



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

(21) **PI0612448-8 A2**

(22) Data de Depósito: 09/05/2006
(43) Data da Publicação: 23/11/2010
(RPI 2081)



(51) *Int.Cl.:*
A61K 9/12
A61K 47/10
A61K 47/38

(54) Título: **COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO**

(30) Prioridade Unionista: 09/05/2005 US 60/679,020,
21/03/2006 US 60/784,793

(73) Titular(es): FOAMIX LTD.

(72) Inventor(es): ALEX BESONOV, DORON FRIEDMAN, DOV
TAMARKIN

(74) Procurador(es): SÍMBOLO MARCAS E PATENTES
LTDA

(86) Pedido Internacional: PCT IB2006003628 de 09/05/2006

(87) Publicação Internacional: WO 2007/039825 de 12/04/2007

(57) Resumo: COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO, trata-se a presente invenção de uma composição espumosa contendo um sacarídeo, para ser utilizada no tratamento de diversas doenças, que compreende: água; um sacarídeo; entre aproximadamente 0,2% e aproximadamente 5%, em peso, de um agente tensoativo; entre aproximadamente 0,01% e aproximadamente 5%, em peso, de pelo menos um agente polimérico selecionado do grupo que consiste em um agente bioadesivo, um agente gelificante, um agente formador de película e um agente de mudança de fase, e; um agente propelente gasoso liquefeito ou comprimido, a uma concentração que varia entre aproximadamente 3% e aproximadamente 25%, em peso, da composição total.

“COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO”Referência Remissiva a Pedidos de Patentes Relacionados

O presente pedido de patente reivindica o benefício de prioridade, sob o Título 35 do Código dos Estados Unidos, seção 119(e), do
5 Pedido de Patente Norte-Americano da Série Número 60/679020, depositado em 09 de maio de 2005, intitulado “Hygroscopic Anti-Infective Compositions”, cuja tradução possível seria “Composições Antiinfectivas Higroscópicas”, o qual está incluído no presente relatório apenas a título de referência.

O presente pedido de patente também reivindica o
10 benefício de prioridade, sob o Título 35 do Código dos Estados Unidos, seção 119(e), do Pedido de Patente Norte-Americano da Série Número 60/784793, depositado em 21 de março de 2006, intitulado “Polyol Foamable Vehicle and Pharmaceutical Compositions Thereof”, cuja tradução possível seria “Composição Farmacêutica Higroscópica, Veículo Farmacêutico Espumoso e Composição
15 Farmacêutica Espumosa”, o qual está incluído no presente relatório apenas a título de referência.

Fundamentos da Invenção

Trata-se a presente invenção de composições espumosas para uso cosmético e farmacêutico.

20 A administração tópica externa é uma rota importante para a administração de drogas, em tratamentos de doenças. Muitos grupos de drogas, incluindo, por exemplo, medicamentos antibióticos, antifúngicos, antiinflamatórios, anestésicos, analgésicos, antialérgicos, corticosteróides, retinóides e antiproliferativos, são administrados, preferivelmente, em
25 preparações sólidas. Apesar de as composições semi-sólidas, como, por exemplo, cremes e pomadas, serem geralmente utilizadas pelos consumidores, são necessárias novas formas de composições para a obtenção de um melhor controle da aplicação, mantendo e oferecendo propriedades benéficas de tais produtos à pele.

30 Portanto, ainda há a necessidade de se obter formulações aprimoradas de uma espuma estável, não-irritante e fácil de ser empregada, que seja desenvolvida para o tratamento de tecidos dérmicos e mucosos.

Sumário da Invenção

O objetivo da presente invenção consiste em oferecer uma ferramenta de administração tópica externa aprimorada.

De acordo com a presente invenção, é apresentada uma
5 composição espumosa de sacarídeo, que compreende:

(i) água;

(ii) um sacarídeo;

(iii) entre aproximadamente 0,2% e aproximadamente 5%,
em peso, de um agente tensoativo;

10 (iv) entre aproximadamente 0,01% e aproximadamente 5%, em peso, de pelo menos um agente polimérico selecionado do grupo que consiste em um agente bioadesivo, um agente gelificante, um agente formador de película e um agente de mudança de fase, e;

(v) um agente propelente gasoso liquefeito ou
15 comprimido, a uma concentração que varia entre aproximadamente 3% e aproximadamente 25%, em peso, da composição total.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, o sacarídeo é selecionado do grupo que consiste em um sacarídeo, um monossacarídeo, um dissacarídeo, um oligossacarídeo e um álcool de açúcar,
20 bem como misturas constituídas de sacarídeos que ocorram naturalmente, como, por exemplo, mel.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, a composição de sacarídeo também compreende um agente adjuvante de formação de espuma selecionado do grupo que consiste em um álcool graxo de
25 cadeia longa e um ácido graxo de cadeia longa.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, a composição de sacarídeo também compreende um agente solvente hidrofóbico.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, a composição de sacarídeo se apresenta na forma de uma emulsão do tipo óleo
30 em água, sendo que o balanço hidrofílico-lipofílico (HLB) do agente tensoativo varia entre aproximadamente 9 e aproximadamente 14.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, a composição de sacarídeo também compreende pelo menos um componente selecionado do grupo que consiste em um agente queratolítico e um solvente polar.

5 De acordo com outras modalidades da presente invenção, a composição de sacarídeo também compreende pelo menos um agente ativo selecionado do grupo que consiste em: extratos fitoterápicos ativos, acaricidas, agentes de remoção de queratose e manchas senis, agentes alergênicos, agentes analgésicos, agentes analgésicos locais, agentes antiacne, agentes
10 antialérgicos, agentes antienvelhecimento, agentes antibacterianos, agentes antibióticos, agentes antieimaduras, agentes anticancerígenos, agentes anticaspas, agentes antidepressivos, agentes antidermatites, agentes antiedêmicos, agentes anti-histamínicos, agentes anti-helmínticos, agentes anti-hiperqueratolíticos, agentes antiinflamatórios, agentes antiirritantes, agentes
15 antilipêmicos, agentes antimicrobianos, agentes antimicóticos, agentes antiproliferativos, agentes antioxidantes, agentes anti-rugas, agentes antipruriginosos, agentes antipsoriáticos, agentes anti-rosáceas, agentes anti-seborréicos, agentes anti-sépticos, agentes antiinchaços, agentes antivirais, agentes antifungos, agentes adstringentes, agentes cardiovasculares tópicos,
20 agentes quimioterapêuticos, agentes corticosteróides, agentes ácidos dicarboxílicos, agentes desinfetantes, agentes fungicidas, agentes reguladores de crescimento capilar, hormônios, hidroxiácidos, agentes imunossuppressores, agentes imunorreguladores, agentes inseticidas, agentes repelentes de insetos, agentes queratolíticos, lactamas, metais, óxidos metálicos, agentes acaricidas,
25 neuropeptídeos, agentes antiinflamatórios não-esteróides, agentes oxidantes, agentes pediculicidas, agentes para terapia fotodinâmica, agentes retinóides, agentes escabicidas, agentes autobronzeadores, agentes branqueadores de pele, agente vasoconstritores, agentes vasodilatadores, vitaminas, derivados da vitamina D, agentes cicatrizantes e agentes removedores de verrugas.

30 De acordo com outras modalidades da presente invenção, a composição de sacarídeo também é higroscópica.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, a concentração do sacarídeo é ajustada para a obtenção de um índice de atividade de água que varia entre (1) aproximadamente 0,8 e aproximadamente 0,9; (2) aproximadamente 0,7 e aproximadamente 0,8, e; (3) menos de aproximadamente 0,7.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, a composição farmacêutica higroscópica também compreende uma concentração terapeuticamente eficaz de um agente anti-infectivo.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, a composição higroscópica da presente invenção também contém um agente anti-infectivo selecionado do grupo que consiste em: um agente antibiótico, um agente antibacteriano, um agente antifúngico, um agente de controle de fungo, um agente antiviral e um agente antiparasitário.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, o agente antibiótico é selecionado do grupo que consiste em: antibiótico beta-lactâmico, aminoglicosídeo, antibiótico do tipo ansa, antraquinona, azol, metronidazol, antibiótico glicopéptidico, macrolídeo, eritromicina, clindamicina, antibiótico nucleosídeo, antibiótico peptídeo, polimixina B, antibiótico poliênico, antibiótico poliéter, antibiótico quinolônico, antibiótico esteróide, ácido fusídico, mupirocina, cloranfenicol, antibiótico sulfonamida, tetraciclina, metal antibiótico, partículas microcristalinas e nanocristalinas de prata, cobre, zinco, mercúrio, estanho, chumbo, bismuto, cádmio e cromo, um agente oxidante, iodato, iodo, periodato, hipoclorito, permanganato, uma substância que libere radicais livres e/ou oxigênio ativo, um agente antimicrobiano catiônico, um composto de amônio quaternário, uma biguanida, clorhexidina, uma triguanida, uma bisbiguanida, uma biguanida polimérica e um composto antibiótico que ocorra naturalmente, bem como análogos, derivados, sais, íons e complexos de tais substâncias.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, o agente antifúngico é um agente que é útil para o tratamento de uma infecção fúngica superficial da pele, dermatofitoses, infecções causadas por dermatófitos do gênero *Microsporum*, *Trichophyton* e *Epidermophyton*, candidíase, candidíase bucal (sapinhos), fungos e *Candida*.

De acordo com outras modalidades da presente invenção, o agente antifúngico é selecionado do grupo que consiste em: polieno, natamicina, nistatina; alilamina, naftifina, terbinafina; imidazol, bifonazol, clotrimazol, econazol, fenticonazol, quetoconazol, miconazol, oxiconazol; diazol, triazol, fluconazol, itraconazol, terconazol, tolnaftato, ciclopirox, ácido undecilênico, sulbentina, griseofulvina, anfotericina B, flucitosina (5FC), um composto de morfolina, amorolfina e morfolinas relacionadas, bem como seus análogos, derivados e sais, e qualquer combinação constituída de tais substâncias, a uma concentração terapeuticamente eficaz.

