2,4,6-tris(terfenil) -1,3,5-triazina que também é mencionada nos pedidos de patente Beiersdorf WO 06/035 000, WO 06/034 982, WO 06/034 991, WO 06/035 007, WO 2006/034 992 e WO 2006/034 985.

20 Derivados antranílicos:

Mentil antranilato vendido sob o nome comercial Neo Heliopan MA da Haarmann & Reimer.

Derivados de imidazolina:

Propionato de etilexildimetoxibenzilidenodioxoimidazolina.

25 Derivados de benzalmalonato:

Poliorganossiloxano contendo funções de benzalmalonato, por exemplo, Polysilicone-15, vendido sob o nome comercial Parsol SLX da DSM Nutritional products, Inc.

Derivados de 4,4-diarilbutadieno:

1,1-Dicarbóxi(2,2'-dimetilpropil) -4,4-difenilbutadieno

Derivados de benzoxazol:

2,4-bis[5-(1-dimetilpropil) benzoxazol-2-il(4-fenil) imino]-6-(2-etilexil) imino-1,3,5-triazina vendido sob o nome Uvasorb K2A da Sigma

5 3V.

Derivados de merocianina:

Octil 5-N,N-dietilamino-2-fenilsulfonil-2,4-pentadienoato.
e suas misturas.

Os agentes fotoprotetores orgânicos preferidos são

10 selecionados de:

Metoxicinamato de etilexila,

Salicilato de etilexila,

Homosalato,

Octocrileno,

15 Ácido fenilbenzimidazolssulfônico,

Benzofenona-3,

Benzofenona-4,

Benzofenona-5,

n-Hexil 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil) benzoato,

20 4-Metilbenzilidenocânfora,

Ácido tereftalilidenodicanforassulfônico,

Fenildibenzimidazoltetrassulfonato de dissódio,

Metilenobis(benzotriazolil) tetrametilbutilfenol,

Bis(etilexiloxifenol) metoxifeniltriazina,

25 Etilexiltriazona,

Dietilexilbutamidotriazona,

2,4,6-Tris(dineopentil 4'-aminobenzalmalonato) -s-triazina,

2,4,6-Tris(diisobutil 4'-aminobenzalmalonato) -s-triazina,

2,4-Bis(n-butil 4'-aminobenzoato) -6-(aminopropil-

trissiloxano) -s-triazina,

2,4-Bis(dineopentil 4'-aminobenzalmalonato) -6-(n-butil 4'-aminobenzoato) -s-triazina,

2,4,6-Tris(bifenil-4-il) -1,3,5-triazina,

5 2,4,6-Tris(terfenil) -1,3,5-triazina,

Trissiloxano de drometrizol,

Polissilicona-15,

1,1-Dicarbóxi(2,2'-dimetilpropil) -4,4-difenilbutadieno,

10 2,4-Bis[5-1(dimetilpropil) benzoxazol-2-il(4-fenil) imino]-6-(2-etilexil) imino-1,3,5-triazina,

Octil 5-N,N-dietilamino-2-fenilsulfonil-2,4-pentadienoato,
e misturas destes.

Os agentes de filtração orgânicos de acordo com a invenção podem representar de 0,1% a 30% e preferivelmente de 1% a 25% do peso total da composição.

Os agentes de filtração de UV minerais adicionais usados de acordo com a presente invenção são pigmentos de óxido de metal. Mais preferivelmente, os agentes de filtração de UV minerais da invenção são pigmentos de óxido de metal com um tamanho de partícula elementar menor ou igual a 500 nm, mais preferivelmente entre 5 nm e 500 nm e ainda mais preferivelmente entre 10 nm e 100 nm, e preferivelmente entre 15 e 50 nm.

Eles podem ser selecionados especialmente de óxido de titânio, óxido de zinco, óxido de ferro, óxido de zircônio e óxido de cério, ou misturas destes, e mais particularmente óxidos de titânio.

25 Tais pigmentos de óxido de metal revestidos ou na revestidos são descritos, em particular, no pedido de patente EP-A-0 518 773. Os pigmentos comerciais que podem ser mencionados incluem os produtos vendidos pelas empresas Kemira, Tayca, Merck e Degussa.

Os pigmentos de óxido de metal podem ser revestidos ou não

revestidos.

Os pigmentos revestidos são pigmentos que passaram por um ou mais tratamentos superficiais de natureza química, eletrônica, mecanoquímica e/ou mecânica com compostos tais como aminoácidos, cera de abelha, ácidos graxos, alcoóis graxos, tensoativos aniônicos, lecitinas, sais de sódio, potássio, zinco, ferro ou alumínio de ácidos graxos, alcóxidos de metal (de titânio ou alumínio) de polietileno, siliconas, proteínas (colágeno, elastina), alcanolaminas, óxidos de silício, óxidos de metal ou hexametafosfato de sódio.

Os pigmentos revestidos são mais particularmente óxidos de titânio que foram revestidos:

- com sílica, tal como o produto Sunveil da empresa Ikeda,
- com sílica e óxido de ferro, tal como o produto Sunveil F da empresa Ikeda,

- com sílica e alumina, tal como os produtos Microtitanium Dioxide MT 500 SA e Microtitanium Dioxide MT 100 SA da empresa Tayca e Tioveil da empresa Tioxide,

- com alumina, tal como os produtos Tipaque TTO-55 (B) e Tipaque TTO-55 (A) da empresa Ishihara e UVT 14/4 da empresa Kemira,

- com alumina e estearato de alumínio, tal como o produto Microtitanium Dioxide MT 100 T, MT 100 TX, MT 100 Z e MT-01 da empresa Tayca, os produtos Solaveil CT-10 W e Solaveil CT 100 da empresa Uniqema e o produto Eusolex T-AVO da empresa Merck,

- com sílica, alumina e ácido algínico, tal como o produto MT-100 AQ da empresa Tayca,

- com alumina e laurato de alumínio, tal como o produto Microtitanium Dioxide MT 100 S da empresa Tayca,

- com óxido de ferro e estearato de ferro, tal como o produto Microtitanium Dioxide MT 100 F da empresa Tayca,

- com óxido de zinco e estearato de zinco, tal como o produto BR351 da empresa Tayca,

- com sílica e alumina e tratados com uma sílica, tal como os produtos Microtitanium Dioxide MT 600 SAS, Microtitanium Dioxide MT 500 SAS ou Microtitanium Dioxide MT 100 SAS da empresa Tayca,

- com sílica, alumina e estearato de alumínio e tratados com uma sílica, tal como o produto STT-30-DS da empresa Titan Kogyo,

- com sílica e tratados com uma sílica, tal como o produto UV-Titan X 195 da empresa Kemira,

- com alumina e tratados com uma sílica, tal como os produtos Tipaque TTO-55 (S) da empresa Ishihara ou UV Titan M 262 da empresa Kemira,

- com trietanolamina, tal como o produto STT-65-S da empresa Titan Kogyo,

- com ácido esteárico, tal como o produto Tipaque TTO-55 (C) da empresa Ishihara,

- com hexametáfosfato de sódio, tal como o produto Microtitanium Dioxide MT 150 W da empresa Tayca,

- TiO_2 tratado com octiltrimetilsilano, vendido sob o nome comercial T 805 pela empresa Degussa Silices,

- TiO_2 tratado com um polidimetilsiloxano, vendido sob o nome comercial 70250 Cardre UF TiO_2SI_3 pela empresa Cardre,

- anatase/rutilo TiO_2 tratado com um polidimetilhidrogenossiloxano, vendido sob o nome comercial Microtitanium Dioxide USP Grade Hidrofobic pela empresa Color Techniques.

Os pigmentos de óxido de titânio não revestidos são vendidos, por exemplo, pela empresa Tayca sob os nomes comerciais Microtitanium Dioxide MT 500 B ou Microtitanium Dioxide MT 600 B, pela empresa Degussa sob o nome P 25, pela empresa Wackher sob o nome Transparent

titanium oxide PW, pela empresa Miyoshi Kasei sob o nome UFTR, pela empresa Tomen sob o nome ITS e pela empresa Tioxide sob o nome Tioveil AQ.

Os pigmentos de óxido de zinco não revestidos são, por exemplo, aqueles vendidos sob o nome Z-Cote pela empresa Sunsmart.

Os pigmentos de óxido de zinco revestidos são, por exemplo:

- aqueles vendidos sob o nome Zinc Oxide CS-5 pela empresa Toshiba (ZnO revestido com polimetilidrogenossiloxano) ;

- aqueles vendidos sob o nome Daitopersion ZN-30 e Daitopersion ZN-50 pela empresa Daito (dispersões em ciclopilmetilsiloxano/polidimetilsiloxano oxietilenado, contendo 30% ou 50% de óxidos de nanozinco revestidos com sílica e polimetilidrogenossiloxano) ;

- aqueles vendidos sob o nome NFD Ultrafine ZnO pela empresa Daikin (ZnO revestido com fosfato de perfluoroalquila e copolímero baseado em perfluoroalquiletila como uma dispersão em ciclopentassiloxano) ;

- aqueles vendidos sob o nome SPD-Z1 pela empresa Shin-Etsu (ZnO revestido com polímero acrílico enxertado com sílica, dispersos em ciclodimetilsiloxano) ;

- aqueles vendidos sob o nome Escalol Z100 pela empresa ISP (ZnO tratado com alumina disperso em uma mistura copolimérica de etilexil metoxicinamato/PVP-hexadeceno/meticona) ;

- aqueles vendidos sob o nome Fuji ZnO-SMS-10 pela empresa Fuji Pigment (ZnO revestido com sílica e polimetilsilsesquioxano).

Os pigmentos de óxido de cério não revestidos são vendidos sob o nome Colloidal Cerium Oxide pela empresa Rhone-Poulenc.

Os nanopigmentos de óxido de ferro não revestidos são vendidos, por exemplo, pela empresa Mitsubishi sob o nome TI-220.

Os pigmentos de óxido de ferro revestidos são vendidos, por exemplo, pela empresa BASF sob o nome Transparent Iron Oxide.

Menção também pode ser feita das misturas de óxidos de metal, especialmente de dióxido titânio e de dióxido de cério, incluindo a
5 mistura de peso igual revestida de sílica de dióxido de titânio e de dióxido de cério, vendidas pela empresa Ikeda sob o nome Sunveil A, e também a mistura revestida de alumina, sílica e sílica de dióxido de titânio e de dióxido de zinco, tal como o produto M 261 vendido pela empresa Kemira, ou a mistura revestida de alumina, sílica e glicerol de dióxido de titânio e de
10 dióxido de zinco, tal como o produto M 211 vendido pela empresa Kemira.

De acordo com a invenção, os pigmentos de óxido de titânio revestidos ou não revestidos são particularmente preferidos.

Os agentes de filtração minerais de acordo com a invenção podem representar de 0,5% a 40% e preferivelmente de 1% a 30% do peso
15 total da composição.

De acordo com um segundo de seus aspectos, a presente invenção diz respeito às composições cosméticas e/ou dermatológicas na forma de uma emulsão de óleo em água compreendendo pelo menos um éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético e pelo menos um
20 tensoativo particular.

As composições de acordo com este segundo aspecto da invenção são em particular destinadas a cuidar e/ou repor os materiais de queratina, e especialmente a pele.

Como anteriormente indicado, os ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético possuem o aspecto particular de serem
25 sólidos em temperatura ambiente e de serem insolúveis ou moderadamente solúveis nas matérias primas líquidas comumente usadas em produtos cosméticos e/ou dermatologia.

É por isso que, a fim de explorar plenamente a sua atividade, é

geralmente necessário formular estes compostos com um solvente particular consagrado especificamente para a sua dissolução.

Além disso, as formulações na forma de emulsões de óleo em água são vantajosas em produtos cosméticos e dermatologia no sentido de que elas geralmente mostram tolerância muito boa na pele, e possuem propriedades sensoriais e/ou organolépticas que são satisfatórias para o consumidor (especialmente em termos de sensação).

Agora, os inventores descobriram que a preparação de emulsões de óleo em água com tensoativos aniônicos, por exemplo, ácidos graxos tais como ácido esteárico, dão origem à degradação química dos compostos de éster, levando a uma redução na quantidade destes compostos de éster presentes na emulsão e, portanto, a uma perda de eficácia do produto cosmético.

Por estas razões, há ainda necessidade de composições que sejam adequadas para a formulação de ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético na forma de emulsões de óleo em água mais eficientes, que não prejudiquem a estabilidade química do referido éster, e que atinja tudo isto enquanto que ao mesmo tempo mantém a boa tolerância da pele.

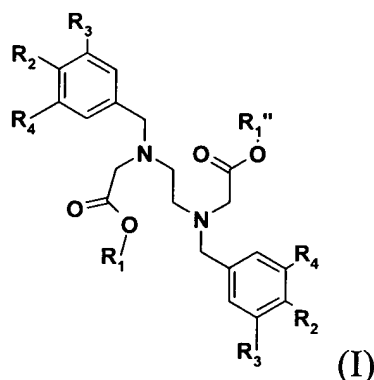
De acordo com seu segundo aspecto, o objetivo da presente invenção é, precisamente, propor uma nova formulação galênica de ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético que possa superar os inconvenientes acima mencionados e que possa manter a estabilidade química destes compostos durável ao longo do tempo.

Especificamente, os inventores descobriram, inesperadamente, que a combinação de certos ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético com certos tensoativos particulares pode ser satisfatória nestes termos, e especialmente pode manter a estabilidade química dos ditos ésteres formulados na forma de uma emulsão

de óleo em água.

