



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

(21) **PI 0721862-1 A2**

(22) Data de Depósito: 09/07/2007  
(43) Data da Publicação: 05/03/2013  
(RPI 2200)



(51) *Int.Cl.:*  
A61K 8/44  
A61K 8/46  
A61K 8/49  
A61Q 17/04

(54) **Título:** SAIS SOLÚVEIS ESTÁVEIS DE ÁCIDO FENILBENZIMIDAZOL SULFÔNICO EM PHS EM OU ABAIXO DE 7,0

(73) **Titular(es):** Symrise GMBH & CO. KG

(72) **Inventor(es):** Jürgen Claus, William Johncock

(74) **Procurador(es):** Dannemann, Siemsen, Bigler & Ipanema Moreira

(86) **Pedido Internacional:** PCT EP2007056995 de 09/07/2007

(87) **Publicação Internacional:** WO 2007/135196 de 29/11/2007

(57) **Resumo:** SAIS SOLÚVEIS DE ÁCIDO FENILBENZIMIDAZOL SULFÔNICO EM pHs EM OU ABAIXO DE 7,0. A presente invenção refere-se a preparações, particularmente preparações cosméticas ou farmacêuticas/dermatológicas, contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico (isto é, ácido 2-fenilbenzimidazol-5-sulfônico) neutralizado com aminoácidos básicos tais como arginina, linsina, ornitina e histidina de forma que a pH da preparação possa estar em ou abaixo de 7,0 sem incorrer a cristalização do ácido fenilbenzimidazol sulfônico.

**Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "SAIS SOLÚVEIS ESTÁVEIS DE ÁCIDO FENILBENZIMIDAZOL SULFÔNICO EM pHs EM OU ABAIXO DE 7,0".**

A presente invenção refere-se a preparações, particularmente  
5 cosméticas ou farmacêuticas/dermatológicas contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico (isto é, ácido 2-fenilbenzimidazol-5-sulfônico) neutralizadas com aminoácidos básicos tais como arginina, lisina, ornitina e histidina de forma que o pH da preparação possa estar em ou abaixo de 7,0 sem incorrer cristalização do ácido fenilbenzimidazol sulfônico.

10 Raios UV são classificados de acordo com comprimento de onda como raios UVA (320-400 nm, UVA-I: 340-400nm, UVA-II: 320-340 nm) ou raios UVB (280-320 nm). Raios UV podem causar dano agudo e crônico à pele, o tipo de dano dependendo do comprimento de onda de radiação. Por exemplo, radiação UVB pode causar queimadura solar (eritema) prolongando-se para queimadura mais severa da pele; redução em atividades de en-  
15 zima, debilitação do sistema imune, distúrbios da estrutura do DNA e mudanças na membrana celular são da mesma forma conhecidos como efeitos prejudiciais de raios UVB. Raios UVA penetram em camadas mais profundas da pele em que eles podem acelerar o processo de envelhecimento da pele. A  
20 radiação UVA-II de onda mais curta adicionalmente contribui para o desenvolvimento de queimadura solar. Além disso, radiação UVA pode ativar reações a pele fototóxicas ou fotoalérgicas. Irradiação muito frequente e desprotegida da pele por luz solar leva a uma perda de elasticidade da pele e a desenvolvimento aumentado de rugas. Em casos extremos, mudanças patogê-  
25 nicas na pele estendendo a câncer de pele são observadas.

Para atenuar estes efeitos negativos de radiação UV materiais que absorvem ou refletem luz UV, geralmente chamados absorventes de UV, são usados em preparações cosméticas ou farmacológicas. Os absorventes de UV são classificados como absorventes de UVA e UVB  
30 dependendo do local de sua absorção máxima; se um absorvente de UV absorver UVA e UVB, é referido como um absorvente de faixa ampla de UV-A/B.