De acordo com uma segunda modalidade da presente invenção, é apresentado um tratamento de uma doença de pele, em uma superfície corporal, em uma cavidade corporal ou em uma superfície da mucosa, na cavidade nasal, na boca, nos olhos, no canal auditivo, na vagina e no reto, o qual consiste na administração das composições de sacarídeo da presente invenção, em uma área alvo de tratamento.

Descrição Detalhada da Invenção

Trata-se a presente invenção de uma composição espumosa, que contém um sacarídeo, para ser utilizada no tratamento de diversas doenças.

De acordo com uma ou mais modalidades da presente invenção, a composição espumosa de sacarídeo compreende:

- (a) uma solução aquosa de sacarídeo;
- (b) entre aproximadamente 0,2% e aproximadamente 5%, em peso, de um agente tensoativo;
- (c) entre aproximadamente 0,01% e aproximadamente 5%, em peso, de pelo menos um agente polimérico;
- (d) um agente propelente gasoso liquefeito ou comprimido, a uma concentração que varia entre aproximadamente 3% e aproximadamente 25%, em peso, da composição total, e;
- (e) todos os valores em porcentagem são fornecidos em base ponderal (peso/peso).

Água e outros ingredientes opcionais são adicionados para completar a massa total de 100%.

Sob a liberação de um recipiente aerossol, a composição espumosa da presente invenção forma uma espuma expandida apropriada para o tratamento de uma superfície infectada e para a administração tópica sobre a pele, sobre uma superfície do corpo, sobre uma cavidade corporal ou sobre uma superfície da mucosa.

Sacarídeo

Os sacarídeos variam desde açúcares simples, contendo de três a sete átomos de carbono, até os polímeros muito complexos.

Exemplos de sacarídeos incluem, mas não ficam limitados a: monossacarídeos, dissacarídeos, oligossacarídeos e alcoóis de açúcar, que apresentam propriedades higroscópicas.

Um monossacarídeo é um açúcar simples que não pode ser hidrolisado a unidades menores. A fórmula empírica é $(CH_2O)_n$ e varia em tamanho desde trioses ($n=3$) até heptoses ($n=7$). Exemplos de compostos monossacarídeos incluem: ribose, glicose, frutose e galactose.

Os dissacarídeos são compostos de dois monossacarídeos ligados conjuntamente, como, por exemplo, sacarose, maltose e lactose.

Um álcool de açúcar (também conhecido como poliol, álcool poliídrico ou poliálcool) é uma forma hidrogenada de sacarídeo, cujo grupo carbonila (aldeído ou cetona, açúcar redutor) foi reduzido a um grupo hidroxila primário ou secundário. Eles são geralmente utilizados para substituir a sacarose em gêneros alimentícios, freqüentemente em combinação com adoçantes artificiais de alta intensidade, para contrabalancear o baixo teor de doçura. Exemplos de alcoóis de açúcar, que são apropriados para o uso, de acordo com a presente invenção, são: manitol, sorbitol, xilitol, maltitol e lactitol. (maltitol e lactitol não são compostos completamente hidrogenados - eles são um monossacarídeo combinado com um álcool poliídrico).

De acordo com uma modalidade da presente invenção, a concentração do sacarídeo na composição espumosa da presente invenção varia

entre aproximadamente 20% e aproximadamente 80%. Em determinadas modalidades da presente invenção, a concentração do sacarídeo na composição espumosa da presente invenção varia entre aproximadamente 50% e aproximadamente 80%. Um exemplo de solução de sacarídeo apropriado, de acordo com a presente invenção, contém 70% de sorbitol em água. Outro exemplo de solução de sacarídeo apropriado é o mel, que é composto principalmente de açúcares e água. O mel comum contém aproximadamente 80% de sacarídeo e aproximadamente 17% de água, sendo que os principais sacarídeos são glicose e frutose.

10

Agente Polimérico

A composição espumosa da presente invenção contém um agente polimérico. Foi documentado que a presença de um agente polimérico é necessária para a formação de uma espuma que apresente uma fina estrutura de bolhas e não desmorone prontamente, sob a liberação da lata de aerossol pressurizada. O agente polimérico serve para estabilizar a composição espumosa e controlar a permanência da droga no órgão alvo. De preferência, o agente polimérico é selecionado do grupo que consiste em um agente bioadesivo, um agente gelificante, um agente formador de película e um agente de mudança de fase.

20

Os exemplos de agentes poliméricos que podem ser utilizados de acordo com uma ou mais modalidades da presente invenção incluem, por exemplo, mas não ficam limitados a: materiais poliméricos que ocorrem naturalmente, como, por exemplo, goma de alfarrobeira, alginato de sódio, caseinato de sódio, albumina de ovo, ágar gelatina, goma de carragenina, alginato de sódio, goma de xantana, extrato de semente de marmelo, goma de tragacanto, goma guar, goma guar catiônica, hidroxipropil goma guar e amido; polímeros que contêm amina, como, por exemplo, quitosana; polímeros ácidos obteníveis de fontes naturais, como, por exemplo, ácido algínico e ácido hialurônico; amidos quimicamente modificados e algo do gênero, polímeros carboxivinílicos, polivinil pirrolidona, álcool polivinílico, polímeros do ácido poliacrílico, polímeros do ácido polimetacrílico, polímeros do acetato polivinílico,

30

polímeros de cloreto polivinílico, polímeros do cloreto polivinilideno e algo do gênero.

Outros exemplos de agentes gelificantes incluem os copolímeros de acrilato de etila/ácido acrílico e os polímeros carboxivinílicos.

5 Estas resinas consistem, essencialmente, em um polímero reticulado de poliéter de polialquenila coloidal solúvel em água do ácido acrílico reticulado com um agente de reticulação como, por exemplo, polialil sacarose ou polialil pentaeritritol. Os exemplos compreendem Carbopol® 934, Carbopol® 940, Carbopol® 950, Carbopol® 980, Carbopol® 951 e Carbopol® 981. O Carbopol® 934 é um
10 polímero solúvel em água do ácido acrílico reticulado com um éter polialílico de sacarose.

Outros exemplos de agentes poliméricos que podem ser utilizados de acordo com uma ou mais modalidades da presente invenção incluem materiais poliméricos semi-sintéticos, como, por exemplo, éteres de celulose,
15 como metilcelulose, hidroxipropilcelulose, hidroxipropilmetilcelulose, hidroxietilcelulose, hidroxipropilmetilcelulose, metil hidroxietilcelulose, metil hidroxipropilcelulose, hidroxietilcarboximetilcelulose, carboximetilcelulose, carboximetilcelulose, carboximetil hidroxietilcelulose e celulosas catiônicas. Os polietilenoglicóis, com peso molecular igual ou superior a 1000 (como, por
20 exemplo, PEG 1.000, PEG 4.000, PEG 6.000 e PEG 10.000) também apresentam capacidade gelificante e, apesar de serem considerados como "solventes polares secundários", conforme descrição no presente relatório, os ditos polietilenoglicóis também são considerados "agentes poliméricos". As misturas dos agentes poliméricos acima são contempladas.

25 A concentração do agente polimérico deve ser selecionada de tal forma que a composição espumosa da presente invenção, depois de ser introduzida nas latas de aerossol, tenha a capacidade de fluir e possa ser agitada na lata. Em uma ou mais modalidades da presente invenção, a concentração do agente polimérico é selecionada de tal forma que a viscosidade da composição, antes de ser introduzida nas latas de aerossol, seja inferior a
30 12.000 cP ou, de preferência, inferior a 10.000 cP.

Agente Tensoativo

A composição espumosa da presente invenção também contém um agente tensoativo. Os agentes tensoativos (também denominados "agentes surfactantes") incluem qualquer agente que una o óleo e a água, na composição espumosa da presente invenção, sob a forma de uma emulsão. O índice do balanço hidrofílico-lipofílico (HLB) de um agente surfactante descreve a afinidade do emulsificador com a água ou com o óleo. O índice do balanço hidrofílico-lipofílico (HLB) é definido por agentes surfactantes não-iônicos. A escala do balanço hidrofílico-lipofílico (HLB) varia entre 1 (totalmente lipofílico) e 20 (totalmente hidrófilo), sendo que 10 representa um balanço hidrofílico-lipofílico igual para ambas as características. Os emulsificadores lipofílicos formam emulsões do tipo água em óleo, enquanto os tensoativos hidrofílicos formam emulsões do tipo óleo em água. O balanço hidrofílico/lipofílico de uma mistura constituída de dois emulsificadores iguala a fração de peso do emulsificador "A" vezes seu índice do balanço hidrofílico/lipofílico, mais a fração de peso do emulsificador "B" vezes seu índice do balanço hidrofílico/lipofílico (uma média ponderada).

De acordo com uma ou mais modalidades da presente invenção, o agente tensoativo tem um índice do balanço hidrofílico/lipofílico entre aproximadamente 9 e aproximadamente 14, isto é, o índice do balanço hidrofílico/lipofílico necessário (o índice do balanço hidrofílico/lipofílico necessário para estabilizar uma emulsão do tipo óleo em água de um determinado óleo) para a maioria dos óleos e solventes hidrofóbicos. Conseqüentemente, em uma ou mais modalidades da presente invenção, a composição contém um único agente tensoativo, cujo índice do balanço hidrofílico/lipofílico varia entre aproximadamente 9 e 14 e, em uma ou mais modalidades da presente invenção, a composição contém mais de um agente tensoativo e a média ponderada de seus índices do balanço hidrofílico/lipofílico varia entre aproximadamente 9 e aproximadamente 14. Entretanto, em outras modalidades da presente invenção, quando se deseja uma emulsão do tipo óleo em água, a composição contém um ou mais agentes tensoativos, com um índice do balanço hidrofílico/lipofílico entre aproximadamente 2 e aproximadamente 9.