No contexto deste segundo aspecto da invenção, a invenção assim se refere, de acordo com um de seus aspectos, a uma composição cosmética e/ou dermatológica na forma de uma emulsão de óleo em água compreendendo:

(a) pelo menos um composto de fórmula geral (I) :



em que:

- cada grupo R_1 e R''_1 independentemente representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 6 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 6 átomos de carbono, com a condição de que os dois grupos R_1 e R''_1 simultaneamente não representem um átomo de hidrogênio,

- R_2 , R_3 e R_4 representam, independentemente um do outro, um átomo de hidrogênio ou um radical $-OR_5$, e

- R_5 representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 5 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 5 átomos de carbono,

ou sais dos mesmos,

(b) uma quantidade eficaz de pelo menos um solvente para o dito composto de fórmula geral (I), e

(c) pelo menos um tensoativo iônico selecionado de sais de metal alcalino de ácidos (C10-C22) acilglutâmicos e sais de metal alcalino de sarcossinato de palmitoíla, e suas misturas.

O composto de fórmula geral (I) está vantajosamente presente, nas composições de acordo com este segundo aspecto da invenção, em uma forma dissolvida em virtude da presença de pelo menos um de seus solventes em uma quantidade eficaz. Sua estabilidade química é mantida pela presença de pelo menos um tensoativo iônico particular como anteriormente definido.

A combinação de uma emulsão de óleo em água, de um éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético de acordo com a invenção com um tal tensoativo iônico torna possível obter composições que são notavelmente eficazes para as aplicações anteriormente mencionadas.

As composições de acordo com este segundo aspecto da invenção podem especialmente ser destinadas para o tratamento e/ou proteção de materiais de queratina humanos, em particular a pele, contra o envelhecimento causado especialmente pela exposição à luz do sol (raios ultravioletas).

Assim, de acordo com outro de seus aspectos, a presente invenção refere-se a um processo de tratamento não terapêutico para cuidar e/ou repor os materiais de queratina, especialmente a pele, compreendendo pelo menos a etapa de aplicação nos ditos materiais de queratina, e especialmente na pele, de pelo menos uma composição como definida anteriormente.

O ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético sob consideração de acordo com este segundo aspecto da invenção são compostos de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib) como anteriormente definidos pelo primeiro aspecto da invenção.

A quantidade de ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético a ser usada em um composição de acordo com este segundo aspecto da invenção depende do efeito cosmético desejado e pode assim variar dentro de uma ampla faixa.

Uma pessoa versada na técnica pode facilmente, na base de

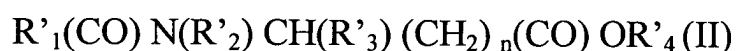
seu conhecimento geral, determinar as quantidades apropriadas.

As composições de acordo com este segundo aspecto da invenção podem compreender de 0,2% a 10% em peso, preferivelmente de 0,5% a 5% em peso e especialmente de 0,8% a 3% em peso, por exemplo, pelo menos 1% em peso, de composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib), em particular de fórmula (Ia), em relação ao peso total da dita composição.

SOLVENTE PARA O ÉSTER DE ÁCIDO N,N'-DIARILMETILENOETILENODIAMINADIACÉTICO

As composições de acordo com este segundo aspecto da invenção compreendem pelo menos um éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético de fórmula (I), (Ia) ou (Ib) em combinação com pelo menos uma quantidade eficaz de um solvente.

Os solventes adequados que podem especialmente ser mencionados incluem etanol, isoparafina hidrogenada, esqualano, palmitato de isopropil, 2-octildodecanol, salicilato de 2-etilexila, dipropileno glicol, miristato de isopropila, hexileno glicol, fenil trimeticona, óleo de damasco, isononanoato de isononila, isossorbeto de dimetila, e os ésteres de aminoácido de fórmula (II) :



em que:

- n é um número inteiro igual a 0, 1 ou 2,
- R'₁ representa um radical de alquila ou alquenila linear ou ramificado C₅ a C₂₁,
- R'₂ representa um átomo de hidrogênio ou um grupo de alquila C₁ a C₃,
- R'₃ representa um radical selecionado do grupo formado por um átomo de hidrogênio, um grupo de metila, um grupo de etila e um radical de alquila linear ou ramificado C₃ ou C₄, e
- R'₄ representa um radical de alquila linear ou ramificado C₁ a

C₁₀, um radical de alquênica linear ou ramificado C₂ a C₁₀ ou um resíduo de esterol; e

uma mistura dos mesmos.

5 É preferivelmente um solvente selecionado de isononanoato de isononila, isossorbeto de dimetila e os ésteres de aminoácido de fórmula (II) como definidos acima, e uma mistura dos mesmos.

O solvente sob consideração de acordo com este segundo aspecto da invenção pode especialmente ser um solvente como definido anteriormente com relação ao primeiro aspecto da invenção.

10 TENSOATIVO IÔNICO

As composições de acordo com este segundo aspecto da invenção também compreendem pelo menos um tensoativo iônico selecionado de sais de metal alcalino de ácidos (C₁₀-C₂₂) acilglutâmicos e sais de metal alcalino de sarcossinato de palmitoíla, e suas misturas.

15 Exemplos de sais de metal alcalino que podem ser mencionados incluem os sais de sódio, sais de potássio e sais de lítio, e preferivelmente os sais de sódio.

De acordo com uma forma de realização, as composições de acordo com este segundo aspecto da invenção compreendem pelo menos um
20 sal de metal alcalino de ácidos (C₁₀-C₂₂) acilglutâmicos e preferivelmente um sal de metal alcalino de ácidos (C₁₂-C₂₀) acilglutâmicos, por exemplo, um sal de metal alcalino de ácidos (C₁₆-C₁₈) acilglutâmicos.

Um tal sal pode ser especialmente um sal de metal alcalino de ácido estearoilglutâmico, de ácido lauroilglutâmico, de um ácido C₁₆
25 acilglutâmico, de ácido miristoilglutâmico, de ácido cocoilglutâmico ou de ácido acilglutâmico sebo hidrogenado.

Preferivelmente, um tal tensoativo será um tensoativo iônico selecionado de estearoilglutamato de sódio, estearoilglutamato de dissódio, estearoilglutamato de potássio, lauroilglutamato de sódio, lauroilglutamato de

dissódico, lauroilglutamato de potássio, cocoilglutamato de sódio e acilglutamato de sódio sebo hidrogenado, misturas destes, e preferivelmente estearoil glutamato de sódio.

5 Por meio de ilustração, um exemplo que pode ser mencionado é o estearoilglutamato de sódio vendido pela empresa Ajinomoto sob a referência Amisoft HS 11 PF®.

De acordo com outra forma de realização, as composições de acordo com este segundo aspecto da invenção compreendem pelo menos um sal de metal alcalino de sarcossinato de palmitoíla.

10 Preferivelmente será sarcossinato de sódio palmitoíla.

Por razões óbvias, a quantidade de tensoativo iônico de acordo com este segundo aspecto da invenção é susceptível de variar dentro de uma ampla faixa como uma função especialmente da natureza química e/ou da quantidade do referido éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético e da natureza do tensoativo iônico utilizado. O ajuste da quantidade de
15 tensoativo iônico de acordo com este segundo aspecto da invenção forma parte da competência de uma pessoa versada na técnica.

Por meio de ilustração, o tensoativo iônico de acordo com este segundo aspecto da invenção pode estar presente em uma quantidade de material
20 ativo variando de 0,01% a 20% em peso, mais preferivelmente de 0,1% a 10% em peso, ainda mais preferivelmente de 0,2% a 5% em peso e ainda mais particularmente de 0,25% a 2% em peso em relação ao peso total da composição.

EMULSÃO

25 As composições de acordo com este segundo aspecto da invenção estão na forma de uma emulsão de óleo em água.

Além de um tensoativo iônico de acordo com este segundo aspecto da invenção, estas emulsões podem conter pelo menos um emulsificante adicional selecionado de emulsificantes anfotéricos, aniônicos, catiônicos e não iônicos, utilizados isoladamente ou em mistura. Os

emulsificantes adicionais são obviamente selecionados de uma maneira apropriada para a obtenção de uma emulsão de óleo em água.

Como emulsificantes adicionais que podem ser usados, exemplos que podem ser mencionados incluem emulsificantes não iônicos tais como ésteres de ácido graxo de polióis oxialquilenados (mais particularmente polioxietilenados), por exemplo, estearatos polietileno glicol, por exemplo, estearato de PEG-100, estearato de PEG-50 e estearato de PEG-40, e suas misturas tais como a mistura de monoestearato de glicerila e estearato de polietileno glicol (100 EO) vendidos sob o nome Simulsol 165 pela empresa SEPPIC; ésteres de ácido graxo de sorbitano oxialquilenados compreendendo, por exemplo, de 20 a 100 EO, por exemplo, aqueles vendidos sob os nomes comerciais Tween 20 e Tween 60 pela empresa Uniqema; éteres de álcool graxo oxialquilenados (oxietilenado e/ou oxipropilenado; éteres de álcool graxo oxialquilenados (oxietilenados e/ou oxipropilenados) ; ésteres de açúcar, por exemplo, estearato de sacarose; e suas misturas, por exemplo, a mistura de estearato de glicerila e estearato de PEG-100, vendido sob o nome Arlacel 165 pela empresa Uniqema, ou a mistura de estearato de glicerila e estearato de PEG-40.

As emulsões livres de tensoativos emulsificantes adicionais ou contendo menos do que 0,5% destes em relação ao peso total da composição também podem ser preparadas, mediante o uso de compostos adequados, por exemplo, polímeros com propriedades emulsificantes tais como polímeros de ácido acrílico/metacrilato de estearila, tais como aqueles vendidos sob os nomes Carbopol 1342 e Pemulen pela empresa Noveon; ou polímeros e copolímeros de ácido 2-acrilamido-2-metilpropanossulfônico; opcionalmente reticulados e/ou neutralizados, por exemplo, o poli(ácido 2-acrilamido-2-metilpropanossulfônico) vendido pela empresa Clariant sob o nome Hostacerin AMPS (nome CTFA: poliacrildimetiltauramida de amônio) ou o polímero de acrilamida/sódio 2-acrilamidometilpropanossulfonato, tal como o

produto vendido sob o nome Sepigel 305 pela empresa SEPPIC (nome INCI: poliacrilamida/C13-C14 isoparafina/laureth-7), o copolímero (AMPS/metacrilato de álcool etoxilado C12/C14) (8 mol EO) (80/20) (Aristoflex LNC® da Clariant) ; partículas poliméricas iônicas ou não iônicas, mais particularmente partículas poliméricas aniônicas especialmente tais como os polímeros de ácido isoftálico ou ácido sulfoisoftálico, e em particular copolímeros de ftalato/sulfoisofalato/glicol (por exemplo, dietileno glycol/ftalato/isoftalato/1,4-cicloexanodimetanol (nome INCI: copolímeros de diglicol/CHDM/isoftalatos/SIP) vendido sob o nome de Eastman AQ Polymer (AQ35S, AQ38S, AQ55S ou AQ48 Ultra) pela empresa Eastman Chemical.

A composição de acordo com este segundo aspecto da invenção também pode compreender pelo menos um agente fotoprotetor orgânico e/ou pelo menos, um agente fotoprotetor mineral que é ativo na faixa UVA e/ou UVB (absorventes), que pode ser solúvel em água ou lipossolúvel, ou então insolúvel nos solventes de cosmético comumente utilizados, como definido anteriormente para o primeiro aspecto da invenção.

O segundo aspecto da invenção é mais particularmente ilustrada pelos Exemplos 7 e 8.

De acordo com um terceiro de seus aspectos, a presente invenção se refere às composições cosméticas e/ou dermatológicas, compreendendo pelo menos uma éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético e pelo menos um polímero emulsificante particular.

As composições de acordo com este terceiro aspecto da invenção são em particular destinadas a cuidar e/ou repor os materiais de queratina, e especialmente a pele.

Como anteriormente indicado, os ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético possuem o aspecto particular de serem sólidos em temperatura ambiente e de serem insolúveis ou moderadamente

solúveis nas matérias primas líquidas comumente usadas em produtos cosméticos e/ou dermatologia.

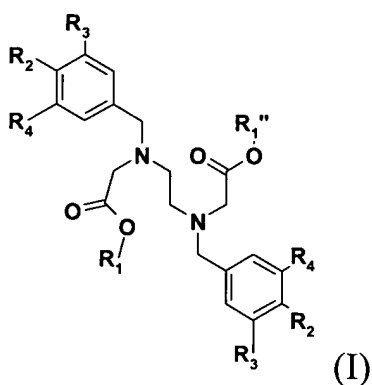
Agora, é necessário para estes compostos serem formulados em uma forma dissolvida ou dispersa de modo a completamente explorar sua atividade, e também é preferível para este estado serem mantidos durante um tempo de modo a evitar qualquer recristalização durante a armazenagem das composições compreendendo tais compostos.

De acordo com um terceiro de seus aspectos, a presente invenção é direcionada à formulação de ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminodiacético na fase oleosa de uma emulsão de óleo em água ou água em óleo em água.

Especificamente, os inventores descobriram, inesperadamente, que a combinação de certos ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminodiacético com pelo menos um polímero emulsificante particular permite que estes compostos de éster sejam introduzidos na fase oleosa deste tipo de emulsão, enquanto evita a sua recristalização, especialmente após o armazenamento durante dois meses em temperatura ambiente (25°C).