Produtos de proteção solar modernos contêm misturas de filtros de UV para absorver radiação UVB e UVA e há muita pesquisa feita para encontrar novos absorventes de UV, porém, isto é muito dispendioso não apenas para o custo do esforço de R&D mas para o teste toxicológico exten-

5 so e processo de registro requerido para permitir que os novos filtros sejam usados. É portanto desejável que a maneira atualmente permitiu que materiais de absorção de UV seguros e eficazes usados para preparações cosméticas ou farmacológicas sejam extensos. Neste caso, um dos materiais de absorção de UVB mais eficientes que estão em uso comercial desde 1934,

10 ácido fenilbenzimidazol sulfônico, tem uma desvantagem principal do modo que é formulado atualmente. É muito insolúvel em água (0,25% p/p); portanto deve ser neutralizado com uma base dura, tal como por exemplo, porém não limitado a, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio, ou com aminas, tal como por exemplo porém não limitado a, trietanolamina ou

15 aminometilpropanol ou trisidroxiaminometano, para tornar o filtro de UV solúvel em uma preparação cosmética ou farmacológica. Importaneamente, se o ácido fenilbenzimidazol sulfônico não for suficientemente neutralizado, ele formará cristais na preparação cosmética ou farmacológica (vide figura 1) tornando-a menos eficaz e dando às preparações uma sensação arenosa ou

20 granulosa inaceitável. Formação de cristal começa em pH 7,0; geralmente, o pH de uma formulação cosmética compreendendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico tem que permanecer acima de 6,8 para prevenir o ácido livre de recristalisar (W. Johncock, Cosmetic & Toiletries Magazine, setembro de 1999, páginas 75-82). Esta restrição preveniu o uso de ácido

25 fenilbenzimidazol sulfônico em formulações com pH em ou abaixo de 7,0, em particular nas muitas formulações de preparações cosméticas ou farmacológicas com um pH de 5,5 a 7,0 e 6,0 a 7,0. É portanto desejável encontrar uma maneira que permite formular preparações cosméticas ou farmacológicas com ácido fenilbenzimidazol sulfônico em um pH de ou abaixo de 7,0

30 para ampliar sua aplicação.

Patente US 6.153.176 indicou que formulações de pH baixo contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico poderiam ser preparada em que

75 % a 95 % dos ácidos permanecem em sua forma não neutralizadas, porém os autores não indicaram se os ácidos recristalizaram ou não. Nos exemplos de formulação cedidos na patente constatou-se que o ácido de fato recristalizou.

5 Surpreendentemente e inesperadamente, constatou-se que quando aminoácido básico, preferivelmente, porém não restringido a, arginina, histidina, ornitina e lisina ou seus derivados são usados para neutralizar ácido fenilbenzimidazol sulfônico, o pH pode ser levado para abaixo de 7,0 e até tão baixo quanto 5,5, em que melhor estabilização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico em composições cosméticas é obtida por um pH até 6,0 sem causar recristalização do ácido fenilbenzimidazol sulfônico. Estabilização no significado da presente invenção é obtida quando uma formulação compreendendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico (todo o ácido fenilbenzimidazol sulfônico estando originalmente na forma não cristalina, preferivelmente dissolvida) é livre de cristais de ácido fenilbenzimidazol sulfônico pelo menos 10 depois do armazenamento da formulação a 20°C durante dois dias ou mais, preferivelmente durante cinco dias ou mais. O ponto isoelétrico de outros aminoácidos (vide tabela 1) impede a formação de sais quando simplesmente misturados com ácido fenilbenzimidazol sulfônico.

20 **Tabela 1. Pontos isoelétricos e valores de pK de alguns aminoácidos básicos preferidos.**

Aminoácido	Ponto Isoelétrico	pK <sub>1</sub> (α-COOH)	pK <sub>2</sub> (α- <sup>+</sup> NH <sub>3</sub> )
Histidina	7,60	1,80	9,33
Lisina	9,60	2,16	9,06
Arginina	10,76	1,82	8,99

25 EP 1 325 735 ensina o uso da arginina de aminoácido básico e seus derivados como um precursor de monóxido de nitrogênio (NO) para promover melanogênese em produtos de cuidado de pele fotoprotetores. Ela não ensina o uso de arginina ou seus derivados como uma base adequada para neutralizar ácido fenilbenzimidazol sulfônico para obter um pH abaixo

de 7,0.