De preferência, a composição espumosa da presente invenção contém um agente surfactante não-iônico. Outros exemplos não limitadores de possíveis agentes surfactantes não-iônicos incluem polissorbatos, como, por exemplo, monoestearato de polioxietileno (20) sorbitana (Tween 60) e
5 monooleato de polioxietileno (20) sorbitana (Tween 80); ésteres de ácido graxo de poli(oxietileno) (POE), como, por exemplo, Myrj 45, Myrj 49, Myrj 52 e Myrj 59; éteres alquilila de poli(oxietileno), como, por exemplo, éter de cetila poli(oxietileno), éter palmitílico de poli(oxietileno), éter hexadecílico de óxido de polietileno, éter de cetila de polietilenoglicol, brij 38, brij 52, brij 56 e brij W1;
10 ésteres de sacarose, ésteres parciais de sorbitol e anidridos de sorbitol, como, por exemplo, monolaurato de sorbitana e monoglicerídeos ou diglicerídeos de monolaurato de sorbitana, isoceteth-20 e mono-, di- e tri- ésteres de sacarose com ácidos graxos (ésteres de sacarose).

Em determinados casos, o agente tensoativo é
15 selecionado do grupo que consiste em agentes tensoativos catiônicos, agentes tensoativos zwitteriônicos, agentes tensoativos anfotéricos e agentes tensoativos anfotéricos, como, por exemplo, metil cocoil taurato de sódio, metil oleoil taurato de sódio, lauril sulfato de sódio, lauril sulfato de trietanolamina e betaínas.

Em uma ou mais modalidades da presente invenção, o
20 agente tensoativo inclui pelo menos um agente surfactante não-iônico. Os agentes surfactantes iônicos são conhecidos por serem irritantes à pele. Conseqüentemente, os agentes surfactantes não-iônicos são preferidos em aplicações que incluem tecidos sensíveis, tais como aqueles encontrados na maioria dos tecidos mucosos, especialmente quando estão infectados ou
25 inflamados.

Descobriu-se, surpreendentemente, que os agentes surfactantes não-iônicos sozinhos oferecem espumas de excelente qualidade, isto é, uma pontuação "E", de acordo com a escala de avaliação discutida abaixo, no presente relatório.

30 Conseqüentemente, em uma modalidade preferida da presente invenção, o agente tensoativo da composição espumosa contém um

agente surfactante não-iônico ou uma mistura constituída de agentes surfactantes não-iônicos, como o único agente tensoativo.

Entretanto, em outras modalidades da presente invenção, a composição espumosa compreende uma mistura constituída de pelo menos um agente surfactante não-iônico e pelo menos um agente surfactante iônico, a uma proporção que varia entre aproximadamente 100:1 e 6:1.

Em outras modalidades da presente invenção, o agente tensoativo da composição espumosa compreende uma combinação constituída de um agente surfactante não-iônico e um agente surfactante iônico, a uma proporção que varia entre aproximadamente 1: 1 e 20:1.

A concentração do agente tensoativo da composição espumosa da presente invenção varia entre aproximadamente 0,1% e aproximadamente 5%.

Solvente Hidrofóbico

Opcionalmente, o veículo espumoso da presente invenção também contém pelo menos um solvente hidrofóbico. A expressão "solvente hidrofóbico", conforme utilizada no presente relatório, não pretende caracterizar as capacidades de solubilização do solvente para qualquer agente ativo específico ou de qualquer outro componente da composição espumosa da presente invenção. Especificamente, tal informação é fornecida para ajudar na identificação dos materiais apropriados, que podem ser utilizados como uma parte integrante das composições espumosas da presente invenção, conforme descrição no presente relatório.

Um "solvente hidrofóbico", de acordo com a presente invenção, inclui, mas não fica limitado a um material que possui solubilidade em água destilada, à temperatura ambiente, inferior a aproximadamente 1 g por 100 ml, de preferência, inferior a aproximadamente 0,5 g por 100 ml, e, preferivelmente, inferior a aproximadamente 0,1 g por 100 ml.

Em uma ou mais modalidade da presente invenção, o veículo orgânico hidrofóbico é um óleo, como, por exemplo, óleo mineral, palmitato de isopropila, isostearato de isopropila, adipato de diisopropila, dimerato de diisopropila, óleo de soja maleatado, palmitato de octila, lactato de cetila,

ricinoleato de cetila, acetato de tocoferila, álcool de lanolina acetilado, acetato de cetila, fenil trimeticona, oleato de glicerila, linoleato de tocoferila, glicerídeos de germe de trigo, propionato de araquidilo, lactato de miristila, oleato de decila, ricinoleato de propileno glicol, lanolato de isopropila, tetraestearato de pentaeritritila, dicaprilato/dicaprato de neopentilglicol, isononanoato de isononila, isononanoato de isotridecila, miristato de miristila, citrato de triisocetila, dodecanol de octila; óleos insaturados ou poli-insaturados, como, por exemplo, óleo de oliva, óleo de milho, óleo de soja, óleo de canola, óleo de semente de algodão, óleo de coco, óleo de gergelim, óleo de girassol, óleo de semente de borragem, óleo de cravo-da-índia, óleo de semente de cânhamo, óleo de arenque, óleo de fígado de bacalhau, óleo de salmão, óleo de linhaça, óleo de germe de trigo, óleo de primula da noite; óleos essenciais, e; óleos de silicone, como, por exemplo, dimeticona, ciclometicona, polialquilsiloxanos, poliarilsiloxanos, polialquilarilsiloxanos e copolímeros de polietersiloxano, copolímeros de polidimetilsiloxanos (dimeticonas) e poli(dimetilsiloxano)-(difenil-siloxano).

Agentes Adjuvantes de Formação de Espuma

Opcionalmente, um adjuvante de formação de espuma é incluído nos veículos espumosos da presente invenção, para aumentar a capacidade de formação de espuma dos agentes surfactantes e/ou para estabilizar a espuma.

Em uma ou mais modalidades da presente invenção, os agentes adjuvantes de formação de espuma incluem os alcoóis graxos que têm 15 ou mais carbonos em sua cadeia de carbono, como, por exemplo, o álcool cetílico e o álcool estearílico (ou as misturas constituídas de tais substâncias). Outros exemplos de alcoóis graxos são álcool araquidílico (C20), álcool beenílico (C22), 1-triacontanol (C30), assim como também os alcoóis com cadeias de carbono mais longas (até C50). Os alcoóis graxos, derivados de cera de abelhas, incluindo uma mistura constituída de alcoóis, sendo que a maioria deles possui pelo menos 20 átomos de carbono em sua cadeia de carbono, são especialmente apropriados como agentes adjuvantes de formação de espuma, de acordo com a presente invenção.

A concentração do álcool graxo, que é necessária para suportar o sistema espumoso, está inversamente relacionada à extensão de suas cadeias de carbono. Os agentes adjuvantes de formação de espuma, conforme definição no presente relatório, também são úteis para facilitar a capacidade de
5 espalhamento e absorção da composição espumosa da presente invenção.

Em uma ou mais modalidades da presente invenção, um agente adjuvante de formação de espuma compreende os ácidos graxos que possuem 16 ou mais carbonos em sua cadeia de carbono, como, por exemplo, o ácido hexadecanóico (C16), o ácido esteárico (C18), o ácido araquidílico (C20),
10 ácido beênico (C22), o ácido octacosanóico (C28), assim como também os ácidos graxos com cadeias de carbono mais longas (até C50), ou as misturas constituídas de tais substâncias. Assim como para os alcoóis graxos, a quantidade de ácidos graxos necessária para suportar o sistema espumoso está inversamente relacionada à extensão de suas cadeias de carbono.

15 Opcionalmente, a cadeia de átomo de carbono do álcool graxo ou do ácido graxo pode ter pelo menos uma ligação dupla. Outra classe de agente adjuvante de formação de espuma inclui um álcool graxo ramificado ou um ácido graxo ramificado. A cadeia de carbono do ácido graxo ou do álcool graxo também pode ser substituída por um grupo hidroxila, como, por exemplo, o ácido
20 12-hidroxi-esteárico.

Agente Queratolítico

Em uma modalidade da presente invenção, a composição espumosa de sacarídeo compreende um agente queratolítico. A expressão "agente queratolítico", como aqui utilizada, refere-se a um composto que
25 desprende e remove o *stratum corneum* (camada externa) da pele ou altera a estrutura das camadas de queratina da pele. Os agentes queratolíticos são utilizados no tratamento de muitas doenças dermatológicas, que envolvem pele ressecada, hiperqueratinização (como, por exemplo, psoríase), prurido cutâneo (como, por exemplo, xerose), acne e rosácea.

30 Exemplos de agentes queratolíticos apropriados para serem utilizados na presente invenção incluem, mas não ficam limitados a: N-acetilcisteína, ácido azeláico, cresóis, compostos de di-hidroxibenzeno, como, por

exemplo, resorcinol e hidroquinona, ácidos alfa-hidróxi, como, por exemplo, ácido láctico e ácido glicólico, fenol, ácido pirúvico, resorcinol, enxofre, ácido salicílico, ácido retinóico, ácido isoretinóico, retinol, retinal e uréia, bem como os derivados, os ésteres, os sais e as misturas constituídas de tais substâncias.

5

Solvente Polar/Agente Facilitador de Penetração

Em uma modalidade da presente invenção, a composição espumosa de sacarídeo compreende um solvente polar. Em uma ou mais modalidades, o solvente polar é um polioli, isto é, uma substância orgânica que contém pelo menos dois grupos hidróxi em sua estrutura molecular.

10

Exemplos de polióis incluem: propilenoglicol (por exemplo, 1,2-propilenoglicol e 1,3-propilenoglicol), butanodiol (por exemplo, 1,2-butanodiol, 1,3-butanodiol, 2,3-butanodiol e 1,4-butanodiol), butenodiol (por exemplo, 1,3-butenodiol e 1,4-butenodiol), butinodiol, pentanodiol (por exemplo, pentano-1,2-diol, pentano-1,3-diol, pentano-1,4-diol, pentano-1,5-diol, pentano-2,3-diol e pentano-2,4-diol), hexanodiol (por exemplo, hexano-1,6-diol, hexano-2,3-diol e hexano-2,5,6-diol), octanodiol (por exemplo, 1,8-octanodiol), neopentilglicol, 2-metil-1,3-propanodiol, dietilenoglicol, trietilenoglicol, tetraetilenoglicol, dipropilenoglicol, dibutilenoglicol, glicerina, butano-1,2,3-triol, butano-1,2,4-triol e hexano-1,2,6-triol.