No contexto deste terceiro aspecto da invenção, a invenção diz respeito assim, de acordo com um dos seus aspectos, a uma composição cosmética e/ou dermatológica na forma de uma emulsão de óleo em água ou uma emulsão de água em óleo em água, contendo em sua fase oleosa:

(a) pelo menos um composto de fórmula geral (I) :



em que:

- cada grupo R_1 e R''_1 independentemente representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 6 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 6 átomos de carbono, com a condição de que os dois grupos R_1 e R''_1 simultaneamente não representem um átomo de hidrogênio,

- R_2 , R_3 e R_4 representam, independentemente um do outro, um átomo de hidrogênio ou um radical $-OR_5$, e

- R_5 representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 5 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 5 átomos de carbono,

ou sais dos mesmos, e

(b) uma quantidade eficaz de pelo menos um polímero anfifílico compreendendo pelo menos uma unidade de ácido acrilamido-2-metilpropanossulfônico (AMPS).

Como aparece dos Exemplos de 9 a 12 abaixo, a presença de um polímero anfifílico de acordo com este terceiro aspecto da invenção eficazmente garante a presença do composto de fórmula geral (I) na fase oleosa da emulsão.

O uso para este propósito de um tal polímero anfifílico desta maneira vantajosamente torna possível dispensar o uso de solventes de solubilização, desse modo simplificando a formulação das emulsões contendo os compostos de éster.

As composições de acordo com este terceiro aspecto da invenção são vantajosamente usadas para cuidar e/ou repor os materiais de queratina, e especialmente a pele.

A combinação de um éster de ácido N,N' -diarilmetilenoetilenodiaminadiacético de acordo com a invenção com um tal polímero anfifílico torna possível obter composições cosméticas e/ou

dermatológicas que são notavelmente eficazes para as aplicações anteriormente mencionadas.

As composições de acordo com este terceiro aspecto da invenção podem especialmente ser destinadas para o tratamento e/ou proteção de materiais de queratina humanos, em particular a pele, contra o envelhecimento causado especialmente pela exposição à luz do sol (raios ultravioletas).

Assim, de acordo com outro de seus aspectos, a presente invenção refere-se a um processo de tratamento não terapêutico para cuidar e/ou repor os materiais de queratina, especialmente a pele, compreendendo pelo menos a etapa de aplicação nos ditos materiais de queratina, e especialmente na pele, de pelo menos uma composição como definida anteriormente.

O ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminodiacético sob consideração de acordo com este terceiro aspecto da invenção são compostos de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib) como anteriormente definidos pelo primeiro aspecto da invenção.

A quantidade de ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminodiacético a ser usada em um composição de acordo com este terceiro aspecto da invenção depende do efeito cosmético desejado e pode assim variar dentro de uma ampla faixa.

Uma pessoa versada na técnica pode facilmente, na base de seu conhecimento geral, facilmente determinar as quantidades apropriadas.

As composições de acordo com este terceiro aspecto da invenção podem especialmente compreender de 0,2% a 10% em peso, preferivelmente de 0,5% a 5% em peso e especialmente de 0,8% a 3% em peso, por exemplo, pelo menos 1% em peso, de composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib), em particular de fórmula (Ia), em relação ao peso total da dita composição.

POLÍMEROS EMULSIFICANTES

Para os propósitos da invenção, os termos "polímero

emulsificante” e “polímero anfifílico” destinam-se a significar um polímero tendo propriedades anfifílicas, isto é, tendo pelo menos uma parte hidrófila e pelo menos uma parte hidrofóbica. Os grupos hidrófilos e os grupos hidrofóbicos são bem conhecidos por aqueles versados na técnica.

5 Para os propósitos da presente invenção, o termo “polímero” se destina a significar um composto compreendendo pelo menos duas unidades de repetição e, em particular, pelo menos cinco unidades de repetição.

10 Os polímeros anfifílicos sob consideração de acordo com este terceiro aspecto da invenção são polímeros anfifílicos, compreendendo pelo menos um ácido acrilamido-2-metilpropanossulfônico (unidade de AMPS).

15 Os polímeros anfifílicos compreendendo pelo menos uma unidade de ácido acrilamido-2-metilpropanossulfônico (AMPS) que podem ser usados neste terceiro aspecto da presente invenção, que são também conhecidos mais simplesmente como “polímeros anfifílicos de AMPS” mais abaixo, compreendem tanto uma parte hidrófila quanto uma parte hidrofóbica compreendendo pelo menos uma cadeia graxa.

20 Os polímeros anfifílicos de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção são especialmente selecionados de polímeros anfifílicos de pelo menos um monômero de ácido 2-acrilamidometilpropanossulfônico (AMPS monômero) e de pelo menos um comonômero etilenicamente insaturado compreendendo pelo menos uma parte hidrofóbica contendo de 7 a 30 átomos de carbono, em particular de 7 a 22 átomos de carbono ou mesmo de 12 a 22 átomos de carbono.

25 Os polímeros anfifílicos de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção geralmente possuem um peso molecular médio ponderado variando de 50.000 a 10.000.000 g/mol, em particular de 100.000 a 8.000.000 g/mol e ainda mais particularmente de 100.000 a 7.000.000 g/mol.

Eles podem ser reticulados ou não reticulados.

Quando os polímeros anfífilicos de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção forem reticulados, os agentes de reticulação podem ser selecionados dos compostos poliolefinicamente insaturados comumente utilizados para a reticulação de polímeros obtidos pela polimerização de radicais livres.

Exemplos de agentes de reticulação que podem ser mencionados incluem divinilbenzeno, éter dialílico, éter dipropileno glicol dialílico, éteres poliglicol dialílicos, éter trietileno glicol divinílico, éter hidroquinona dialílico, di(met) acrilato de etileno glicol, di(met) acrilato de tetraetileno glicol, triacrilato de trimetilolpropano, metilenobis(acrilamida), metilenobis(metacrilamida), trietilamina, cianurato de trietilila, maleato de dialila, tetraaliletilenodiamina, tetraaliloxietano, éter trimetilolpropano dialílico, (met) acrilato de alila, éteres alílicos de álcoois da série de açúcar, ou outros éteres alílicos ou vinílicos de álcoois polifuncionais, e também ésteres alílicos de ácido fosfórico e/ou vinilfosfônico, ou misturas destes compostos.

Os agentes de reticulação podem ser selecionados especialmente de metilenobis(acrilamida), metacrilato de alila e triacrilato de trimetilolpropano (TMPTA).

O grau de reticulação pode variar, por exemplo, de 0,01% molar a 10% molar e preferivelmente de 0,2% molar a 2% molar em relação ao polímero.

Os polímeros anfífilicos de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção podem ser selecionados especialmente de polímeros anfífilicos de AMPS estatísticos modificados pela reação com um C₆-C₂₂ n-monoalquilamina ou di-n-alquilamina tais como aqueles descritos no pedido de patente WO 00/31154.

Um polímero anfífilico que é adequado para uso neste terceiro aspecto da invenção pode compreender pelo menos um monômero hidrófilo

etilenicamente insaturado selecionado, por exemplo, de ácido acrílico, ácido metacrílico ou derivados de alquila substituídos destes ou ésteres destes obtidos com monoalquilenos ou polialquilenos glicóis, acrilamida, metacrilamida, vinilpirrolidona, vinilformamida, anidrido maléico, ácido itacônico ou ácido maléico, ou suas misturas.

Um polímero anfifílico de acordo com este terceiro aspecto da invenção pode compreender pelo menos um comonômero hidrofóbico etilenicamente insaturado.

Um polímero anfifílico que é adequado para usar neste terceiro aspecto da invenção pode compreender pelo menos uma parte hidrofóbica selecionada de radicais de alquila saturados ou insaturados lineares, por exemplo, n-octila, n-decila, n-hexadecila, n-dodecila e oleila, radicais de alquila ramificada, por exemplo, isoestearila, ou radicais de alquila cíclicos, por exemplo, ciclododecano ou adamantano.

Um polímero anfifílico de AMPS pode também conter pelo menos um comonômero hidrofóbico etilenicamente insaturado compreendendo, por exemplo:

- um flúor ou radical de fluoroalquila C_7-C_{18} (por exemplo, o grupo de fórmula $-(CH_2)_2-(CF_2)_9-CF_3$),
- um radical de colesterila ou um radical com base em colesterol (por exemplo, hexanoato de colesterila),
- um grupo aromático policíclico, por exemplo, naftaleno ou pireno,
- uma radical de sílica, alquilsilicona ou alquilfluorossilicona.

Estes copolímeros são especialmente descritos no documento EP-A-0 750 899, patente US-A-5 089 578 e nas seguintes publicações de Yotaro Morishima:

- "Self-assembling amphiphilic polyelectrolytes and their

nanostructures - Chinese Journal of Polymer Science Vol. 18, No. 40, (2000), 323-336”;

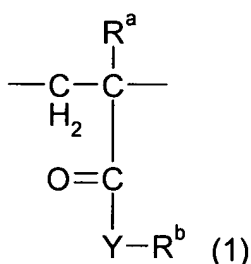
- “Micelle formation of random copolymers of sodium 2-(acrylamido) -2-methylpropanesulfonate and a nonionic surfactant macromonomer in water as studied by fluorescence and dynamic light scattering - Macromolecules 2000, Vol. 33, No. 10 - 3694-3704”;

- “Solution properties of micelle networks formed by nonionic moieties covalently bound to a polyelectrolyte: salt effects on rheological behavior - Langmuir, 2000, Vol. 16, No. 12, 5324-5332”;

- “Stimuli responsive amphiphilic copolymers of sodium 2-(acrylamido) -2-methylpropanesulfonate and associative macromonomers - Polym. Preprint, Div. Polym. Chem. 1999, 40(2), 220-221”.

Eles também são descritos nos documentos EP 1 069 142, WO 02/44224, WO 02/44225, WO 02/44227, WO 02/44229, WO 02/44230, WO 02/44231, WO 02/44267, WO 02/44268, WO 02/44269, WO 02/44270, WO 02/44271, WO 02/43677, WO 02/43686, WO 02/43687, WO 02/43688 e WO 02/43689, no nome da Clariant.

Um comonômero hidrofóbico etilenicamente insaturado da invenção pode preferivelmente ser selecionado a partir dos acrilatos ou acrilamidas de fórmula (1) abaixo:



em que:

- R^a significa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear ou ramificado $\text{C}_1\text{-C}_6$, preferivelmente metila;

- Y significa O ou NH;

- R^b significa um radical hidrofóbico compreendendo uma

cadeia graxa contendo de 7 a 30 átomos de carbono, preferivelmente de 7 a 22 e mais particularmente de 12 a 22 átomos de carbono.

O radical hidrofóbico R^b é selecionado de radicais de alquila saturados ou insaturados lineares C_7 - C_{22} (por exemplo, n-octila, n-decila, n-hexadecila, n-dodecila ou oleíla), radicais de alquila ramificados (por exemplo, isoesteárico) ou radicais de alquila cíclicos (por exemplo, ciclo-dodecano ou adamantano); radicais de alquilperfluoro C_7 - C_{18} (por exemplo, o grupo de fórmula $-(CH_2)_2-(CF_2)_9-CF_3$); o radical de colesterila ou um éster de colesterol, por exemplo, hexanoato de colesterila; grupos policíclicos aromáticos, por exemplo, naftaleno ou pireno.

Entre estes radicais, os radicais de alquila lineares e ramificados são mais particularmente preferíveis.

De acordo com uma forma preferida da invenção, o radical hidrofóbico R^b também pode compreender pelo menos uma unidade de óxido de alquilenos e preferivelmente uma cadeia de polioxialquilenos.

A cadeia de polioxialquilenos pode preferivelmente consistir de unidades de óxido de etileno e/ou unidades de óxido de propileno e ainda mais particularmente consistes unicamente de unidades de óxido de etileno.

O número de mol das unidades de oxialquilenos pode de uma forma geral variar de 1 a 30 mol, mais preferivelmente de 1 a 25 mol e ainda mais preferivelmente de 3 a 20 mol.

Entre estes polímeros que podem ser mencionados são:

- copolímeros reticulados ou não reticulados, neutralizados ou não neutralizados compreendendo de 15% a 60% em peso de unidades de AMPS e de 40% a 85% em peso de unidades de $(C_8$ - $C_{16})$ alquil (met) acrilamida ou de $(C_8$ - $C_{16})$ alquil (met) acrilato em relação ao polímero, tais como aqueles descritos no pedido de patente EP-A-0 750 899;

- terpolímeros compreendendo de 10% molar a 90% de unidades de acrilamida, de 0,1% molar a 10% molar de unidades de AMPS e

de 5% molar a 80% molar de unidades de n-(C₆-C₁₈) alquilacrilamida em relação ao polímero, tais como aqueles descritos na patente US-A-5 089 578;

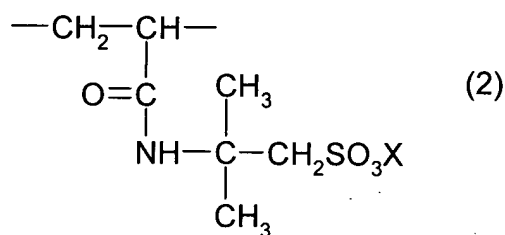
- copolímeros parcial ou totalmente neutralizados não reticulados de AMPS e de metacrilato de n-dodecila, n-hexadecila ou n-octadecila, tais como aqueles descritos nos artigos de Morishima mencionados acima;

- copolímeros não reticulados e reticulados de AMPS parcial ou totalmente neutralizados e de n-dodecilmecrilamida, tais como aqueles descritos nos artigos de Morishima mencionados acima.

Os polímeros anfífilicos de AMPS que também podem ser mencionados incluem copolímeros de AMPS totalmente neutralizado e de metacrilato de n-dodecila, n-hexadecila e/ou n-octadecila, e também copolímeros não reticulados e reticulados de AMPS e de n-dodecilmecrilamida.