EP 0 802 783 ensina o uso da combinação de arginina ou seus sais, amidas ou ésteres com ácido fólico, ureia e antioxidantes com ou sem a presença de materiais de absorção de UV para a profilaxia e/ou tratamento  
5 de pele seca e escamosa e de pele velha, em particular de pele danificada por envelhecimento endógeno ou cronológico. Não ensina o uso de arginina ou seus derivados como uma base adequada para neutralizar ácido fenilbenzimidazol sulfônico para obter um pH abaixo de 7,0.

FF 2 791 564 ensina que em contraste ao uso de ácido azelaico  
10 sozinho, quando ácido azelaico é neutralizado com arginina ou lisina em um pH entre 5 e 7 ele obtém propriedades antioxidativas e é útil para proteger a pele contra estresse oxidativo induzido por UV. FF 2791 564 não ensina o uso de arginina ou seus derivados como uma base adequada para neutralizar ácido fenilbenzimidazol sulfônico para obter um pH abaixo de 7,0.

15 US 6.365.167 ensina o uso de arginina neutralizada para ácido aminobenzoico (PABA) para tratar feridas, dilacerações, queimaduras e úlceras de pele humana e animal. O uso de arginina não é para melhorar a solubilidade de PABA e, em particular, a patente não ensina o uso de arginina para tornar sais de PABA solúveis em pHs abaixo de 7,0, nem ensinam o  
20 uso de arginina ou seus derivados como uma base adequada para neutralizar ácido fenilbenzimidazol sulfônico para obter um pH abaixo de 7,0.

KR 900000847 B ensina o uso de arginina com p-aminobenzoato, salicilato, cinamato e filtros de UV de benzofenonona, porém não ácido fenilbenzimidazol sulfônico, para controlar a cor de composi-  
25 ções cosméticas quando exposta à luz UV. O pH destas composições é controlado pelo uso de ácido cítrico ou trietanolamina em pH 5,0 a 8,0. Arginina não é usada como um agente de neutralização neste caso.

EP 0 711 539 ensina o uso de aminas incluindo trietanolamina e aminoácidos para neutralizar ácido salicílico e seus derivados para os tornar  
30 mais solúveis em uma formulação e como emulsificadores alternativos para uso tradicional. O documento não indica que o uso de aminoácidos básicos melhora a solubilidade de ácido salicílico e seus derivados sobre outras ami-

nas tais como trietanolamina e trisidroximetilaminometano, entretanto eles indicam que a emulsão é mais fina quando lisina for usada como a base. A invenção não ensina que o uso de aminoácidos básicos preveniria a recristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico.

5 GB 2 181 647 ensina o uso de arginina e lisina em associação com gordura para produzir substâncias que têm propriedades anti-irritação, antioxidantes e emulsificantes. Ela não ensina que o uso de aminoácidos básicos preveniria a recristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico.

10 JP 61-030567 ensina o uso de aminoácidos básicos, lisina, arginina, ornitina, histidina para estabilizar ureia contra decomposição, ela não ensina que o uso de aminoácidos básicos preveniria a recristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico.

15 DE 101 41 789 ensina o uso de histidina em formulações cosméticas para prevenir perda de ácido urocânico da pele. A patente menciona que as formulações podem conter filtros UVA e UVB incluindo sais solúveis em água sulfonados tais como os sais de sódio, potássio ou trietanolamina de ácido fenilbenzimidazol sulfônico. Histidina não é usada nas formulações como um agente de neutralização na formulação desde que as quantidades de histidina usadas (0,7 a 0,4 equivalentes) estejam bastante abaixo daquelas para neutralizar ácido fenilbenzimidazol sulfônico em um pH de 6,0 a 7,0. O único exemplo de formulação na patente que indica um pH é indicado no exemplo 9, que não contém qualquer filtro de UV. A patente não ensina o uso de histidina para prevenir a recristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico em pHs abaixo de 7,0.