20

Outros exemplos de solventes polares, que podem ser incluídos na composição espumosa da presente invenção, incluem: dimetil isossorbida, éter de polietilenoglicol do álcool tetrahidrofurfurílico (glicofurol), dimetilssulfóxido (DMSO), pirrolidonas (como, por exemplo, N-metil-2-pirrolidona e 1-metil-2-pirrolidona), etil proxitol, dimetilacetamida (DMAc) e ácidos alfa-hidróxi (como, por exemplo, ácido láctico, ácido glicólico e polietilenoglicol). Particularmente, os solventes polares, conforme explicação acima, geralmente possuem propriedades que facilitam a penetração do produto na pele.

25

Componentes Adicionais

Em uma modalidade, uma composição espumosa da presente invenção inclui um ou mais componentes adicionais. Tais componentes adicionais incluem, mas não ficam limitados a: agentes antitranspirantes, agentes antiestáticos, agentes de tamponagem, agentes de volume, agentes quelantes,

30

agentes detergentes, agentes corantes, agentes condicionadores, agentes desodorizantes, agentes diluentes, tinturas, agentes emolientes, fragrâncias, agentes condicionadores para cabelo, agentes umectantes, agentes oclusivos, óleos, agentes facilitadores de penetração, agentes perolizantes, agentes aromatizantes, agentes facilitadores de permeação, agentes ajustadores de pH, agentes conservantes, agentes protetores, agentes facilitadores de penetração na pele, agentes amaciantes, agentes solubilizadores, agentes protetores solares, agentes bloqueadores de raios solares, agentes bronzeadores sem sol, agentes modificadores de viscosidade e vitaminas. Como é de conhecimento dos especialistas versados na técnica, em algumas circunstâncias, um componente adicional específico pode ter mais de uma atividade, função ou efeito.

Em uma modalidade da presente invenção, o componente adicional é um agente ajustador de pH ou um agente de tamponagem. Os agentes de tamponagem apropriados para serem utilizados na presente invenção incluem, mas não ficam limitados a: ácido acético, ácido adípico, hidróxido de cálcio, ácido cítrico, glicina, ácido clorídrico, ácido láctico, aluminometassilicatos de magnésio, ácido fosfórico, carbonato de sódio, citrato de sódio, hidróxido de sódio, ácido sórbico, ácido succínico e ácido tartárico, bem como os derivados, os sais e as misturas constituídas de tais substâncias.

Em uma modalidade da presente invenção, o componente adicional é um agente emoliente. Os agentes emolientes apropriados para serem utilizados na presente invenção incluem, mas não ficam limitados a: óleo mineral, óleo de lanolina, óleo de coco, manteiga de cacau, óleo de oliva, extrato de aloe vera, óleo de jojoba, óleo de rícino, ácidos graxos, alcoóis graxos, adipato de diisopropila, éster de hidroxibenzoato, ésteres do ácido benzóico de álcoois de C9 a C15, isononanoato de isononila, óleos de silicone, poliéteres, alquilbenzoato de C12 a C15, ácido oléico, ácido esteárico graxo, alcoóis cetílicos, álcool hexadecílico, dimetilpolissiloxano, polioxipropileno cetil éter e polioxipropileno butil éter, bem como os derivados, os ésteres, os sais e as misturas constituídas de tais substâncias.

Em uma modalidade da presente invenção, o componente adicional é um agente umectante. Os agentes umectantes apropriados para

serem utilizados na presente invenção incluem, mas não ficam limitados a: guanidina, uréia, ácido glicólico, sais de glicolato, glicolato de amônio, glicolato de alquil amônio quaternário, ácido láctico, sais de lactato, lactato de amônio, lactato de alquil amônio quaternário, aloe vera, gel de aloe vera, alantoína, urazol, álcool

5 poli-hidróxi, sorbitol, glicerol, hexanotriol, propilenoglicol, butilenoglicol, hexilenoglicol, um derivado de hexilenoglicol, polietilenoglicol, açúcar, amido, um derivado de açúcar, um derivado de amido, glicose alcoxilada, ácido hialurônico, lactamida monoetanolamina, e acetamida monoetanolamina, bem como os derivados, os ésteres, os sais e as misturas constituídas de tais substâncias.

10 Em uma modalidade da presente invenção, o componente adicional é um agente conservante. Os agentes conservantes apropriados para serem utilizados na presente invenção incluem, mas não ficam limitados a: alquilbenzoatos de C12 a C15, alquil p-hidroxibenzoatos, extrato de aloe vera, ácido ascórbico, cloreto de benzalcônio, ácido benzóico, ésteres do ácido

15 benzóico de alcoóis de C9 a C15, hidroxitolueno butilado, óleo de rícino, alcoóis cetílicos, clorocresol, ácido cítrico, manteiga de cacau, óleo de coco, diazolidinil uréia, diisopropil adipato, dimetilpolisiloxano, 1,3-dimetilol-5-5-dimetil hidantoína (DMDM Hidantoína), etanol, ácidos graxos, alcoóis graxos, álcool hexadecílico, ésteres de hidroxibenzoato, iodopropinil butilcarbamato, isononanoato de

20 isononila, óleo de jojoba, óleo de lanolina, metilparabeno, óleo mineral, ácido oléico, óleo de oliva, poliéteres, polioxipropileno cetil éter, polioxipropileno butil éter, sorbato de potássio, óleos de silicone, propionato de sódio, benzoato de sódio, bissulfito de sódio, ácido sórbico, ácido esteárico graxo, vitamina E e acetato de vitamina E, bem como os derivados, os ésteres, os sais e as misturas

25 constituídas de tais substâncias.

Em uma modalidade da presente invenção, o componente adicional é um agente facilitador de penetração na pele. Os agentes facilitadores de penetração na pele apropriados para serem utilizados na presente invenção incluem, mas não ficam limitados a: acetona, acil lactilatos, acil peptídeos, acil

30 sarcosinatos, sais de alcanolamina de ácidos graxos, alquilbenzeno sulfonatos, alquiléter sulfatos, alquil sulfatos, agentes tensoativos aniônicos, benzoato de benzila, salicilato de benzila, butano-1,4-diol, benzoato de butila, laurato de butila,

miristato de butila, estearato de butila, agentes tensoativos catiônicos, ácido cítrico, cocoamidopropilbetaína, decilmetil sulfóxido, oleato de decila, azelato de dibutila, ftalato de dibutila, dibenzil sebacato, dibutil sebacato, dibutil suberato, succinato de dibutila, adipato de dicaprila, ftalato de didecila, dietilenoglicol, dietil sebacato, dietil-m-toluamida, éter di(2-hidroxipropílico), adipato de diisopropila, diisopropil sebacato, N,N-dimetil acetamida, azelato de dimetila, N,N-dimetil-formamida, 1,5-dimetil-2-pirrolidona, dimetil sebacato, sulfóxido de dimetila, adipato de dioctila, azelato de dioctila, dioctil sebacato, 1,4-dioxano, 2-dodecilazaciloheptan-2-ona, óxidos de dodecildimetilamina, caprato de etila, caproato de etila, caprilato de etila, pelargonato de 2-etil-hexila, 2-hidroxipropanoato de etila, laurato de etila, miristato de etila, 1-etil-2-pirrolidona, salicilato de etila, laurato de hexila, ácido 2-hidroxiocetanóico, ácido 2-hidroxipropanóico, ácido 2-hidroxipropiônico, isetionatos, isostearato de isopropila, palmitato de isopropila, cloreto de hidroxipropiltrimônio guar, hexano-2,5-diol, quelina, Lamepon®, álcool laurílico, Maypon®, sal metálico de ácidos graxos, metil nicotinato, 2-metil propan-2-ol, 1-metil-2-pirrolidona, 5-metil-2-pirrolidona, metil taurida, Miranol®, agentes tensoativos não-iônicos, álcool octílico, octilfenoxipoliétoxietanol, etanol amida oléico, álcool oleílico, pentano-2,4-diol, fenoxietanol, fosfatidil colina, óxidos de fosfina, etil glicolatos polialcoxilados, cloreto de polidialilpiperidino, cloreto de polidipropildialilamônio, ésteres de poliglicerol, polioxietileno lauril éter, estearato de polioxi:polioxietileno, éter estearílico do polioxipropileno (15), cloreto de polivinil piridínio, propan-1-ol, propan-2-ol, dipelargonato de propilenglicol, ácidos piroglutâmicos, 2-pirrolidona, ácidos pirúvicos, Quaternium 5, Quaternium 18, Quaternium 19, Quaternium 23, Quaternium 31, Quaternium 40, Quaternium 57, sais de amina quaternária, dimetilaminoetilmetacrilato poliquaternizado, álcool polivinílico quaternizado, cloridrato de Sapamin®, cocaminopropionato de sódio, dioctil sulfosuccinato de sódio, laurato de sódio, lauril éter sulfato de sódio, lauril sulfato de sódio, ésteres de açúcar, sulfosuccinato, tetraidrofurano, álcool tetrahidrofurfural, Transcutol®, dodecilbenzeno sulfonato de trietanolamina, oleato de trietanolamina, uréia e água, bem como os derivados, os ésteres, os sais e as misturas constituídas de tais substâncias.

Agentes Propelentes

Exemplos de agentes propelentes apropriados para serem utilizados na presente invenção incluem, mas não ficam limitados a: hidrocarbonetos voláteis, como, por exemplo, butano, propano, isobutano e gases
5 fluorcarbonados ou as misturas constituídas de tais substâncias.

Em determinadas modalidades da presente invenção, os agentes propelentes hidrofluorcarbonados, diferentes de clorofluorocarbonos (CFCs), que são agentes propelentes não destruidores da camada de ozônio, são particularmente úteis na produção de uma composição espumosa não inflamável.