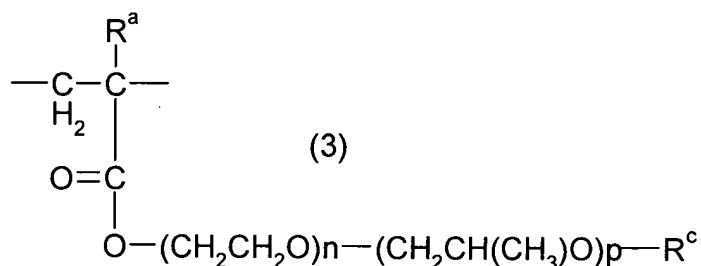
Menção será feita mais particularmente dos copolímeros anfífilicos de AMPS reticulados ou não reticulados consistindo de:

(a) unidades de ácido 2-acrilamido-2-metilpropanossulfônico (AMPS) de fórmula (2) abaixo:



em que X é um próton, um cátion de metal alcalino, um cátion de metal terroso alcalino ou um íon de amônio;

(b) e unidades de fórmula (3) abaixo:



em que n e p , independentemente um do outro, significam vários moles e variam de 0 a 30, preferivelmente de 1 a 25 e mais preferivelmente de 3 a 20, com a condição de que $n + p$ é menor do que ou igual a 30, preferivelmente menor do que 25 e melhor ainda menor do que 20;

- 5 R^a significa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear ou ramificado C_1-C_6 , preferivelmente metila, e R^c significa uma alquila linear ou ramificada contendo de 7 a 22 e preferivelmente de 12 a 22 átomos de carbono.

10 Na fórmula (2), o cátion X mais particularmente significa sódio ou amônio.

Entre os monômeros de fórmula (3) que podem ser mencionados são:

- 15 - ésteres de ácido (met) acrílico e de um $C_{10}-C_{18}$ álcool graxo polioxietilenado com 8 EO, por exemplo, o produto Genapol C-080[®] vendido pela empresa Clariant,

- ésteres de ácido (met) acrílico e de um C_{11} álcool oxo graxo polioxietilenado com 8 EO, por exemplo, o produto Genapol UD-080[®] vendido pela empresa Clariant,

- 20 - ésteres de ácido (met) acrílico e de um $C_{12}-C_{14}$ álcool graxo polioxietilenado com 7 EO, por exemplo, o produto Genapol LA-070[®] vendido pela empresa Clariant,

- ésteres de ácido (met) acrílico e de um $C_{12}-C_{14}$ o álcool graxo polioxietilenado com 11 EO, por exemplo, o produto Genapol LA-110[®] vendido pela empresa Clariant,

- 25 - ésteres de ácido (met) acrílico e de um $C_{16}-C_{18}$ álcool graxo polioxietilenado com 8 EO, por exemplo, o produto Genapol T-080[®] vendido pela empresa Clariant,

- ésteres de ácido (met) acrílico e de um $C_{16}-C_{18}$ álcool graxo polioxietilenado com 15 EO, por exemplo, o produto Genapol T-150[®]

vendido pela empresa Clariant,

- ésteres de ácido (met) acrílico e de um C_{16} - C_{18} álcool graxo polioxietilenado com 11 EO, por exemplo, o produto Genapol T-110[®] vendido pela empresa Clariant,

5 - ésteres de ácido (met) acrílico e de um C_{16} - C_{18} álcool graxo polioxietilenado com 20 EO, por exemplo, o produto Genapol T-200[®] vendido pela empresa Clariant,

- ésteres de ácido (met) acrílico e de um C_{16} - C_{18} álcool graxo polioxietilenado com 25 EO, por exemplo, o produto Genapol T-250[®] vendido pela empresa Clariant,

10 - ésteres de ácido (met) acrílico e de um C_{18} - C_{22} álcool graxo polioxietilenado com 25 EO e/ou de um C_{16} - C_{18} isoálcool polioxietilenado com 25 EO.

Os produtos que serão selecionados mais particularmente são:

15 (i) produtos não reticulados para os quais $p = 0$, $n = 7$ ou 25, R^a significa metila e R^c representa um mistura de alquila C_{12} - C_{14} ou C_{16} - C_{18} ,

(ii) produtos reticulados para os quais $p = 0$, $n = 8$ ou 25, R^a significa metila e R^c representa uma mistura de alquila C_{16} - C_{18} .

20 Estes polímeros são descritos e sintetizados no pedido de patente EP 1 069 142.

Estes polímeros anfifílicos particulares de AMPS podem ser obtidos de acordo com os processos padrão de polimerização de radical livre na presença de um ou mais iniciadores, por exemplo, azobisisobutironitrila (AIBN), azobisdimetilvaleronitrila, cloridreto de 2,2-azobis(2-amidinopropano) (ABAH), peróxidos orgânicos tais como peróxido de dilaúril, peróxido de benzoíla, hidroperóxido de terc-butila, etc., compostos de peróxido minerais tais como persulfato de potássio ou amônio, ou H_2O_2 opcionalmente na presença de agentes redutores.

Estes polímeros anfifílicos de AMPS podem ser obtidos

especialmente para a polimerização de radical livre em meio terc-butanol, em que eles se precipitam. Mediante o uso de polimerização por precipitação em terc-butanol, é possível obter uma distribuição de tamanho das partículas poliméricas que é particularmente favorável para seus usos.

5 A reação pode ser realizada em uma temperatura entre 0 e 150°C e, preferivelmente entre 10 e 100°C, na pressão atmosférica ou sob pressão reduzida.

Também pode ser executada sob atmosfera inerte e preferivelmente sob nitrogênio.

10 Os polímeros anfífilos de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção podem preferivelmente ser parcial ou totalmente neutralizados com uma base de mineral tal como o hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, amônia aquosa ou uma base orgânica tal como monoetanolamina, dietanolamina, trietanolamina, um aminometilpropanodiol,
15 N-metilglucamina, aminoácidos básicos, por exemplo, arginina e lisina, e misturas destes compostos. Eles podem especialmente ser total ou quase totalmente neutralizados, isto é, pelo menos 80% neutralizado.

A concentração percentual molar das unidades de fórmula (2) e das unidades de fórmula (3) nos polímeros anfífilos de AMPS de acordo
20 com este terceiro aspecto da invenção pode variar em função da aplicação cosmética desejada, da natureza da emulsão (emulsão de óleo em água ou água em óleo) e das propriedades reológicas da formulação desejada. Ela pode, por exemplo, variar entre 0,1 e 99,9% molar.

A distribuição dos monômeros nos polímeros anfífilos de
25 AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção pode ser, por exemplo, alternada, de bloco (incluindo múltiplos blocos) ou aleatória.

Como um guia, e sem que isto seja limitativo, menção pode ser feita especialmente do copolímero de AMPS e de metacrilato de álcool etoxilado C₁₂-C₁₄ (copolímero não reticulado obtido da Genapol LA-070 e de

AMPS) (nome CTFA: acriloidimetiltaurato de amônio/copolímero de metacrilato laureth-7) vendido sob o nome Aristoflex LNC pela empresa Clariant, o copolímero de AMPS e de metacrilato de estearila etoxilado (25 EO) (copolímero reticulado com triacrilato trimetilolpropano, obtido da

5 Genapol T-250 e de AMPS) (nome CTFA: Acriloidimetiltaurato de Amônio/Polímero Cruzado de Metacrilato Estearith-25) vendido sob o nome Aristoflex HMS pela empresa Clariant, Aristoflex SNC (80/20 copolímero de AMPS/etoxilado (mol 8 EO) metacrilato de álcool C₁₆-C₁₈; nome CTFA: acriloidimetiltaurato de amônio/copolímero de metacrilato eteareth-8) e

10 Aristoflex HMB (copolímero de AMPS/ metacrilato de beenila etoxilado (25 OE), reticulado com triacrilato de trimetilolpropano (TMPTA)).

No contexto deste terceiro aspecto da presente invenção o termo “quantidade eficaz de polímero anfifílico de AMPS” de acordo com a invenção significa uma quantidade suficiente deste polímero para formar o

15 éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético da fórmula (I), (Ia) ou (Ib) na fase oleosa da emulsão em uma forma duradoura e assim evitar qualquer recristalização, especialmente durante o armazenamento.

Por razões óbvias, a quantidade de polímero anfifílico de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção, que é suficiente para

20 formular o éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético na fase oleosa da emulsão é susceptível de variar dentro de uma ampla faixa como uma função especialmente da natureza química e/ou da quantidade do referido éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético a ser formulado e da estrutura do polímero utilizado. O ajuste da quantidade de polímero

25 anfifílico de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção forma parte da competência de uma pessoa versada a técnica.

Como uma ilustração, o polímero anfifílico de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção pode estar presente em uma quantidade de material ativo variando de 0,05% a 10% em peso, mais

preferivelmente de 0,1% a 5% em peso e ainda mais particularmente de 0,5% a 3% em peso em relação ao peso total da composição.

De acordo com uma forma de realização, o polímero anfifílico de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção e o composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib) podem estar presentes em uma relação de massa [polímero anfifílico de AMPS/composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib)] variando de 0,1 a 3 e especialmente de 0,5 a 2, por exemplo, 0,5 a 1,5, ou mesmo igual a 1.

De acordo com uma forma de realização, o polímero anfifílico de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção e o composto de fórmula geral (Ia) podem estar presentes em uma relação de massa [polímero anfifílico de AMPS/composto de fórmula geral (Ia)] variando de 0,1 a 3 e especialmente de 0,5 a 2, por exemplo, de 0,5 a 1,5, ou mesmo igual a 1.

MEIO FISIOLÓGICAMENTE ACEITÁVEL

As composições usadas de acordo com este terceiro aspecto da invenção contêm um meio fisiologicamente aceitável, isto é, um meio que é compatível com os tecidos cutâneos tais como a pele e o couro cabeludo.

Este meio fisiologicamente aceitável compreende pelo menos uma fase oleosa e pelo menos uma fase aquosa.

Como óleos que podem ser usados na fase oleosa da composição do terceiro aspecto da invenção, exemplos que podem ser mencionados incluem:

- óleos com base em hidrocarboneto de origem animal, tais como peridrosqualeno;

- óleos com base em hidrocarboneto de origem vegetal, tais como triglicerídeos líquidos de ácidos graxos contendo de 4 a 10 átomos de carbono, por exemplo, triglicerídeos de ácido heptanóico ou octanóico, ou alternativamente, por exemplo, óleo de girassol, óleo de milho, óleo de soja, óleo de polpa, óleo de semente de uva, óleo de semente de gergelim, óleo de

avelã, óleo de damasco, óleo de macadâmia, óleo de arara, óleo de mamona, óleo de abacate, triglicerídeos de ácido caprílico/cáprico, por exemplo, aqueles vendidos pela companhia Stearinerias Dubois ou aqueles vendidos sob os nomes Miglyol 810, 812 e 818 pela companhia Dynamit Nobel, óleo de jojoba e óleo de manteiga de karité;

- ésteres e éteres sintéticos, especialmente de ácidos graxos, por exemplo, os óleos de fórmulas R_1COOR_2 e R_1OR_2 em que R_1 representa um resíduo de ácido graxo contendo de 8 a 29 átomos de carbono e R_2 representa uma cadeia com base em hidrocarboneto ramificada ou não ramificada contendo de 3 a 30 átomos de carbono, por exemplo, óleo Purcellin, miristato de isopropila, palmitato de 2-etilexila, estearato de 2-octildodecila, erucato de 2-octildodecila ou isoestearato de isoestearila; ésteres hidroxilados, por exemplo, lactato de isoestearila, hidroxiestearato de octila, hidroxiestearato de octildodecila, malato de diisoestearila ou citrato de triisocetila; heptanoatos, octanoatos ou decanoatos de alcoóis graxos; ésteres de poliol, por exemplo, dioctanoato de propileno glicol, dieptanoato de neopentil glicol e diisononanoato de dietileno glicol; e ésteres de pentaeritritol, por exemplo, tetraisoestearato de pentaeritritila;

- hidrocarbonetos lineares ou ramificados, de origem mineral ou sintética, tais como parafinas líquidas voláteis ou não voláteis, e derivados destes, vaselina, polidecenos, e poliisobuteno hidrogenado tal como óleo Parleam;

- alcoóis graxos contendo de 8 a 26 átomos de carbono, por exemplo, álcool cetílico, álcool estearílico e uma mistura dos mesmos (álcool cetilestearílico), octildodecanol, 2-butiloctanol, 2-hexildecanol, 2-undecilpentadecanol, álcool oleílico ou álcool linoleílico;

- óleos de silicona, por exemplo, polimetilsiloxanos voláteis ou não voláteis (PDMS) com uma cadeia de silicona linear ou cíclica, que são líquidos ou pastosos em temperatura ambiente, especialmente

ciclopolidimetilsiloxanos (ciclometiconas) tais como cicloexassiloxano; polidimetilsiloxanos compreendendo grupos de alquila, alcóxi ou fenila, que são pendentos ou no final de uma cadeia de silicona, estes grupos contendo de 2 a 24 átomos de carbono; fenilsiliconas, por exemplo, fenil trimeticonas, fenil dimeticonas, feniltrimetilsiloxidifenilsiloxanos, difenil dimeticonas, difenilmetildifeniltrissiloxanos ou silicatos de 2-feniletil trimetilsilóxi, e polimetilfenilsiloxanos;

- misturas destes.

Na lista dos óleos mencionados acima, o termo “óleo com base em hidrocarboneto” significa qualquer óleo principalmente compreendendo carbono e átomos de hidrogênio, e possivelmente, éster, éter, ácido carboxílico e/ou grupos de álcool.