25 GB 1 500 390 descreve o uso de aminoácidos básicos para neutralizar soluções aquosas de polímeros de éter vinílico/anidrido maleico em um pH de 3 a 9 para evitar irritação à pele associada a outras bases tal como bases minerais ou trietanolamina, ela não ensina que o uso de aminoácidos básicos preveniria a recristalização de ácido fenilbenzimidazolsulfônico.

30

DE 197 13 776 A1 descreve composições compreendendo (a) um ou mais filtros de UV compreendendo um ou mais ácidos sulfônicos ou

grupos sulfonados e (b) aminoácidos básicos. Tais composições têm um SPF aumentado (fator de proteção solar), resistência à água melhorada e particularmente uma estabilidade mais alta na presença de filtros de UV sulfonados (em particular em O/A-emulsões); o uso de aminoácidos básicos para alcançar uma estabilidade mais alta de emulsões é da mesma forma descrito, em particular na presença de filtros UV sulfonados.

Para comparação, as emulsões de exemplos 1, 3 e 4 de DE 197 13 776 foram preparadas. Emulsões de exemplos 1 e 3 de DE 197 13 776 como tal foram estáveis. As seguintes outras observações foram feitas:

exemplo 1: pH = 5,9; ácido fenilbenzimidazol sulfônico não foi dissolvido completamente; cristais de ácido fenilbenzimidazol sulfônico estavam presentes ainda ao aquecer a formulação a 95°C;

exemplo 3: pH = 5,4; ácido fenilbenzimidazol sulfônico recristalizado da emulsão depois de dois dias a 20°C;

exemplo 4: pH = 4,0 (a 83°C), a fase de água separada, recristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi observado

Desse modo, DE que 197 13 776 A1 não ensina um modo seguro para estabilizar ácido fenilbenzimidazol sulfônico. Surpreendentemente, foi agora constatado que aminoácidos básicos podem ser usados como um agente de neutralização em cosméticas para parcialmente neutralizar ácidos fenilbenzimidazol sulfônicos em valores de pH na faixa dentre 5,5 a 7,0 e particularmente de 6,0 a 7,0 (medido a 25°C), que previne a recristalização esperada de ácido fenilbenzimidazol sulfônico nestes pHs.

A presente invenção refere-se a formulações cosméticas tendo um valor de pH na faixa dentre 5,5 a 7,0, preferivelmente dentre 6,0 a ou abaixo de 7,0, e mais preferivelmente na faixa de 6,0 a 6,8, compreendendo (i) 1 - 8% em peso, preferivelmente 1 - 5% em peso, de ácido fenilbenzimidazol sulfônico, e (ii) um total de pelo menos 50% em peso, preferivelmente 60 - 150% em peso, de um ou mais aminoácidos básicos, com base na quantidade de ácido fenilbenzimidazol sulfônico (i).

Preferivelmente, o um ou mais aminoácido básico são selecio-

nados a partir do grupo que consiste em arginina, lisina, histidina e ornitina.

Preferivelmente, o valor de pH de uma formulação cosmética, dermatológica ou farmacêutica de acordo com a invenção está nas seguintes faixas:

5 quando arginina é compreendida na formulação: pH dentre 6,0 a abaixo de 7,0, preferivelmente a 6,8;

quando lisina é compreendida na formulação: pH de 6,2 a abaixo de 7,0, preferivelmente 6,3 a abaixo de 7,0, e mais preferivelmente 6,3 a 6,8;

10 quando histidina é compreendida na formulação: pH de 6,0 a abaixo de 7,0, preferivelmente a 6,8; e

quando ornitina é compreendida na formulação: pH de 6,2 a abaixo de 7,0, preferivelmente a 6,8.

Em uma modalidade preferida, preparações cosméticas e/ou farmacêuticas da invenção compreendem ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos como descrito acima em combinação com um ou mais outros absorventes de UV, preferivelmente uma fração total de absorventes de UV na faixa de 0,1% a 40% em peso, mais preferivelmente na faixa de 0,2% a 30% em peso e mais preferivelmente na faixa 0,5% a 20% em peso, com base no peso total da preparação.