10 Exemplos de agentes propelentes apropriados para serem utilizados na presente invenção incluem, mas não ficam limitados a: agentes propelentes hidrofluorcarbonados (HFC), que não contêm nenhum átomo de cloro e, conseqüentemente, não causam nenhum tipo de preocupação em relação à destruição da camada de ozônio estratosférico por
15 clorofluorocarbonos ou outros hidrocarbonos clorados.

Exemplos de agentes propelentes não inflamáveis, de acordo com este aspecto da presente invenção, incluem agentes propelentes fabricados pela DuPont, sob a marca registrada Dymel, como, por exemplo, 1,1,1,2 tetrafluoretano (Dymel 134), e 1,1,1,2,3,3,3 heptafluoropropano (Dymel
20 227), 1,1, difluoroetano (Dymel 152) e 1,1,1,3,3,3 hexafluoropropano. Os agentes propelentes hidrofluorcarbonados (HFC) apresentam um índice zero de possibilidade de destruição da camada de ozônio e, conseqüentemente, eles podem ser utilizados como agentes propelentes em produtos em aerossol.

O agente propelente compõe entre aproximadamente 5%
25 e 55% em peso da composição espumosa da presente invenção. Os agentes propelentes em aerossol são utilizados para gerar e administrar a composição espumosa da presente invenção, sob a forma de espuma. A composição total da presente invenção, incluindo o agente propelente, as composições espumosas e os ingredientes opcionais, é denominada composição espumosa.

30 Características Físicas e Vantagens da Composição e da Espuma

Uma composição farmacêutica ou cosmética fabricada por meio do uso do veículo espumoso da presente invenção é muito fácil de ser utilizada. Quando aplicada na superfície afetada do corpo de mamíferos, isto é, na superfície afetada de seres humanos ou animais, a composição espumosa da presente invenção fica em um estado espumoso, o que permite a aplicação livre, sem derramamento. Sob uma aplicação de uma força mecânica adicional, como, por exemplo, por meio da fricção da composição na superfície do corpo, a composição espumosa da presente invenção é livremente espalhada na superfície e rapidamente absorvida.

A composição espumosa da presente invenção é estável, possui uma vida útil de armazenamento aceitável de pelo menos um ano ou, de preferência, uma vida útil de armazenamento de pelo menos dois anos, à temperatura ambiente, conforme observado em testes de estabilidade acelerados. Os veículos orgânicos e os agentes propelentes tendem a prejudicar a estabilidade das emulsões, bem como interferir na formação da espuma estável. No entanto, observou-se que as composições espumosas, de acordo com a presente invenção, são surpreendentemente estáveis. De acordo com os estudos de estabilidade acelerada, as composições espumosas da presente invenção demonstram uma textura desejável, formam estruturas finas de bolhas, que não quebram imediatamente quando entram em contato com uma superfície, espalham facilmente na área tratada e absorvem rapidamente.

A composição espumosa da presente invenção também deve fluir livremente, para que ela possa fluir pela abertura do recipiente, como, por exemplo, de um recipiente aerossol, e criar uma espuma aceitável.

A qualidade da espuma pode ser classificada da seguinte maneira:

- Grau de Qualidade E (Excelente): muito rica e cremosa na aparência, não apresenta nenhuma estrutura de bolhas e nem apresenta uma estrutura muito fina (pequena) de bolhas; não fica nebulosa rapidamente; quando espalhada sobre a pele, a espuma retém a propriedade de cremosidade e não fica aquosa.

- Grau de Qualidade B (Boa): rica e cremosa na aparência, bolhas de tamanho muito pequeno; torna-se nebulosa mais rapidamente do que a espuma de Grau de Qualidade Excelente; quando espalhada sobre a pele, a espuma conserva a propriedade de cremosidade e não
5 fica aquosa.

- Grau de Qualidade RB (Razoavelmente Boa): uma quantidade moderada de cremosidade visível; apresenta uma estrutura de bolhas visível; quando espalhada sobre a pele, torna-se rapidamente nebulosa e torna-se um tanto inferior em relação à viscosidade aparente.

10 - Grau de Qualidade R (Razoável): cremosidade visível muito pequena; apresenta uma estrutura de bolhas maior do que a espuma de Grau de Qualidade "Razoavelmente Boa"; quando espalhada sobre a pele, sua aparência torna-se rala e fica aquosa.

- Grau de Qualidade P (Pobre): sem cremosidade visível;
15 apresenta uma estrutura de bolhas grandes; quando espalhada sobre a pele, sua aparência torna-se rala e fica aquosa.

- Grau de Qualidade MP (Muito Pobre): espuma seca; apresenta uma estrutura de bolhas grandes e muito opacas; difícil de ser espalhada sobre a pele.

20 As espumas que podem ser topicamente administradas são geralmente as espumas de Grau de Qualidade Excelente ou Boa, quando liberadas de um recipiente aerossol. As bolhas menores são indicativas de uma espuma mais estável, que não desmorona espontaneamente, imediatamente após a descarga do recipiente. A estrutura mais fina da espuma parece ser e
25 realmente é mais suave, portanto, aumenta sua usabilidade e atração.

Outro aspecto das propriedades da espuma da presente invenção refere-se à sua capacidade de quebra. A espuma quebrável é termicamente estável, contudo, quebra sob tensão de cisalhamento. A capacidade de quebra sob tensão de cisalhamento da espuma é claramente
30 vantajosa em relação à capacidade de quebra induzida termicamente. As espumas termicamente sensíveis desmoronam imediatamente sob a exposição à

temperatura da pele e, conseqüentemente, as espumas termicamente sensíveis não podem ser aplicadas na mão e depois serem aplicadas na área afetada.

A espuma da presente invenção apresenta várias vantagens, quando comparada às composições espumosas hidroalcoólicas, conforme descrição no Pedido de Patente Internacional WO 2004/071479:

(1) Capacidade de Quebra: a espuma da presente invenção é termicamente estável. Ao contrário das composições hidroalcoólicas da técnica anterior, a espuma da presente invenção não “quebra rapidamente”, ou seja, não desmorona prontamente sob a exposição à temperatura ambiente do corpo. A capacidade de quebra sob tensão de cisalhamento da espuma é claramente vantajosa em relação à capacidade de quebra induzida termicamente, pois possibilita aplicação confortável e administração bem direcionada à área alvo.

(2) Ressecamento da pele e função de barreira epidérmica: os alcoóis de cadeia curta são conhecidos pelo fato de ressecarem a pele e prejudicarem a integridade da barreira epidérmica. Ao contrário disso, a inclusão de um agente formador de película, na composição espumosa da presente invenção, não provoca danos indesejáveis à barreira epidérmica.

(3) Irritabilidade: devido à falta de álcool e à melhoria na função da barreira epidérmica, elimina-se a irritabilidade da pele.

Outra propriedade da espuma da presente invenção é a sua gravidade específica, conforme medição sob a liberação do recipiente aerossol. Tipicamente, a gravidade específica das espumas é inferior a 0,12 g/ml, ou inferior a 0,10 g/ml, ou inferior a 0,08 g/ml, dependendo da composição das espumas e da concentração do agente propelente.

Agentes Ativos

Em uma modalidade da presente invenção, adiciona-se um agente ativo na composição espumosa de sacarídeo.

Os agentes ativos apropriados para serem utilizados na presente invenção incluem, mas não ficam limitados a: extratos fitoterápicos ativos, acaricidas, agentes de remoção de queratose e manchas senis, agentes alergênicos, agentes analgésicos, agentes analgésicos locais, agentes antiacne,

agentes antialérgicos, agentes antienvhecimento, agentes antibacterianos, agentes antibióticos, agentes antiqeimaduras, agentes anticancerígenos, agentes anticaspas, agentes antidepressivos, agentes antidermatites, agentes antiedêmicos, agentes anti-histamínicos, agentes anti-helmínticos, agentes anti-
 5 hiperqueratolíticos, agentes antiinflamatórios, agentes antiirritantes, agentes antilipêmicos, agentes antimicrobianos, agentes antimicóticos, agentes antiproliferativos, agentes antioxidantes, agentes anti-rugas, agentes antipruriginosos, agentes antipsoriáticos, agentes anti-rosáceas, agentes anti-seborréicos, agentes anti-sépticos, agentes antiinchaços, agentes antivirais,
 10 agentes antifungos, agentes adstringentes, agentes cardiovasculares tópicos, agentes quimioterapêuticos, agentes corticosteróides, agentes ácidos dicarboxílicos, agentes desinfetantes, agentes fungicidas, agentes reguladores de crescimento capilar, hormônios, hidroxíácidos, agentes imunossupressores, agentes imunorreguladores, agentes inseticidas, agentes repelentes de insetos,
 15 agentes queratolíticos, lactamas, metais, óxidos metálicos, agentes acaricidas, neuropeptídeos, agentes antiinflamatórios não-esteróides, agentes oxidantes, agentes pediculicidas, agentes para terapia fotodinâmica, agentes retinóides, agentes curativos, agentes escabicidas, agentes autobronzeadores, agentes branqueadores de pele, agente vasoconstritores, agentes vasodilatadores,
 20 vitaminas, derivados da vitamina D, agentes cicatrizantes e agentes removedores de verrugas. Como é de conhecimento dos especialistas versados na técnica, em algumas circunstâncias, um agente ativo específico pode ter mais de uma atividade, função ou efeito.

Propriedade higroscópica da composição

25 Uma substância higroscópica é uma substância que absorve, prontamente, água de seus arredores. Os microorganismos requerem água para crescer e reproduzir-se e tais exigências de água estão mais bem definidas em termos de atividade de água do substrato. A atividade de água de uma solução é expressa como $A_w = P/P_o$, sendo que P é a pressão do vapor da
 30 água da solução e P_o é a pressão do vapor da água pura à mesma temperatura. A adição de uma substância higroscópica a uma solução aquosa, na qual um microorganismo está crescendo, acarretará o efeito de redução da atividade de

água, com um efeito conseqüente no crescimento da célula. Cada microorganismo tem uma atividade de água limitada, abaixo da qual o microorganismo não crescerá, como, por exemplo, para *estreptococos*, *ldebsiella spp.*, *escherichia coli*, *clostridium perfringens* e *pseudomonas spp.*, o valor da
5 atividade de água é 0,95. Os estafilococos dourados (*staphylococcus aureus*) são muito resistentes e podem se desenvolver com uma atividade de água igual a 0,86.