A fase oleosa da composição de acordo com este terceiro aspecto da invenção pode também compreender substâncias que são sólidas em temperatura ambiente (25°C), por exemplo, ácidos graxos contendo de 8 a 30 átomos de carbono, tais como ácido esteárico, ácido láurico, ácido palmítico e ácido oléico; ceras tais como lanolina, cera de abelha, cera de carnaúba ou cera de candelila, ceras de parafina, ceras microcristalinas, ceresina ou ozocerita e ceras sintéticas tais como ceras de polietileno e ceras Fischer-Tropsch.

Estas substâncias gordurosas podem ser selecionadas de uma maneira variada por uma pessoa versada na técnica de modo a preparar uma composição tendo as propriedades desejadas, por exemplo, em termos de consistência ou textura.

A composição de acordo com este terceiro aspecto da invenção pode compreender pelo menos uma fase aquosa, que pode compreender água e opcionalmente um solvente orgânico fisiologicamente aceitável selecionado, por exemplo, de alcoóis inferiores contendo de 1 a 8 átomos de carbono e, em particular, de 1 a 6 átomos de carbono, por exemplo, etanol, isopropanol,

propanol ou butanol; polietileno glicóis contendo de 6 a 80 unidades de óxido de etileno, e polióis, por exemplo, propileno glicol, isopreno glicol, butileno glicol, glicerol e sorbitol.

5 Como indicado anteriormente, as composições de acordo com este terceiro aspecto da invenção estão na forma de uma emulsão de óleo em água (O/W) ou uma emulsão tripla de água em óleo em água W/O/W. Estas composições são preparadas de acordo com os métodos usuais.

10 Além disso, as composições de acordo com este terceiro aspecto da invenção podem ser mais ou menos fluidas e podem ter a aparência de um creme branco ou colorido, uma pomada, um leite, uma loção, um soro, uma pasta ou um musse. Elas podem ser opcionalmente aplicadas na pele em forma de aerossol. Elas também podem estar na forma sólida, por exemplo, na forma de um bastão.

15 De acordo com uma forma de realização particular da invenção, a composição de acordo com este terceiro aspecto da invenção é uma emulsão de óleo em água (O/W).

A proporção da fase oleosa da emulsão pode variar de 5% a 80% em peso e preferivelmente de 5% a 50% em peso em relação ao peso total da emulsão.

20 Além do polímero anfifílico de AMPS de acordo com este terceiro aspecto da invenção, as emulsões podem conter pelo menos um outro emulsificante (emulsificante adicional) selecionado de emulsificantes anfotéricos, aniônicos, catiônicos e não iônicos, utilizados isoladamente ou como uma mistura. Os emulsificantes são selecionados de uma maneira
25 apropriada de acordo com a emulsão a ser obtida (W/O/W ou O/W). O emulsificante adicional está geralmente presente na composição em uma proporção que varia de 0,3% a 30% em peso e preferivelmente de 0,5% a 20% em peso em relação ao peso total da composição.

Para as emulsões de W/O/W, exemplos de emulsificantes que

podem ser mencionados incluem copolímeros de dimeticona tais como a mistura de copoliol de ciclometicona e dimeticona, vendida sob o nome DC 5225 C pela empresa Dow Corning, e copolímeros de alquil dimeticona tais como o copoliol de lauril meticona vendido sob o nome da Dow Corning 5200 Formulation Aid pela empresa Dow Corning e o copoliol de cetil dimeticona vendido sob o nome Abil EM 90® pela empresa Goldschmidt. Um organopolissiloxano sólido elastomérico reticulado compreendendo pelo menos um grupo de oxialquilenos, tal como aqueles obtidos de acordo com o procedimento dos Exemplos 3, 4 e 8 do documento US-A-5 412 004 e dos Exemplos do documento US-A-5 811 487, especialmente o produto do Exemplo 3 (exemplo sintético) da patente US-A-5 412 004, tal como o produto vendido sob a referência KSG 21 pela empresa Shin-Etsu, também pode ser usado como tensoativos para as emulsões de W/O/W.

Para as emulsões de O/W, exemplos de emulsificantes que podem ser mencionados incluem emulsificantes não iônicos tais como ésteres de ácido graxo de glicerol oxialquilenados (mais particularmente polioxietilenados) ; ésteres de ácido graxo oxialquilenados de sorbitano; ésteres de ácido graxo oxialquilenados (oxietilenados e/ou oxipropilenados) ; éteres de alquila graxos oxialquilenados (oxietilenados e/ou oxipropilenados), ésteres de açúcar tais como estearato de sacarose; e suas misturas, tais como a mistura de estearato de glicerila e de estearato de PEG 40.

De uma maneira conhecida, a composição cosmética ou dermatológica deste terceiro aspecto da invenção também pode conter adjuvantes que são comuns em produtos cosméticos ou dermatologia, tais como agentes gelificantes, polímeros formadores de película, agentes conservantes, aromas, cargas, agentes filtrantes de UV, bactericidas, absorventes de odores, matérias corantes, extratos vegetais, agentes ativos cosméticos e dermatológicos, e sais destes. As quantidades destes vários adjuvantes são aquelas convencionalmente usadas na área de atuação sob

consideração, por exemplo, de 0,01% a 20% do peso total da composição. Dependendo de sua natureza, estes adjuvantes podem ser introduzidos na fase gordurosa e/ou na fase aquosa.

A composição de acordo com este terceiro aspecto da invenção também pode compreender pelo menos um agente fotoprotetor orgânico e/ou agente pelo menos um fotoprotetor mineral que é ativo na faixa de UVA e/ou UVB (absorventes), que pode ser solúvel em água ou lipossolúvel, ou então insolúvel nos solventes cosméticos comumente utilizados, como definido anteriormente para o primeiro aspecto da invenção.

Este terceiro aspecto da invenção é mais particularmente ilustrado pelos Exemplos de 9 a 12.

De acordo com um quarto de seus aspectos, a presente invenção diz respeito às composições cosméticas e/ou dermatológicas na forma de uma emulsão de óleo em água que está na forma de oleosomas e que compreende pelo menos um éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético e pelo menos um sistema tensoativo particular.

As composições de acordo com este quarto aspecto da invenção são em particular destinadas a cuidar e/ou repor os materiais de queratina, e especialmente a pele.

Como anteriormente indicado, os ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético possuem o aspecto particular de serem sólidos em temperatura ambiente e de serem insolúveis ou moderadamente solúveis nas matérias primas líquidas comumente usadas em produtos cosméticos e/ou dermatologia.

É por isso que, a fim de explorar plenamente a sua atividade, é geralmente necessário formular estes compostos com um solvente particular consagrado especificamente para a sua dissolução.

Além disso, as formulações na forma de emulsões de óleo em

água são vantajosas em produtos cosméticos e dermatologia visto que elas geralmente possuem tolerância muito boa na pele, e propriedades sensoriais e/ou organolépticas que são satisfatórias para o consumidor (especialmente em termos de sensação).

5 Agora, os inventores descobriram que a produção de emulsões de óleo em água com tensoativos aniônicos, por exemplo, ácidos graxos tais como ácido esteárico, dão origem à degradação química dos compostos de éster, levando a uma redução na quantidade destes compostos de éster presentes na emulsão e, portanto, a uma perda de eficácia do produto
10 cosmético.

 Por estas razões, existe ainda uma necessidade de composições que sejam adequadas para a formulação de ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético na forma de emulsões de óleo em água mais eficientes, que não requerem a presença adicional de solventes particular
15 para o dito éster e que não prejudiquem a estabilidade química do referido éster.

 De acordo com um quarto de seu aspecto, o objetivo da presente invenção é, precisamente, propor uma nova formulação galênica de ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético que possa superar
20 os inconvenientes acima mencionados e que possa especialmente manter a estabilidade química destes compostos durável ao longo do tempo.

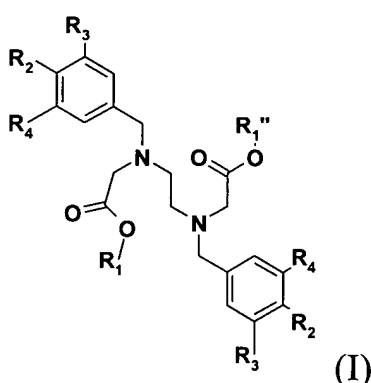
 Especificamente, os inventores descobriram, inesperadamente, que a combinação de uma emulsão de óleo em água de certos ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético com um sistema tensoativo
25 particular pode ser satisfatória nestes termos.

 Uma tal formulação pode especialmente manter a estabilidade química do dito éster presente na emulsão de óleo em água.

 Também torna possível dispensar o uso de solventes particulares para estes compostos.

No contexto deste quarto aspecto da invenção, a invenção assim se refere, de acordo com um de seus aspectos, a uma composição cosmética e/ou dermatológica na forma de uma emulsão de óleo em água formada de glóbulos oleosos com um diâmetro médio de menos do que 0,8 micrômetros e dispersos em uma fase aquosa, caracterizada pelo fato de que

- compreende pelo menos um composto de fórmula geral (I) :



em que:

- cada grupo R_1 e R''_1 independentemente representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 6 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 6 átomos de carbono, com a condição de que os dois grupos R_1 e R''_1 simultaneamente não representem um átomo de hidrogênio,

- R_2 , R_3 e R_4 representam, independentemente um do outro, um átomo de hidrogênio ou um radical $-OR_5$, e

- R_5 representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 5 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 5 átomos de carbono,

- ou sais dos mesmos, e

- é individualmente revestido com uma camada de cristal líquido monolamelar ou multilamelar obtida de pelo menos um tensoativo não iônico lipofílico, de pelo menos um tensoativo não iônico hidrófilo e de pelo menos um tensoativo iônico selecionado de sais de metal alcalino de ácidos

(C10-C22) acilglutâmicos, sais de metal alcalino de sais de cetil fosfato e de metal alcalino de sarcossinato de palmitoíla, e misturas destes.

5 A estabilidade química do composto (I) é preservada especialmente em virtude da presença de pelo menos um tensoativo iônico particular como anteriormente definido.

10 A combinação, em uma emulsão de óleo em água na forma de oleosomes, de um éster de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético de acordo com a invenção com um tal sistema tensoativo torna possível obter composições cosméticas e/ou dermatológicas que são notavelmente eficazes para as aplicações anteriormente mencionadas. O éster assim formulado não recristaliza durante um tempo e a emulsão desta maneira permanece uniforme.

15 As composições de acordo com este quarto aspecto da invenção podem ser especialmente destinadas para o tratamento e/ou proteção de materiais de queratina humanos, em particular a pele, contra o envelhecimento causado especialmente pela exposição à luz do sol (raios ultravioletas).

20 Assim, de acordo com outro de seus aspectos, a presente invenção refere-se a um processo de tratamento não terapêutico para cuidar e/ou repor os materiais de queratina, especialmente a pele, compreendendo pelo menos a etapa de aplicação nos ditos materiais de queratina, e especialmente na pele, de pelo menos uma composição como definida anteriormente.

25 O ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético sob consideração de acordo com este quarto aspecto da invenção são compostos de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib) como anteriormente definidos pelo primeiro aspecto da invenção.

A quantidade de ésteres de ácido N,N'-diarilmetilenoetilenodiaminadiacético a ser usada em um composição de

acordo com este quarto aspecto da invenção depende do efeito cosmético desejado e pode assim variar dentro de uma ampla faixa.

Uma pessoa versada na técnica pode, na base de seu conhecimento geral, facilmente determinar as quantidades apropriadas.

5 As composições de acordo com este quarto aspecto da invenção podem compreender de 0,2% a 10% em peso, preferivelmente de 0,5% a 5% em peso e especialmente de 0,8% a 3% em peso, por exemplo, pelo menos 1% em peso, de composto de fórmula geral (I), (Ia) ou (Ib), em particular de fórmula (Ia), em relação ao peso total da dita composição.

10 EMULSÃO DE ÓLEO EM ÁGUA NA FORMA DE OLEOSOMES

As composições de acordo com este quarto aspecto da invenção estão na forma de oleosomes.

Os oleosomes consistem de uma emulsão de óleo em água formada por glóbulos oleosos providos com um revestimento de cristal líquido lamelar disperso em uma fase aquosa.

No contexto deste quarto aspecto da presente invenção, é mais particularmente uma emulsão do tipo óleo em água formada de glóbulos oleosos, cada um provido com um revestimento de cristal líquido lamelar e disperso em uma fase aquosa, caracterizado pelo fato de que cada glóbulo oleoso é individualmente revestido com uma camada monolamelar ou multilamelar obtida de pelo menos um tensoativo não iônico lipofílico, de pelo menos um tensoativo não iônico hidrófilo e de pelo menos um tensoativo iônico como anteriormente definido, os glóbulos oleosos revestidos tendo um diâmetro médio de menos do que 0,8 micrômetro.

25 O tamanho médio dos glóbulos oleosos revestidos é menor do que 0,8 micrômetro e preferivelmente 0,6 micrômetro, e especialmente maior do que 0,150 micrômetro.

O tamanho médio dos glóbulos oleosos revestidos pode ser expresso como um tamanho médio numérico medido especialmente usando

um granulômetro do tipo Brookhaven BI90Plus®, cujo princípio de medição é baseado na dispersão de luz quasi-elástica (QELS).

Como indicado anteriormente, o sistema tensoativo compreende pelo menos um tensoativo iônico selecionado de sais de metal alcalino de ácidos (C10-C22) acilglutâmicos, sais de metal alcalino de fosfato cetílico e sais de metal alcalino de sarcossinato de palmitoíla, e misturas destes.

Exemplos de sais de metal alcalino que podem ser mencionados incluem os sais de sódio, os sais de potássio e os sais de lítio, e preferivelmente os sais de sódio.

De acordo com uma forma de realização, as composições de acordo com este quarto aspecto da invenção compreendem pelo menos um sal de metal alcalino de ácidos (C10-C22) acilglutâmicos e preferivelmente um sal de metal alcalino de ácidos (C12-C20) acilglutâmicos, por exemplo, um sal de metal alcalino de ácidos (C16-C18) acilglutâmicos.

Um tal um sal pode ser especialmente um dos sais de metal alcalino de ácido estearoilglutâmico, de ácido lauroilglutâmico, de um ácido C16 acilglutâmico, de ácido miristoilglutâmico, de ácido cocoilglutâmico ou de ácido acilglutâmico sebo hidrogenado.

Um tal tensoativo preferivelmente será um tensoativo iônico selecionado de estearoilglutamato de sódio, estearoilglutamato de dissódio, estearoilglutamato de potássio, lauroilglutamato de sódio, lauroilglutamato de dissódio, lauroilglutamato de potássio, cocoilglutamato de sódio e acilglutamato de sódio sebo hidrogenado, e misturas destes, e preferivelmente estearoilglutamato de sódio.

Como uma ilustração, um exemplo que pode ser mencionado é o estearoilglutamato de sódio vendido pela empresa Ajinomoto sob a referência Amisoft HS 11 PF®.

De acordo com outra forma de realização, as composições de

acordo com este quarto aspecto da invenção compreendem pelo menos um sal de metal alcalino de fosfato cetílico.

Preferivelmente será cetil fosfato de potássio.

5 Como uma ilustração, um exemplo que pode ser mencionado é o cetil fosfato de potássio vendido pela empresa DSM Nutritional Products, sob a referência Amphisol K®.

De acordo com uma outra forma de realização, as composições de acordo com este quarto aspecto da invenção compreendem pelo menos um sal de metal alcalino de sarcossinato de palmitoíla.

10 Preferivelmente será palmitoil sarcossinato de sódio.

Por razões óbvias, a quantidade de tensoativo iônico de acordo com este quarto aspecto da invenção é susceptível de variar dentro de uma ampla faixa como uma função especialmente da natureza do tensoativo iônico utilizado. O ajuste da quantidade de tensoativo iônico de acordo com este
15 quarto aspecto da invenção forma parte da competência de uma pessoa versada na técnica.

Como uma ilustração, o tensoativo iônico de acordo com este quarto aspecto da invenção pode estar presente em uma quantidade de material ativo variando de 0,1% a 20% em peso, mais preferivelmente de
20 0,15% a 10% em peso, ainda mais preferivelmente de 0,2% a 5% em peso e ainda mais particularmente de 0,25% a 2% em peso em relação ao peso total da composição.

De acordo com uma forma de realização preferencial deste quarto aspecto da invenção, o tensoativo não iônico lipofílico e o tensoativo
25 não iônico hidrófilo cada um compreende pelo menos uma cadeia graxa saturada contendo de 12 a 22 átomos de carbono aproximadamente. Ainda mais preferivelmente, esta cadeia graxa contém de 16 a 22 átomos de carbono.

De acordo com uma outra forma de realização preferencial

deste quarto aspecto da invenção, o tensoativo não iônico lipofílico possui um HLB entre 2 e cerca de 5. Como é sabido, o termo “HLB (equilíbrio Hidrófilo-Lipofílico)” significa o equilíbrio entre o tamanho e a força do grupo hidrófilo e o tamanho e a força do grupo lipofílico do tensoativo.

5 Exemplos de tais tensoativos lipofílicos não iônicos são diestearato de sacarose, diestearato de diglicerila, triestearato de sacarose, triestearato de tetraglicerila, decaestearato de decaglicerila, monoestearato de diglicerila, triestearato de hexaglicerila, pentaestearato de decaglicerila, monoestearato de sorbitano, triestearato de sorbitano, monoestearato de
10 dietileno glicol, o éster de glicerol de ácidos palmítico e esteárico, o monoestearato polioxietilenado com 2 EO (compreendendo 2 unidades de oxietileno), mono e dibeenato de glicerila, e tetraestearato de pentaeritritila.

 De acordo com outra forma de realização preferencial deste quarto aspecto da invenção, o tensoativo não iônico hidrófilo preferivelmente
15 possui um HLB entre cerca de 8 e cerca de 12.

 Exemplos de tais tensoativos não iônicos hidrófilos que podem ser mencionados incluem os seguintes compostos: monoestearato de sorbitano polioxietilenado com 4 EO, triestearato de sorbitano polioxietilenado com 20
20 EO, o monoestearato polioxietilenado com 8 EO, monoestearato de hexaglicerila, o monoestearato polioxietilenado com 10 EO, o diestearato polioxietilenado com 12 EO, e diestearato de metilglicose polioxietilenado com 20 EO.

 O revestimento de acordo com este quarto aspecto da invenção dos glóbulos oleosos preferivelmente requer o uso de uma quantidade total de
25 tensoativo não iônico hidrófilo, de tensoativo não iônico lipofílico e de tensoativo iônico de acordo com a invenção entre cerca de 2% e cerca de 6% em peso em relação ao peso total da composição. Ainda mais preferivelmente, esta quantidade está entre 3% e 4%. As quantidades relativas de tensoativo lipofílico, hidrófilo e iônico de acordo com a invenção preferivelmente

variam dentro das respectivas faixas que seguem: 35 a 55% / 25 a 40% / 15 a 35% em peso em relação ao seu peso total.

5 A fase graxa, isto é, as gotículas oleosas revestidas, preferivelmente representam de 5% a 50% em peso em relação ao peso total da composição. Ainda mais preferivelmente, este percentual está entre 10% e 40%. Preferivelmente, a relação de peso de óleo/água é menor ou igual a 1.

A relação de peso dos glóbulos oleosos para os elementos constituintes do revestimento é preferivelmente de 2 a 13; ainda mais preferivelmente, esta relação é de 6 a 8 e é especialmente igual a cerca de 7.

10 De acordo com uma forma de realização, a emulsão possui um pH variando de 5,5 a 7,5.

Estas composições também podem compreender pelo menos um agente ativo lipofílico cosmético ou dermatológico adicional de.

15 Para os propósitos deste quarto aspecto da presente invenção, o termo “composto ativo lipofílico” significa o composto ativo per se quando ele próprio for um óleo, ou, se não for, o composto ativo dissolvido em um óleo. Os óleos que podem ser utilizados são os óleos que servem convencionalmente como suporte em composições cosméticas, por exemplo, triglicerídeos de ácido graxo de cadeia curta, óleos de silicona, etc.

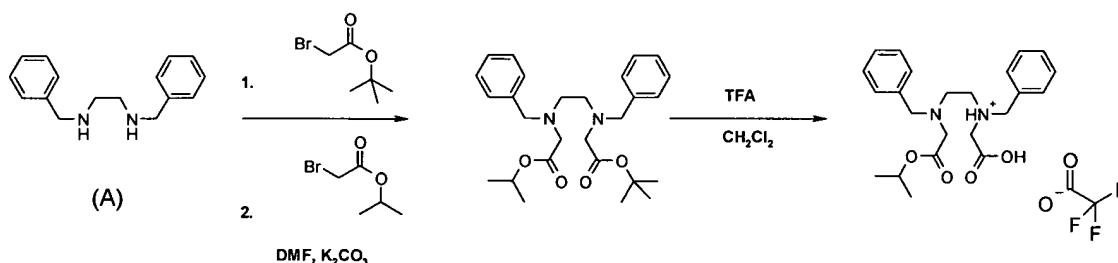
20 Tais composições podem ser obtidas, por exemplo, de acordo com o processo de preparação descrito no pedido de patente EP 0 705 593.

25 A composição de acordo com este quarto aspecto da invenção também pode compreender pelo menos um agente fotoprotetor orgânico e/ou pelo menos um agente fotoprotetor mineral que é ativo na faixa de UVA e/ou UVB (absorventes), que pode ser solúvel em água ou lipossolúvel, ou então insolúvel nos solventes cosméticos comumente utilizados como definidos anteriormente para o primeiro aspecto da invenção.

Este quarto aspecto da invenção é mais particularmente ilustrado pelos Exemplos 13 e 14.

Os exemplos abaixo são fornecidos como ilustrações da invenção e não devem ser interpretados como limitativos do seu escopo.

Exemplo 1: Preparação do sal de ácido trifluoroacético do monoéster isopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético



5 Benzatina (A) (36,19 g; 150 mmol) em 300 ml de dimetilformamida e carbonato de potássio (20,81 g; 150 mmol) foram colocados em um reator de 2 litros equipado com um agitador mecânico. O meio de reação foi mantido em 0°C, e bromoacetato de terc-butila (27,26 g; 150 mmol) pré-diluído em 500 ml de dimetilformamida foi depois adicionado por gotejamento durante 5 horas. A mistura foi agitada durante 30 minutos, depois bromoacetato de isopropila (29,37 g; 150 mmol) foi adicionado em uma única porção. O meio de reação foi aquecido para a temperatura ambiente e agitado durante 17 horas. Após filtração, o filtrado obtido a partir da reação foi concentrado. O produto obtido foi absorvido em 150 ml de diclorometano. Os sais formados foram extraídos por filtração e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida.

20 Este intermediário foi dissolvido em 50 ml de diclorometano, e uma solução a 75% de ácido trifluoroacético em diclorometano foi adicionada. Após 6 horas, quando todo o diéster misturado desapareceu (monitoramento de massa), o meio de reação foi concentrado sob pressão reduzida e co-evaporado duas vezes com tolueno.

25 Este produto bruto foi purificado em uma sinterizador com sílica, usando um sistema eluente de diclorometano/metanol. A porcentagem de metanol variou de 0% a 8%. No primeiro estágio, as frações mais puras foram despejadas e secadas. Um óleo marrom pegajoso foi obtido, o qual foi

absorvido em heptano durante a noite, e o sólido obtido foi depois extraído por filtração. Este sólido foi recristalizado a partir de uma quantidade mínima de água: uma primeira fração (cultura 1) de 3,1 g de um pó branco foram obtidos.

5 Em um segundo estágio, as outras frações foram despejadas. Um óleo amarelo alaranjado foi obtido, o qual foi recristalizado a partir de éter isopropílico e alguns mililitros de heptano. O precipitado foi extraído por filtração para obter um pó branco, que foi lavado com água. Uma segunda fração (cultura 2) de 3 g de um pó branco foi obtida. O rendimento total é 10 10%. O produto é obtido na forma do sal de ácido trifluoroacético (mono-sal).

Análise Elementar:

Calculada: C: 58,6%; H: 6,1%; N: 5,5%; O: 18,7%; F: 11,1%

Medida (cultura 1) : C: 58,32%; H: 6,10%; N: 5,39%; F: 10,94%

15 *Medida (cultura 2) :* C: 58,42%; H: 6,12%; N: 5,45%; F: 11,09%

Exemplo 2: Teste de solubilidade

Os testes de solubilidade foram executados com o éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético.

20 O solvente de teste foi despejado em uma proveta, uma quantidade do composto de éster foi adicionada com agitação magnética e a mistura foi deixada repousar entre 1 hora e 24 horas. A mistura foi depois aquecida para 50°C e depois esfriada para a temperatura ambiente (25°C) durante 24 horas. O sistema foi então observado para ver se a quantidade de 25 composto de éster introduzido apresenta recristalizado ou permaneceu dissolvido.

A quantidade de composto de éster que pode ser dissolvido no solvente de teste foi determinada desta maneira. O valor máximo corresponde à quantidade e acima da qual o composto de éster para de dissolver no

solvente avaliado.

Os seguintes resultados em vários solventes avaliados foram obtidos:

Solvente	% em peso de composto de éster dissolvido
Água	Insolúvel
Glicerol	1
Propileno glicol	1
Butileno glicol	1
Ciclopentassiloxano	4,5
Cicloexassiloxano	4,7
Etanol	8
Isoparafina hidrogenada (Parleam da NOF)	9
Esqualano	9
Palmitato de isopropila	9
2-Octildodecanol	10
2-Etilexil salicilato	10
Dipropileno glicol	10,7
Miristato de isopropila	11,5
Hexileno glicol	11,5
Fenil trimeticona (Dow Corning 556)	12
Óleo de damasco	12
Isononanoato de isononila	16
Isopropil N-lauroilsarcosinato (Eldew SL-205® da Ajinomoto)	18
Isossorbeto de dimetila	38

5 Foi desta maneira observado que este composto foi melhor dissolvido em isononanoato de isononila, isopropil N-lauroilsarcosinato e isossorbeto de dimetila.

Exemplo 3: Creme de tratamento facial

Composição α:

Fase A:

10

Glicerol 5 g

Agentes conservantes (mistura de parabenos – Phenonip da Clariant) 1 g

Água qs 100 g

Fase B1:

15

Triestearato de sorbitano (Span 65 V da Croda) 0,9 g

Mistura de mono glicerila/diestearato (36/64) /estearato de

potássio

(Tegin Pellets da Goldschmidt) 3 g

Estearato de polietileno glicol (40 EO) 2 g

Álcool cetílico 4 g

5 Álcool estearílico 1,20 g

Fase B2:

Dibutylpentaeritritil tetraidroxicinamato

(Tinogard TT da Ciba) 0,20 g

Poliisobuteno hidrogenado (Parleam da NOF) 5 g

10 Ciclopentassiloxano 10 g

N-lauroilsarcosinato de isopropila 5 g

Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-
N,N'-diacético 1 g

15 A Fase B1 foi aquecida para 75°C e a fase B2 foi aquecida para 50°C. A Fase B2 foi despejada na fase B1. A Fase A foi aquecida para 65°C. A fase (B1 + B2) foi despejada na fase A com agitação e emulsificada em 65°C. A emulsão obtida é um creme ceroso que, quando aplicado na face, pode proteger a pele contra o estresse oxidativo causado por raios ultravioletas.