A atividade de água de um produto pode ser determinada pela umidade relativa do ar que cerca a amostra, quando o ar e a amostra estão
10 em equilíbrio. A medição é executada por meio da colocação de uma amostra em um espaço fechado no qual pode acontecer o dito equilíbrio. Quando o dito equilíbrio acontece, a atividade de água da amostra e a umidade relativa do ar são iguais. A medição feita em equilíbrio é denominada umidade relativa de equilíbrio ou URE (em inglês, ERH). A relação entre a atividade de água e a
15 umidade relativa de equilíbrio está de acordo com a seguinte fórmula: atividade de água = umidade relativa de equilíbrio/100.

Vários tipos de instrumentos para medir a atividade de água estão disponíveis comercialmente. Um exemplo de instrumento para medir a atividade de água utiliza a tecnologia de ponto de orvalho em um espelho
20 resfriado, enquanto outros instrumentos medem a umidade relativa com sensores que mudam a capacidade ou a resistência elétrica. Os sacarídeos têm uma grande afinidade pela água e, conseqüentemente, eles exibem propriedades higroscópicas, e a concentração de sacarídeos determina a atividade de água do veículo. Conseqüentemente, a adição de sacarídeos à composição pode afetar
25 dramaticamente a atividade de água.

Em uma ou mais modalidades da presente invenção, o sacarídeo é incluído na composição espumosa da presente invenção a uma concentração suficiente para a obtenção de um índice de atividade de água da composição espumosa inferior a 0,9.

30 Em outras modalidades da presente invenção, a concentração da substância higroscópica na composição espumosa é selecionada para a obtenção de um índice de atividade de água que varia entre:

- (1) aproximadamente 0,8 e aproximadamente 0,9;
- (2) aproximadamente 0,7 e aproximadamente 0,8, e;
- (3) menos de aproximadamente 0,7.

A composição espumosa de sacarídeo da presente invenção com um índice de atividade de água menor do que aquele que pode suportar o crescimento microbiano pode ser utilizada para o tratamento tópico de doenças infecciosas superficiais.

Ao dispor uma composição espumosa de sacarídeo em uma embalagem pressurizada, ela fica isolada do ambiente até imediatamente antes de ser utilizada e, com isso, a atividade de água da composição da presente invenção é mantida. Comparativamente, outras formas de dosagem, como, por exemplo, soluções, cremes, loções, pomadas e algo do gênero, envolvem a abertura freqüente do fechamento da embalagem, resultando na absorção da água do ambiente circunvizinho e uma elevação subsequente da atividade de água (o que reduz a capacidade higroscópica do produto e, conseqüentemente, diminui o seu potencial antiinfectivo).

Por outro lado, uma embalagem pressurizada não permite que nenhuma umidade seja absorvida pelo preparado e, portanto, o caráter higroscópico da composição não pode ser danificado.

A composição de sacarídeo como o veículo de um agente antiinfectivo

Em uma ou mais modalidades, a composição de sacarídeo da presente invenção também contém um agente antiinfectivo selecionado do grupo que consiste em: um agente antibiótico, um agente antibacteriano, um agente antifúngico, um agente de controle de fungos, um agente antiviral e um agente antiparasítico.

Por intermédio da combinação do efeito antiinfectivo de uma composição de sacarídeo, que atua por meio de um mecanismo de desidratação, com um agente antiinfectivo adicional, que atua por meio de mecanismos alternados, obtém-se um efeito sinérgico e, conseqüentemente, obtém-se maior sucesso no tratamento.

As expressões "agente antibacteriano" e "agente antibiótico", como utilizadas no presente documento, incluem, mas não ficam limitadas a qualquer substância que seja destrutiva ou que iniba o crescimento de bactérias, ou a qualquer substância que tenha a capacidade de inibir o crescimento ou de destruir bactérias, e os agentes antibacterianos e os agentes antibióticos são utilizados no tratamento de doenças infecciosas.

Em uma ou mais modalidades da presente invenção, o agente antibiótico é selecionado do grupo que consiste em: antibiótico beta-lactâmico, aminoglicosídeo, antibiótico do tipo ansa, antraquinona, azol, metronidazol, antibiótico glicopéptidico, macrolídeo, eritromicina, clindamicina, antibiótico nucleosídeo, antibiótico peptídeo, polimixina B, antibiótico poliênico, antibiótico poliéter, antibiótico quinolônico, antibiótico esteróide, ácido fusídico, mupirocina, cloranfenicol, antibiótico sulfonamida, tetraciclina, metal antibiótico, partículas microcristalinas e nanocristalinas de prata, cobre, zinco, mercúrio, estanho, chumbo, bismuto, cádmio e cromo, um agente oxidante, iodato, iodo, periodato, hipoclorito, permanganato, uma substância que libere radicais livres e/ou oxigênio ativo, um agente antimicrobiano catiônico, um composto de amônio quaternário, uma biguanida, clorhexidina, uma triguanida, uma bisbiguanida, uma biguanida polimérica e um composto antibiótico que ocorra naturalmente, bem como análogos, derivados, sais, íons e complexos de tais substâncias.

A expressão "agente antifúngico", como utilizada no presente relatório, inclui, mas não fica limitada a qualquer substância que seja destrutiva ou que iniba o crescimento de fungos ou levedura, ou a qualquer substância que tenha a capacidade de inibir o crescimento ou destruir fungos e/ou levedura.

Em uma ou mais modalidades da presente invenção, o agente antifúngico é um agente que é útil para o tratamento de uma infecção fúngica superficial da pele, dermatofitoses, infecções causadas por dermatófitos do gênero *Microsporum*, *Trichophyton* e *Epidermophyton*, *Candidiasis*, *Oral Candidíase* (sapinhos), candidíase da pele e membrana mucosa genital, paroníquia por *Cândida*, que afeta a unha e o leito ungueal, candidíase genital e vaginal, que afeta os órgãos genitais e a vagina.

De forma inesperada, descobriu-se que uma composição de sacarídeo contendo uma droga antifúngica é mais eficaz do que outras composições que compreendem a mesma concentração do agente antifúngico, que não é higroscópico. Por outro lado, descobriu-se também que um agente antifúngico, que é conhecido por ser eficaz contra dermatófitos, mas não contra cândida, torna-se eficaz contra cândida quando é incluído em uma composição de sacarídeo, conforme descrição no presente relatório.

Não existe nenhuma restrição especial em relação aos agentes antifúngicos utilizados nas composições espumosas da presente invenção. A título de exemplo, os agentes antifúngicos preferidos e apropriados para serem utilizados na presente invenção são constituídos de políenos, como, por exemplo, natamicina, nistatina; alilamina, como, por exemplo, naftifina, terbinafina; imidazóis, como, por exemplo, bifonazol, clotrimazol, econazol, fenticonazol, cetoconazol, miconazol, oxiconazol, diazol; triazóis, como, por exemplo, fluconazol, itraconazol, terconazol, tolnaftato, ciclopirox, ácido undecilênico, sulbentina, griseofulvina, anfotericina B, flucitosina (5FC) e morfólinas, como, por exemplo, amorolfina e morfólinas relacionadas, bem como os derivados, sais e quaisquer combinações constituídas de tais substâncias a uma concentração terapeuticamente eficaz.

Qualquer agente antiviral conhecido, a uma concentração terapeuticamente eficaz, pode ser incorporado na composição da espuma, de acordo com uma ou mais modalidades da presente invenção.

Conseqüentemente, nas modalidades preferidas da presente invenção, é apresentada uma composição farmacêutica que compreende:

- (i) uma solução aquosa de sacarídeo;
- (ii) entre aproximadamente 0,2% e aproximadamente 5%, em peso, de um agente tensoativo.
- (iii) entre aproximadamente 0,01% e aproximadamente 5%, em peso, de pelo menos um agente polimérico selecionado do grupo que consiste em um agente bioadesivo, um agente gelificante, um agente formador de película e um agente de mudança de fase;

(iv) uma concentração terapeuticamente eficaz de um agente anti-infectivo, e;

(v). um agente propelente gasoso liquefeito ou comprimido, a uma concentração de aproximadamente 3% a aproximadamente 25% em peso da composição total.

Em uma ou mais modalidades da presente invenção, a composição farmacêutica também compreende um agente facilitador de penetração na pele.

Campos de Aplicações

10 O veículo espumoso da presente invenção é apropriado para o tratamento de qualquer superfície infectada.

Em uma ou mais modalidades da presente invenção, o veículo espumoso é apropriado para ser administrado na pele, em uma superfície corporal, em uma cavidade corporal ou em uma superfície da mucosa, como, por exemplo, mucosa da cavidade nasal, da boca, dos olhos, do canal auditivo, da vagina e do reto (denominada no presente relatório, de forma variada e alternada, como "área alvo").