20 Uma composição comparativa (composição β), similar à composição α , mas não contendo qualquer N-lauroilsarcosinato de isopropila (substituído com 5 g de água), também foi preparada e acordo com este mesmo protocolo.

25 Após a armazenagem das composições α e β durante 2 meses em 4°C, na temperatura ambiente e em 45°C, elas foram observadas por microscópio usando um microscópio ótico do tipo Leica DMLB equipado com uma câmera Sony CCD-IRIS, em uma ampliação de $\times 10$ e com luz polarizada.

Foi observado que a composição α de acordo com a invenção é

homogênea, enquanto a composição β contém cristais devido à fraca dissolução do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético.

5 Assim, a presença de N-lauroilsarcosinato de isopropila permite boa dissolução, mantida durante um tempo, do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético.

Exemplo 4: Creme de tratamento facial

Fase A:

Propileno glicol 3 g

10 Agentes conservantes (mistura de parabeno – Nipastat da Clariant) 0,3 g

2-Fenoxietanol 0,7 g

Água 63,7 g

Fase B1:

15 Triestearato de sorbitan (Span 65 V da Croda) 0,9 g

Mistura de mono glicerila/diestearato (36/64) /estearato de potássio

(Tegin Pellets da Goldschmidt) 3 g

Estearato de polietileno glicol(40 EO) 2 g

20 Álcool cetílico 4 g

Ácido esteárico 1,20 g

Poliisobuteno hidrogenado (Parleam da NOF) 5 g

Fase B2:

Ciclopentassiloxano 10 g

25 Fase B3:

Tetraidroxicinamato de dibutilpentaeritritila

(Tinogard TT da Ciba) 0,20 g

Isossorbeto de dimetila 5 g

Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-

N,N'-diacético 1 g

A Fase B1 foi aquecida para 75°C e a fase B2 foi aquecida para 50°C junto da fase B3. A Fase B2 foi despejada na fase B1, e a B3 foi depois adicionada. A Fase A foi aquecida para 65°C. A fase (B1 + B2) foi
 5 despejada na fase A com agitação e emulsificada em 65°C. A emulsão obtida é um creme ceroso que, quando aplicado na face, pode proteger a pele contra o estresse oxidativo causado pelos raios ultravioletas.

Após armazenagem durante 2 meses (4°C, temperatura ambiente e 45°C), nenhuma recristalização do éster diisopropílico de ácido
 10 N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético nesta composição foi observada.

Exemplo 5: Creme de tratamento facial

Fase A:

Polímero de ácido acrílico reticulado (Carbopol 931 da
 15 Noveon) 0,3 g

Trietanolamina 0,3 g

Agentes conservantes (mistura de parabeno – Nipastat da
 Clariant) 0,3 g

Água 67,9 g

Fase B1:

Mistura de estearato de gliceril e estearato PEG-100

(Arlacel® 165 FL da Uniqema) 2,5 g

Estearato de polietileno glicol (50 EO) 2,5 g

Álcool estearílico 1 g

25 Álcool cetílico 1 g

Poliisobuteno hidrogenado (Parleam da NOF) 5 g

Fase B2:

Ciclopentassiloxano 12 g

Fase B3:

Tetraidroxicinamato de dibutilpentaeritritila

(Tinogard TT da Ciba) 0,20 g

Isononanoato de isononila 6 g

Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-

5 N,N'-diacético 1 g

A composição foi preparada da mesma maneira como para a composição do Exemplo 2.

Após 2 meses de armazenagem (4°C, temperatura ambiente e 45°C), nenhuma recristalização do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético nesta composição foi observada.

Quando aplicada na face, a composição protege a pele contra o estresse oxidativo causado pelos raios ultravioletas.

Exemplo 6:

Uma composição anti-sol contendo os seguintes ingredientes é

15 preparada:

Propileno glicol 6 g

Glicerol 6 g

Sal de pentassódio de ácido etilenodiaminatetraacético 0,1 g

Água qs 100 g

20 2-Etilexil 2-ciano-3,3-difenilacrilato qqq 10 g

4-terc-Butil-4'-metoxidibenzoilmetano em 33% com água 2,5 g

Trissiloxano de drometrizol (Silatrizole da Rhodia) 4 g

Etilexil triazona (Uvinul T150 da BASF) 2 g

N-lauroilsarcosinato de isopropila 5 g

25 Dibutilpentaeritritil tetraidroxicinamato

(Tinogard TT da Ciba) 0,20 g

Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético 1 g

Mistura de tocoferóis em óleo de soja (50/50)

	(COVI - OX T 50 C da Cognis)	0,2 g
	Mistura de dimeticona copoliol, ciclopentassiloxano e água (10/88/2)	
	(DC 5225C da Dow Corning)	1 g
	Mistura de polidimetilsiloxano α,ω -diidroxilado/ciclopentadimetil-	
5	siloxano (14,7/85,3) (Dow Corning 1501 FL da Dow Corning)	2 g
	Éter gliceril 2-etilexílico	0,5 g
	Dióxido de titânio (15 nm) tratado com estearato de alumínio/ alumina (MT-100 T V da Tayca)	1 g
	Copolímero de ácido acrílico/estearil metacrilato polimerizado	
10	em uma mistura de acetato de etila/cicloexano	
	(Pemulen TR-1 Polymer da Noveon)	0,4 g
	Cicloexassiloxano	3 g
	Trietanolamina	0,4 g
	Etanol	6 g
15	<u>Exemplo 7 (comparativo)</u>	

As seguintes emulsões de óleo em água foram preparadas:

	α (controle)	β
- Estearato de glicerila	3	3
- Estearato de polietileno glicol (40 OE)	2	2
- Triestearato de sorbitano (Span 65 V da Croda)	0,90	0,90
- Álcool cetílico	4	4
- Estearoilglutamato de sódio (Amisoft HS 11 PF da Ajinomoto)	0	1,2
- Ácido esteárico	1,2	0
- Poliisobuteno hidrogenado (Parleam da NOF)	5	5
- N-lauroilsarcosinato de isopropila	5	5
- Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético	1	1
- Dibutilpentaeritritil tetraidroxicinamato (Tinogard TT da Ciba)	0,2	0,2
- Ciclopentassiloxano	10	10
- Propileno glicol	3	3
- Mistura de p-hidroxibenzoatos de metila, butila, etila, propila e isobutila (7/57/22/14)	0,3	0,3
- Trietanolamina	0,3	0
- Água	qs 100	qs 100

O teor do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil)

etilenodiamina-N,N'-diacético após a armazenagem durante 2 meses foi depois medido, em 4°C, na temperatura ambiente e em 45°C.

O teor de composto de diéster é medido pela cromatografia líquida de alto desempenho de fase reversa usando um Waters/X-Trerra RP18 (5 µm) – 150 nm de coluna, usando, como eluente, um gradiente 60/40 e 95/5 de acetonitrila/tampão de acetato de sódio 0,02 M.

As condições cromatográficas são como se segue:

vazão: 1 ml/ml

volume injetado: 20 µl

detecção: 210 nm

tempo de retenção: ao redor de 6,7 minutos

As duas soluções de calibração usadas são as seguintes: 12 µg/ml e 120 µg/ml do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético em acetonitrila.

Preparação da amostra a ser medida (solução de teste) :

Uma massa m da composição armazenada é dispersa em um volume V de acetonitrila de modo a obter uma concentração de composto de diéster que está dentro da faixa de calibração.

A curva de calibração é traçada em gráfico, colocando a área superficial obtida sobre os cromatogramas das soluções de calibração sobre o eixo y, e as concentrações do composto de diéster nas soluções de calibração sobre o eixo x.

A concentração na composição armazenada é deduzida da curva de calibração mediante o uso da seguinte fórmula: $C = (S - A) / B$,

- C sendo a concentração do composto de diéster na solução de teste (em mg/ml)

- S sendo a área superficial do valor máximo para o composto de diéster no cromatograma de teste

- A sendo o valor do eixo y na origem da curva de calibração

para o composto de diéster, e

- B sendo a inclinação da curva de calibração para o composto de diéster.

O teor T (em%) de composto de diéster na solução armazenada é determinado pela seguinte fórmula: $T = 100 \times (C \times V) / m$,

- C sendo a concentração de composto de diéster na solução de teste (em mg/ml),

- V sendo o volume final após a dispersão da amostra (em ml),

e

- m sendo a quantidade de amostra da composição armazenada.

Os resultados são como se segue:

Teor após 2 meses de armazenagem	α (controle)	β
em 4°C	1,0%	1,0%
em 45°C	0,8%	0,9%

O uso de um tensoativo iônico de acordo com este segundo aspecto da invenção do tipo estearoilglutamato de sódio torna possível manter, em temperatura elevada, a estabilidade química do éster de diisopropila de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético em uma emulsão de óleo em água.

Exemplo 8:

Uma composição anti-sol na forma de uma emulsão de óleo em água contendo os seguintes ingredientes é preparada:

- Trietanolamina	0,88 g
- Sal de dissódio de ácido etilenodiaminatetraacético	0,1 g
- Dibutilpentaeritritil tetraidroxicinamato (Tinogard TT da Ciba)	0,20 g
- N-lauroilsarcossinato de isopropila	8 g
- Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético	1 g

	- Álcool estearílico	1 g
	- Agentes conservantes (mistura de parabenos e fenoxietanol – Phenonip da Clariant)	1 g
5	- Agentes conservantes (mistura de parabeno Nipastat da Clariant)	0,25 g
	- 2-Etilexil salicilato	5 g
	- 4-terc-Butil-4'-metoxidibenzoilmetano em 33% com água	3 g
	- ácido tereftalilidenodicanforassulfônico	5 g
	- 2-Etilexil 2-ciano-3,3-difenilacrilato	7 g
10	- Drometrisol trissiloxano (Silatrizole da Rhodia)	1,5 g
	- Acrilamida/acrilamido-2-metilpropanossulfonato de sódio como uma emulsão inversa a 40% em isoexadecano/água (Simulgel 600 da SEPPIC)	2 g
	- Partículas de estireno/copolímero de acrilato (Sunspheres Powder da Rohm & Haas)	2 g
15	- Ciclopentassiloxano	3 g
	- Glicerol	5 g
	- Mistura de estearato de glicerila e estearato PEG-100 (Arlacel® 165 FL da Uniqema)	2 g
20	- Estearoilglutamato de sódio (Amisoft HS 11 PF da Ajinomoto)	1,3 g
	- Água qs	100 g

Exemplo 9: Emulsão de óleo em água (O/W) estabilizada com um polímero anfifílico de AMPS de acordo com o terceiro aspecto da invenção.

Fase A:

25	- Glicerol	5%
	- copolímero (AMPS/metacrilato de álcool C ₁₂ /C ₁₄ etoxilado) (8 mol EO) (80/20) (Aristoflex LNC® da Clariant)	1%
	- Trietanolamina	0,0060%
	- Agentes conservantes	1%

- Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil)
etilenodiamina-N-N'-diacético 1%
- Água qs 100,00

Fase B:

- 5 - Dibutylpentaeritritil tetraidroxicinamato (Tinogard TT da Ciba) 0,20%
- Isoparafina hidrogenada (Parleam da NOF Corporation) 7%
- Ciclopentassiloxano 8%
- Monoisoestearato de glicerila 0,50%

10 A Fase A é levada a 60°C e agitada usando um desfloculador em 450 rpm durante 1 hora. A Fase B é levada a 60°C para que os constituintes sólidos fossem dissolvidos. A Fase B é depois despejada na fase A em cerca de 60°C.

15 A emulsão obtida é um suco leitoso umectante, cuja aplicação na face protege a pele contra o estresse oxidativo causado pelos raios ultravioletas.

20 Após a armazenagem desta composição durante 2 meses em 4°C, na temperatura ambiente e em 45°C, uma observação por microscópio foi executada usando um microscópio ótico do tipo Leica DMLB equipado com uma câmera Sony CCD-IRIS, em uma ampliação de $\times 10$ e com luz polarizada.

Nenhuma recristalização do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético nesta composição foi observada.

25 Assim, a presença de uma quantidade eficaz de um polímero de AMPS de acordo com o terceiro aspecto da invenção permite boa introdução, mantida durante um time, do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético na fase oleosa da emulsão.

Exemplo 10 (comparativo) : Emulsão de óleo em água (O/W) estabilizada com um polímero emulsificante do tipo acrilatos/polímero reticulado de

acrilato de alquila C₁₀-C₃₀.

Fase A:

	- Glicerol	5%
	- Acrilatos/ polímero reticulado de acrilato de alquila C ₁₀ -C ₃₀	
5	(Carbopol [®] Ultrez 20 Polymer da Noveon)	1%
	- Trietanolamina	0,98%
	- Agentes conservantes	1%
	- Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético	1%
10	- Água qs	100,00

Fase B:

	- Dibutilpentaeritritil tetraidroxicinamato (Tinogard TT da Ciba)	0,20%
	- Isoparafina hidrogenada (Parleam da NOF Corporation)	7%
	- Ciclopentassiloxano	8%
15	- Monoisoeleostearato de glicerila	0,50%

Esta composição foi obtida por seguir o mesmo protocolo experimental como aquele indicado para o Exemplo 9.

Após apenas 24 horas, a recristalização do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético é observada.

20 Exemplo 11 (comparativa) : Emulsão de óleo em água (O/W) estabilizada com um polímero emulsificante do tipo celulose modificada hidrofóbica.