Por meio da seleção de um agente ativo apropriado ou de uma combinação constituída de pelo menos dois agentes ativos, a composição espumosa da presente invenção é útil para o tratamento de um paciente animal ou humano doente, portador de qualquer uma das várias patologias dermatológicas, incluindo: dor dermatológica, inflamação dermatológica, acne, acne vulgar, acne inflamatória, acne não-inflamatória, acne fulminante, acne nodular papulopustulosa, acne conglobata, dermatite, infecções bacterianas da pele, infecções fúngicas da pele, infecções virais da pele, infecções parasitárias da pele, neoplasia cutânea, neoplasma cutâneo, prurido, celulite, linfangite aguda, linfadenite, erisipela, abscessos cutâneos, infecções subcutâneas necrosantes, síndrome da pele escaldada, foliculite, furúnculos, hidrosadenite supurativa, carbúnculos hemáticos, infecções paroníquias, erupções cutâneas, eritasma, impetigo, ectima, Infecções cutâneas por levedura, verrugas, molusco contagioso, traumas ou lesões na pele, doenças dermatológicas pós-operatórias ou pós-cirúrgicas, sarna, pediculose, larva migrans cutânea, eczemas, psoríase, pitíriase

rósea, liquen plano, pitíriase rubra pilar, edemas, eritema multiforme, eritema nodoso, granuloma anular, necrólise epidérmica, queimaduras solares, fotossensibilidade, pênfigo, penfigóide bolhoso, dermatite herpetiforme, queratose pilar, calosidade, calos, ictiose, úlceras cutâneas, necrose isquêmica, miliária, hiperidrose, marcas de nascença pigmentadas, sarcoma de Kaposi, melanoma, melanoma maligno, carcinoma basocelular, carcinoma de células escamosas, dermatite de contato causada pela trepadeira Poison Ivy (Hera Venenosa) e Poison Oak (Carvalho Venenosos), dermatite de contato, dermatite atópica, rosácea, púrpura, monilíase, candidíase, calvície, alopecia, síndrome de Behçet, colesteatoma, adipose dolorosa (doença de Dercum), displasia ectodérmica, sudorese gustativa, síndrome unha patela, lúpus, urticária, calvície, doença de Hailey-Hailey, queimaduras de pele de origem química ou térmica, esclerodermia, envelhecimento da pele, rugas, manchas de sol, fasciite necrosante, miosite necrosante, gangrena, cicatrizes e vitiligo.

Além disso, a composição espumosa da presente invenção é apropriada para o tratamento de uma doença de uma cavidade corporal ou da superfície da mucosa, como, por exemplo, mucosa do nariz, da boca, dos olhos, dos ouvidos, do sistema respiratório, da vagina ou do reto.

Exemplos não-limitadores de tais estados de doença incluem: infecção por clamídia, gonorréia, hepatite tipo B, herpes, HIV/AIDS, vírus do papiloma humano (HPV), verrugas genitais, vaginose bacteriana, candidíase, cancroide, granuloma inguinal, linfogranuloma venéreo, cervicite mucopurulenta (MPC), molusco contagioso, uretrites não gonocócicas (NGU), tricomoníase, doenças vulvares, vulvodinia, dor vulvar, infecção por levedura, distrofia vulvar, neoplasia intraepitelial vulvar (VIN), dermatite de contato, inflamação pélvica, endometrite, salpingite, ooforite, câncer genital, câncer cervical, câncer de vulva, câncer de vagina, secura da vagina, dispareunia, doença retal e anal, abscesso/fístula anal, câncer anal, fissura anal, verrugas anais, doença de Crohn, hemorróidas, prurido anal, *pruritus ani*, incontinência fecal, prisão de ventre, pólipos do cólon e reto.

Em uma modalidade da presente invenção, a composição é útil para o tratamento de uma infecção. Em uma ou mais modalidades da

presente invenção, a composição é indicada para o tratamento de uma infecção selecionada de um grupo que consiste em uma infecção bacteriana, uma infecção fúngica, uma infecção por levedura, uma infecção viral e uma infecção parasitária.

Em uma modalidade da presente invenção, a composição espumosa é útil para o tratamento de ferimentos, úlceras e queimaduras. Este tipo de uso é particularmente importante, pois a composição espumosa da presente invenção cria uma fina camada semi-oclusiva, que cobre o tecido danificado e permite a liberação de exsudados do tecido.

A composição espumosa da presente invenção também é adequada para a administração de um hormônio na pele ou em uma membrana mucosa ou em uma cavidade corporal, para a administração do hormônio no tecido do órgão alvo, em qualquer tipo de doença que responda ao tratamento com um hormônio.

A presente invenção é descrita com base nos exemplos abaixo. A presente invenção não fica limitada a tais exemplos e experimentos. Muitas variações serão sugeridas aos mesmos e tais variações estarão integralmente dentro do escopo das reivindicações em anexo.

Exemplo 1 – Composição Espumosa de Sacarídeo Contendo Sorbitol e Mel

	SOR1	SOR2	HON1
	% peso/peso	% peso/peso	% peso/peso
Sorbitol 70%	89,50	89,50	---
Mel	---	---	89,50
Steareth 2	2,00	---	---
Ceteth 2	---	2,00	2,00
Hidroetilcelulose	0,50	0,50	0,50
Propelente	8,00	8,00	8,00
Qualidade da Espuma	Boa	Boa	Boa

Após a liberação da lata aerossol, forma-se uma espuma de excelente qualidade (bolhas de tamanho muito pequeno). A espuma fica estável quando aplicada sobre a pele. Sob leve fricção, a espuma se espalha facilmente sobre a pele e é rapidamente absorvida.

Exemplo 2 – Composição Espumosa de Sacarídeo Contendo Agentes Ativos

Os seguintes agentes ativos foram incorporados nas formulações SOR1, SOR2 e HONI.

Terbinafina a 2%;
Miconazol a 1%;
Polivinilpirrolidona-Iodo a 5%
Acetato de Hidrocortisona a 0,1%
Dipropionato de clobetasol a 0,05%, e;
Clindamicina a 1%

Exemplo 3 – Estudo de Usabilidade

Comparação entre uma espuma, de acordo com a presente invenção, e um produto na forma de pomada

O objetivo deste estudo foi avaliar as propriedades de usabilidade do produto na forma de espuma da formulação SOR1", em comparação com um produto na forma de pomada. Os membros da equipe de estudo (n = 12) foram convidados a testar a usabilidade de dois produtos na forma de espuma, em comparação com um produto na forma de pomada, em relação aos seguintes parâmetros:

- Facilidade de aplicação
- Espalhamento uniforme
- Localização precisa
- Absorção da pele
- Resíduo oleoso
- Aspecto residual brilhante
- Pegajosidade

Os membros da equipe de estudo foram instruídos no sentido de avaliar uma série de parâmetros relativos à usabilidade dos produtos, bem como de classificar cada um dos produtos na forma de espuma, de acordo com a seguinte escala:

Classificação -3: o produto na forma de pomada é muito melhor que o produto na forma de espuma (Pomada >>>Espuma)

Classificação -2: o produto na forma de pomada é melhor que o produto na forma de espuma (Pomada >>>Espuma)

Classificação -1: o produto na forma de pomada é um pouco melhor que o produto na forma de espuma (Pomada >>>Espuma)

5 Classificação 0: o produto na forma de espuma é tão bom quanto o produto na forma de pomada (Espuma = Pomada)

Classificação +1: o produto na forma de pomada é um pouco melhor que o produto na forma de espuma (Pomada >>>Espuma)

10 Classificação +2: o produto na forma de espuma é melhor que o produto na forma de pomada (Espuma>>>Pomada)

Classificação +3: o produto na forma de espuma é muito melhor que o produto na forma de pomada (Espuma>>>Pomada)

O resultado médio da comparação indicou alta preferência pelo produto na forma de espuma, em todos os parâmetros de usabilidade,
15 conforme mostrado na tabela abaixo:

	Classificação Média
Facilidade de aplicação	1,4
Espalhamento uniforme	0,8
Localização precisa	0,3
Absorção da pele	2,4
Resíduo oleoso	1,2
Aspecto residual brilhante	1,2
Pegajosidade	1,1

REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO,

caracterizada pelo fato de compreender:

- (1) água;
- 5 (ii) um sacarídeo;
- (iii) entre aproximadamente 0,2% e aproximadamente 5%, em peso, de um agente tensoativo;
- (iv) entre aproximadamente 0,01% e aproximadamente 5%, em peso, de pelo menos um agente polimérico selecionado do grupo que
- 10 consiste em um agente bioadesivo, um agente gelificante, um agente formador de película e um agente de mudança de fase, e;
- (vi). um agente propelente gasoso liquefeito ou comprimido, a uma concentração de aproximadamente 3% a aproximadamente 25%, em peso, da composição total.

15 **2. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO,** de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de o sacarídeo ser selecionado do grupo que consiste em um monossacarídeo, um dissacarídeo, um oligossacarídeo e um álcool de açúcar; sendo que o dito sacarídeo compreende mel.

20 **3. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO,** de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de também compreender:

- um agente adjuvante de formação de espuma selecionado do grupo que consiste em um álcool graxo de cadeia longa e um ácido graxo de cadeia longa, e/ou;
- 25 - um solvente hidrofóbico, e/ou;
- um aditivo selecionado do grupo que consiste em um agente queratolítico e um solvente polar, e/ou;
- um agente ativo selecionado do grupo que consiste em extratos fitoterápicos ativos, acaricidas, agentes de remoção de queratose e
- 30 manchas senis, agentes alergênicos, agentes analgésicos, agentes analgésicos locais, agentes antiacne, agentes antialérgicos, agentes antienvhecimento, agentes antibacterianos, agentes antibióticos, agentes antieimaduras, agentes anticancerígenos, agentes anticaspas, agentes antidepressivos, agentes antidermatites, agentes antiedêmicos, agentes anti-histamínicos, agentes anti-

helmínticos, agentes anti-hiperqueratolíticos, agentes antiinflamatórios, agentes antiirritantes, agentes antilipêmicos, agentes antimicrobianos, agentes antimicóticos, agentes antiproliferativos, agentes antioxidantes, agentes anti-rugas, agentes antipruriginosos, agentes antipsoriáticos, agentes anti-rosáceas, 5 agentes anti-seborréicos, agentes anti-sépticos, agentes antiinchacos, agentes antivirais, agentes antileveduras, agentes adstringentes, agentes cardiovasculares tópicos, agentes quimioterapêuticos, agentes corticosteróides, agentes ácidos dicarboxílicos, agentes desinfetantes, agentes fungicidas, agentes reguladores de crescimento capilar, hormônios, hidroxiácidos, agentes imunossuppressores, 10 agentes imunorreguladores, agentes inseticidas, agentes repelentes de insetos, agentes queratolíticos, lactamas, metais, óxidos metálicos, agentes acaricidas, neuropeptídeos, agentes antiinflamatórios não-esteróides, agentes oxidantes, agentes pediculicidas, agentes para terapia fotodinâmica, agentes retinóides, agentes escabicidas, agentes autobronzeadores, agentes branqueadores de pele, 15 agente vasoconstritores, agentes vasodilatadores, vitaminas, derivados da vitamina D, agentes cicatrizantes e agentes removedores de verrugas.

4. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizada pelo fato de o agente queratolítico ser selecionado do grupo que consiste em uréia, um ácido alfa-hidróxi, ácido 20 láctico, fenol, resorcimol, ácido salicílico, uma enzima queratolítica, uma enzima proteolítica e papaína.

5. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de a composição de sacarídeo apresentar-se sob a forma de uma emulsão do tipo óleo em água, 25 sendo que o balanço hidrofílico-lipofílico (HLB) do agente tensoativo varia entre aproximadamente 9 e aproximadamente 14, bem como pelo fato de a composição de sacarídeo apresentar-se na forma de uma emulsão do tipo água em óleo, sendo que o balanço hidrofílico-lipofílico (HLB) do agente tensoativo varia entre aproximadamente 2 e aproximadamente 9.

30 **6. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO**, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de a composição ser higroscópica, e/ou; pelo fato de a concentração do sacarídeo ser selecionada para a obtenção de um índice de atividade de água que apresenta as seguintes variações:

- (1) entre aproximadamente 0,8 e aproximadamente 0,9;
- (2) entre aproximadamente 0,7 e aproximadamente 0,8, e;
- (3) menos de aproximadamente 0,7.

7. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO, de acordo com a reivindicação 6, caracterizada pelo fato de também compreender uma concentração terapeuticamente eficaz de um agente anti-infectivo.

8. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO, de acordo com a reivindicação 7, caracterizada pelo fato de o agente anti-infectivo ser selecionado do grupo que consiste em: um agente antibiótico, um agente antibacteriano, um agente antifúngico, um agente de controle de levedura, um agente antiviral e um agente antiparasitário.

9. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO, de acordo com a reivindicação 8, caracterizada pelo fato de o agente antibiótico ser selecionado do grupo que consiste em: antibiótico beta-lactâmico, aminoglicosídeo, antibiótico do tipo ansa, antraquinona, azol, metronidazol, antibiótico glicopéptido, macrolídeo, eritromicina, clindamicina, antibiótico nucleosídeo, antibiótico peptídeo, polimixina B, antibiótico poliênico, antibiótico poliéter, antibiótico quinolônico, antibiótico esteróide, ácido fusídico, mupirocina, cloranfenicol, antibiótico sulfonamida, tetraciclina, metal antibiótico, partículas microcristalinas e nanocristalinas de prata, cobre, zinco, mercúrio, estanho, chumbo, bismuto, cádmio e cromo, um agente oxidante, iodato, iodo, periodato, hipoclorito, permanganato, uma substância que libere radicais livres e/ou oxigênio ativo, um agente antimicrobiano catiônico, um composto de amônio quaternário, uma biguanida, clorhexidina, uma triguanida, uma bisbiguanida, uma biguanida polimérica e um composto antibiótico que ocorra naturalmente, bem como análogos, derivados, sais, íons e complexos de tais substâncias, e/ou; pelo fato de o agente antifúngico ser um agente útil para o tratamento de infecções causadas por dermatófitos do gênero *Microsporum*, *Trichophyton* e *Epidermophyton*, *Candidiasis*, *Oral Candidiase* (sapinhos), fungos e *Candida*, e/ou; pelo fato de o agente antifúngico ser selecionado do grupo que consiste em: polieno, natamicina, nistatina; alilamina, naftifina, terbinafina; imidazol, bifonazol, clotrimazol, econazol, fenticonazol, quetoconazol, miconazol, oxiconazol; diazol, triazol, fluconazol, itraconazol, terconazol, tolnaftato, ciclopirox, ácido undecilênico, sulbentina, griseofulvina, anfotericina B, flucitosina (5FC), um

composto de morfolina, amorolfina e morfolinias relacionadas, bem como seus análogos, derivados e sais, e qualquer combinação constituída de tais substâncias, a uma concentração terapeuticamente eficaz.

5 **10. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO** para ser utilizada como um medicamento, na fabricação de um medicamento, para o tratamento de uma doença de uma área alvo, caracterizada pelo fato de compreender:

10 - a administração da dita composição espumosa de sacarídeo, em uma área alvo em necessidade de tratamento, sendo que a dita área alvo é selecionada do grupo que consiste em pele, superfície corporal, cavidade corporal ou superfície da mucosa, como, por exemplo, mucosa do nariz, da boca, dos olhos, dos ouvidos, da vagina ou do reto;

 - uma composição espumosa de sacarídeo que compreende:

15 (i) água;

 (ii) um sacarídeo;

 (iii) entre aproximadamente 0,2% e aproximadamente 5%, em peso, de um agente tensoativo;

20 (iv) entre aproximadamente 0,01% e aproximadamente 5%, em peso, de pelo menos um agente polimérico selecionado do grupo que consiste em um agente bioadesivo, um agente gelificante, um agente formador de película e um agente de mudança de fase, e;

25 (v) um agente propelente gasoso liquefeito ou comprimido, a uma concentração de aproximadamente 3% a aproximadamente 25%, em peso, da composição total

 Sendo que:

 - a dita doença compreende uma infecção;

 - a dita infecção é selecionada de um grupo que consiste em uma infecção bacteriana, uma infecção fúngica, uma infecção por levedura,

30 uma infecção viral e uma infecção parasitária, e/ou;

 - a dita doença é selecionada de um grupo que consiste em ferimentos, úlceras e queimaduras, e/ou;

 - a dita doença é selecionada de um grupo que consiste em dor dermatológica, inflamação dermatológica, acne, acne vulgar, acne

inflamatória, acne não-inflamatória, acne fulminante, acne nodular
 papulopustulosa, acne conglobata, dermatite, infecções bacterianas da pele,
 infecções fúngicas da pele, infecções virais da pele, infecções parasitárias da
 pele, neoplasia cutânea, neoplasma cutâneo, prurido, celulite, linfangite aguda,
 5 linfadenite, erisipela, abscessos cutâneos, infecções subcutâneas necrosantes,
 síndrome da pele escaldada, foliculite, furúnculos, hidrosadenite supurativa,
 carbúnculos hemáticos, infecções paroníquias, erupções cutâneas, eritasma,
 impetigo, ectima, infecções cutâneas por levedura, verrugas, molusco contagioso,
 traumas ou lesões na pele, doenças dermatológicas pós-operatórias ou pós-
 10 cirúrgicas, sarna, pediculose, larva migrans cutânea, eczemas, psoríase, pitíriase
 rósea, líquen plano, pitíriase rubra pilar, edemas, eritema multiforme, eritema
 nodoso, granuloma anular, necrólise epidérmica, queimaduras solares,
 fotossensibilidade, pênfigo, penfigóide bolhoso, dermatite herpetiforme, queratose
 pilar, calosidade, calos, ictiose, úlceras cutâneas, necrose isquêmica, miliária,
 15 hiperidrose, marcas de nascença pigmentadas, sarcoma de Kaposi, melanoma,
 melanoma maligno, carcinoma basocelular, carcinoma de células escamosas,
 dermatite de contato causada pela trepadeira Poison Ivy (Hera Venenosa) e
 Poison Oak (Carvalho Venenosos), dermatite de contato, dermatite atópica,
 rosácea, púrpura, monilíase, candidíase, calvície, alopecia, síndrome de Behçet,
 20 colesteatoma, adipose dolorosa (doença de Dercum), displasia ectodérmica,
 sudorese gustativa, síndrome unha patela, lúpus, urticária, calvície, doença de
 Hailey-Hailey, queimaduras de pele de origem química ou térmica, esclerodermia,
 envelhecimento da pele, rugas, manchas de sol, fasciite necrosante, miosite
 necrosante, gangrena, cicatrizes, vitiligo, infecção por clamídia, gonorréia,
 25 hepatite tipo B, herpes, HIV/AIDS, vírus do papiloma humano (HPV), verrugas
 genitais, vaginose bacteriana, candidíase, cancroide, granuloma inguinal,
 linfogranuloma venéreo, cervicite mucopurulenta (MPC), molusco contagioso,
 uretrites não gonocócicas (NGU), tricomoniase, doenças vulvares, vulvodinia, dor
 vulvar, infecção por levedura, distrofia vulvar, neoplasia intraepitelial vulvar (VIN),
 30 dermatite de contato, inflamação pélvica, endometrite, salpingite, ooforite, câncer
 genital, câncer cervical, câncer de vulva, câncer de vagina, secura da vagina,
 dispareunia, doença retal e anal, abscesso/fístula anal, câncer anal, fissura anal,
 verrugas anais, doença de Crohn, hemorróidas, prurido anal, *pruritus ani*
 incontinência fecal, prisão de ventre, pólipos do cólon e reto.

11. COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO, de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, caracterizada pelo fato de a concentração do sacarídeo na composição espumosa variar entre aproximadamente 50% e aproximadamente 80%.

RESUMO

“COMPOSIÇÃO ESPUMOSA DE SACARÍDEO”, trata-se a presente invenção de uma composição espumosa contendo um sacarídeo, para ser utilizada no tratamento de diversas doenças, que compreende: água; um
5 sacarídeo; entre aproximadamente 0,2% e aproximadamente 5%, em peso, de um agente tensoativo; entre aproximadamente 0,01% e aproximadamente 5%, em peso, de pelo menos um agente polimérico selecionado do grupo que consiste em um agente bioadesivo, um agente gelificante, um agente formador de película e um agente de mudança de fase, e; um agente propelente gasoso liquefeito ou
10 comprimido, a uma concentração que varia entre aproximadamente 3% e aproximadamente 25%, em peso, da composição total.