Fase A:

	- Glicerol	5%
25	- Cetilhidroxietilcelulose (Natrosol [®] Plus CS 330 da Hercules)	1%
	- Agentes conservantes	1%
	- Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético	1%
	- Água qs	100,00

Fase B:

	- Dibutilpentaeritritil tetraidroxicinamato (Tinogard TT da Ciba)	0,20%
	- Isoparafina hidrogenada (Parleam da NOF Corporation)	7%
	- Ciclopentassiloxano	8%
5	- Monoisoestearato de glicerila	0,50%

Esta composição foi obtida por seguir o mesmo protocolo experimental como aquele indicado para o Exemplo 9.

Após apenas 24 horas, a recristalização do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético é observada.

10 Exemplo 12: Emulsão de óleo em água (O/W) estabilizada com um polímero anfifílico de AMPS de acordo com o terceiro aspecto da invenção

Fase A:

	- Glicerol	5%
	- Copolímero (AMPS/metacrilato de álcool C12/C14 etoxilado	
15	(8 mol EO) (80/20) (Aristoflex LNC® da Clariant)	1%
	- Trietanolamina	0,006%
	- Agentes conservantes	1%
	- Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético	1%
20	- Água qs	100,00

Fase B:

	- Dibutilpentaeritritil tetraidroxicinamato (Tinogard TT da Ciba)	0,20%
	- 2-Etilexil ciano-3,3-difenilacrilato	3%
	- Poliisobuteno hidrogenado (Parleam da NOF Corporation)	7%
25	- Ciclopentassiloxano	8%
	- Monoisoestearato de glicerila	0,50%

Esta composição foi obtida por seguir o mesmo protocolo experimental como aquele indicado para o Exemplo 9.

Nenhuma recristalização do éster diisopropílico de ácido N-

N'bis(benzil) etilenodiamina-N-N'-diacético nesta composição é observada.

Quando aplicada na face, a composição pode proteger a pele contra os raios UV.

Exemplo 13: Emulsão de óleo em água (O/W) na forma de oleosomes

5 Um creme de tratamento facial tendo a seguinte composição α foi preparado:

Fase A:

	- Monoestearato de sorbitano polioxietilenado (4 EO) (Tween 61 V da Croda)	1,76 g
10	- Triestearato de açúcar (Ryoto Sugar Ester S 370 da Mitsubishi Kagaku Foods)	2,64 g
	- Álcool estearílico	1,21 g
	- Colesterol	0,05 g
	- Estearato de isoestearila	5 g
15	- Poliisobuteno hidrogenado (Parleam da NOF)	7 g
	- Ciclopentassiloxano	3 g
	- Estearilglutamato de sódio (Amisoft HS 11 PF da Ajinomoto)	0,25 g
	- Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina- N,N'-diacético	1 g
20	- Dibutilpentaeritritil tetraidroxicinamato (Tinogard TT da Ciba)	0,20 g
	- Tocoferol	0,20 g

Fase B:

	- Sal de dissódio de ácido etilenodiaminatetraacético	0,1 g
	- 2-Fenoxietanol	0,50 g
25	- Butil parabeno	0,10 g
	- Metil parabeno	0,25 g
	- Clorfenesina	0,25 g
	- Água qs	100 g

Fase C:

- Água	13 g
- Polímero de carboxivinila (Synthalen K da 3V)	0,40 g

Fase D:

5 - Trietanolamina	0,40%
-----------------------	-------

A Fase A foi aquecida até que todas as substâncias gordurosas estivessem completamente fundidas (ao redor de 85°C).

A Fase B foi aquecida entre 80°C e 85°C. A Fase B foi adicionada à fase A com agitação muito rigorosa. A emulsão foi depois submetida à homogeneização de alta pressão. As Fases C e D foram finalmente adicionadas.

A emulsão obtida na forma de oleosomes tinha um pH igual a 6,10.

Uma composição similar β foi preparada mediante a substituição do estearoilglutamato de sódio com cetil fosfato de potássio (Amphisol K® da DSM Nutritional Produtos) (0,25 g) e uma outra composição γ (controle) foi preparada mediante a substituição do estearoilglutamato de sódio com ácido esteárico (1,32 g; com redução correspondente da quantidade de água).

O teor de éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) - etilenodiamina-N,N'-diacético após 2 meses de armazenagem em 4°C e em 45°C foi depois medido.

O teor de composto de diéster é medido pela cromatografia líquida de alto desempenho de fase reversa usando um Waters/X-Terra RP18 (5 μ m) – 150 nm de coluna, usando, como eluente, um gradiente 60/40 e 95/5 de acetonitrila/tampão de acetato de sódio 0,02 M.

As condições cromatográficas são como se segue:

vazão: 1 ml/ml

volume injetado: 20 μ l

detecção: 210 nm

tempo de retenção: ao redor de 6,7 minutos

As duas soluções de calibração usadas são as seguintes: 12 µg/ml e 120 µg/ml do éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético em acetonitrila.

Preparação da amostra a ser medida (solução de teste) :

Uma massa m da composição armazenada é dispersa em um volume V de acetonitrila de modo a obter uma concentração de composto de diéster que está dentro da faixa de calibração.

10 A curva de calibração é traçada em gráfico, colocando a área superficial obtida sobre os cromatogramas das soluções de calibração sobre o eixo y, e as concentrações do composto de diéster nas soluções de calibração sobre o eixo x.

15 A concentração na composição armazenada é deduzida da curva de calibração mediante o uso da seguinte fórmula: $C = (S - A) / B$,

- C sendo a concentração do composto de diéster na solução de teste (em mg/ml)

- S sendo a área superficial do valor máximo para o composto de diéster no cromatograma de teste

20 - A sendo o valor do eixo y na origem da curva de calibração para o composto de diéster, e

- B sendo a inclinação da curva de calibração para o composto de diéster.

25 O teor T (em%) de composto de diéster na solução armazenada é determinado pela seguinte fórmula: $T = 100 \times (C \times V) / m$,

- C sendo a concentração de composto de diéster na solução de teste (em mg/ml),

- V sendo o volume final após a dispersão da amostra (em ml),

e

- m sendo a quantidade de amostra da composição armazenada.

Os resultados são como se segue:

Teor após 2 meses de armazenagem	α	β	γ (controle)
em 4°C	1,0%	1,0%	1,0%
em 45°C	1,0%	1,0%	0,8%

É observado que o uso especialmente de um tensoativo iônico de acordo com o quarto aspecto da invenção do tipo estearoilglutamato de sódio ou cetil fosfato de potássio torna possível manter, em temperatura elevada, a estabilidade química do éster de diisopropila de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético em uma emulsão de óleo em água que está na forma de olessomos.

10 Exemplo 14: Emulsão de óleo em água (O/W) na forma de oleosomes

Um creme de tratamento facial tendo a seguinte composição é preparado:

Fase A:

- Água	39,25 g
15 - Metil parabeno	0,25 g
- Glicerol	5 g
- 2-Fenoxietanol	0,7 g
- Sal de dissódio de ácido etilenodiaminatetraacético	0,2 g
- 1,2-Octanodiol	0,4 g

Fase B:

- Monoestearato de sorbitano polioxietilenado (4 EO) (Tween 61 V da Croda)	1 g
- Triestearato de sacarose (Ryoto Sugar Ester S 370 da Mitsubishi Kagaku Foods)	2 g
25 - Estearoilglutamato de sódio (Amisoft HS 11 PF da Ajinomoto)	0,75 g
- Butil parabeno	0,15 g

- Cicloexassiloxano 1,7 g
- Diisopropil sebacato 2,7 g
- Isononanoato de isononila 5,6 g
- Éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil)

- 5 etilenodiamina-N,N'-diacético 1 g
- 2-Etilexil ciano-3,3-difenilacrilato 7 g
- 4-terc-Butil-4'-metoxidibenzoilmetano 3 g
- 2-Etilexil salicilato 5 g

Fase C:

- 10 - Águas 100 g
- Polímero de carboxivinila (Synthalen K da 3V) 0,30 g
- Trietanolamina 0,3 g

Fase D:

- Água 6 g
- 15 - Goma xantana 0,2 g

Fase E:

- Amido de milho esterificado com anidrido octenilsuccínico,
sal de alumínio (Dry Flo Plus da National Starch) 3 g

Fase F:

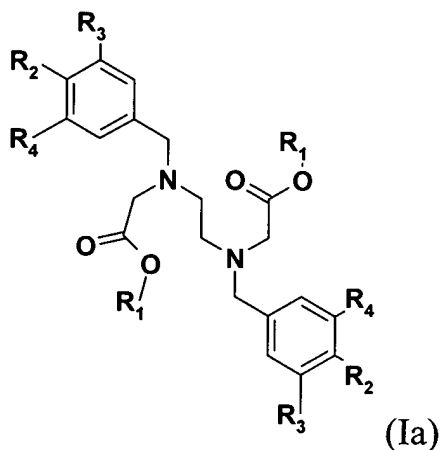
- 20 - Dimeticona PEG-12 (Silsoft® 880 da General Electric) 0,5 g

A Fase A é aquecida para cerca de 60 a 65°C e a fase B para cerca de 80°C. A Fase A é despejada na fase B muito rapidamente enquanto se mistura (inversão de fase) e enquanto mantém em 60 a 65°C, e a mistura é emulsificada durante 15 minutos. Em temperatura ambiente, as fases C, D, E e F são sucessivamente adicionadas.

REIVINDICAÇÕES

1. Composição cosmética e/ou dermatológica, caracterizada pelo fato de que compreende, em um meio fisiologicamente aceitável contendo pelo menos um óleo:

5 (a) pelo menos um composto de fórmula geral (Ia) :



em que:

- R₁ representa um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 6 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 6 átomos de carbono,

10 - R₂, R₃ e R₄ representam, independentemente um do outro, um átomo de hidrogênio ou um radical -OR₅, e

- R₅ representa um átomo de hidrogênio ou um radical de alquila linear saturado contendo de 1 a 5 átomos de carbono ou um radical de alquila ramificado saturado contendo de 3 a 5 átomos de carbono,

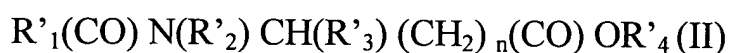
15 ou saís dos mesmos, e

(b) uma quantidade eficaz de pelo menos um solvente selecionado de:

(i) isononanoato de isononila;

(ii) isossorbeto de dimetila;

20 (iii) ésteres de aminoácido de fórmula (II) :



em que:

- n é um número inteiro igual a 0, 1 ou 2,

- R'₁ representa um radical de alquila ou alquenila linear ou ramificado C₅ a C₂₁,

5 - R'₂ representa um átomo de hidrogênio ou um grupo de alquila C₁ a C₃,

- R'₃ representa um radical selecionado do grupo formado por um átomo de hidrogênio, um grupo de metila, um grupo de etila e um radical de alquila linear ou ramificado C₃ ou C₄, e

10 - R'₄ representa um radical de alquila linear ou ramificado C₁ a C₁₀, um radical de alquenila linear ou ramificado C₂ a C₁₀ ou um resíduo de esterol; e

(iv) uma mistura dos mesmos.

2. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que R₂, R₃ e R₄ representam um átomo de hidrogênio.

15 3. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que R₁ significa um radical de isopropila.

4. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que o composto de fórmula geral (Ia) é o éster diisopropílico de ácido N,N'-bis(benzil) etilenodiamina-N,N'-diacético.

20 5. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que compreende de 0,01% a 5% em peso de composto de fórmula geral (Ia) em relação ao peso total da dita composição.

25 6. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que o dito éster de aminoácido é N-lauroilsarcosinato de isopropila de fórmula CH₃-(CH₂)₁₀CO-N(CH₃)-CH₂-COO-CH(CH₃)₂.

7. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que compreende de 0,05% a 25% em peso do dito solvente e, relação ao peso total da composição.

8. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizada

pelo fato de que o dito solvente e o dito composto de fórmula geral (Ia) estão presente em uma relação de massa [solvente/composto de fórmula geral (Ia)] variando de 1,5 a 15.

5 9. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que o dito solvente é isononanoato de isononila e a relação de massa [isononanoato de isononila/composto de fórmula geral (Ia)] está variando de 5,25 a 8.

10 10. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que o solvente é um éster de aminoácido de fórmula (II) e a relação de massa [éster de aminoácido de fórmula (II) /composto de fórmula geral (Ia)] está variando de 4,5 a 10.

11. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que está na forma de uma emulsão de água em óleo ou óleo em água.

15 12. Composição de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que também compreende pelo menos um agente fotoprotetor orgânico e/ou pelo menos um agente fotoprotetor mineral que é ativo na faixa de UVA e/ou UVB.

20 13. Processo de tratamento não terapêutico para cuidar e/ou repor materiais de queratina, caracterizado pelo fato de que compreende pelo menos a etapa de aplicar aos ditos materiais de queratina, pelo menos uma composição como definida de acordo com a reivindicação 1.

RESUMO

“COMPOSIÇÃO COSMÉTICA E/OU DERMATOLÓGICA, E, PROCESSO DE TRATAMENTO NÃO TERAPÊUTICO PARA CUIDAR E/OU REPOR MATERIAIS DE QUERATINA”

- 5 A presente invenção refere-se a uma composição cosmética e dermatológica que compreende, em um meio fisiologicamente aceitável contendo pelo menos um óleo: (a) pelo menos um composto de fórmula geral (Ia) ; e (b) uma quantidade eficiente de pelo menos um solvente selecionado de: (i) isononanoato de isononila; (ii) isossorbeto de dimetila; (iii) os ésteres
- 10 de aminoácido de fórmula (II) ; e (iv) uma mistura dos mesmos.