20 Em uma outra modalidade preferida uma preparação cosmética e/ou farmacêutica da invenção, especialmente uma preparação dermatologicamente ativa, compreende uma quantidade total de filtros de UV e/ou pigmentos inorgânicos tal que a preparação da invenção tem um fator de proteção solar maior do que ou igual a 2 (preferivelmente maior do que ou igual a 25 5). Estes protetores solares são adequados para proteger a pele e cabelo.

Outros agentes fotoprotetores adequados (absorventes de UV) são, por exemplo, absorventes de UV orgânicos da classe de ácido 4-aminobenzoico e derivados, derivados de ácido salicílico, derivados de benzofenona, derivados de dibenzoilmetano, difenilacrilatos, ácido 3-imidazol-4-ilacrílico e seus ésteres, derivados de benzofurano, derivados de benzilidenomalonato, absorventes de UV poliméricos contendo um ou mais radicais de organossilicone, derivados de ácido cinâmico, derivados de cânfora, deri-

vados de trianilino-s-triazina, derivados de 2-hidroxifenilbenzotriazol, derivados de ácido fenil dibenzimidazolsulfônico e sais dos mesmos, antranilato de mentíla, derivados de benzotriazol, derivados de indol.

Os absorventes de UV especificados abaixo, que podem ser usados adicionalmente para o propósito da presente invenção são preferidos, porém claro que não são limitantes.

Tais filtros de UV preferidos são como se segue:

Filtros UV-B tais como, por exemplo,:

- ácido p-aminobenzoico
- 10 • p-aminobenzoato de etila (25 mols) etoxilado
- p-dimetilaminobenzoato de 2-etil-hexila
- p-aminobenzoato de etila (2 mols) N-propoxilados
- p-aminobenzoato de glicerol
- salicilato de homomentíla (Homossalato) (Neo Heliopan®HMS)
- 15 • salicilato de 2-etil-hexila (Neo Heliopan®OS)
- salicilato de trietanolamina (Neo Heliopan®TS)
- salicilato de 4-isopropilbenzíla
- antranilato de mentíla (Neo Heliopan®MA)
- di--isopropilcinamato de etila
- 20 • p-metoxicinamato de 2-etil-hexila (Neo Heliopan®AV)
- di--isopropilcinamato de metíla
- p-metoxicinamato de isoamíla (Neo Heliopan®E 1000)
- sal de dietanolamina de ácido p-metoxicinâmico
- p-metoxicinamato de isopropíla
- 25 • metil sulfato de 3-(4'-trimetilamônio)benzilidenobornan-2-ona
- Ácido  $\beta$ -imidazol-4(5)-acrílico (ácido urocânico)
- 3-(4'-sulfo)benzilidenobornan-2-ona e sais
- 3-(4'-metilbenzilideno)-d,l-cânfora (Neo Heliopan®MBC)
- 3-benzilideno-d,l-cânfora
- 30 • polímero de N-[(2 e 4)-[2-(oxoborn-3-ilideno)metil]benzil]acrilamida
- 4,4'-((6-(4-(1,1-dimetil)aminocarbonil)fenilamino(-1,3,5-triazina-2,4-di--il)di--imino(bis(éster 2-etilexílico de ácido benzoico) (Uvasorb®HEB)

- benzilidenomalonato-polissiloxano (Parsol®SLX)
  - dimetoxicinamato de etilexanoato de glicerila
  - salicilato de dipropileno glicol
  - 4,4',4''-(1,3,5-triazina-2,4,6-triiltriimino)tribenzoato de tris(2-etil-hexila) (Uviniul®T150)
  - Benzilideno Butirolactonas descritas em EP 1008593
  - Compostos de benzilideno-β-dicarbonila descritos em WO 2005/107692
- filtros de ampla banda tais como, por exemplo,:
- 2-ciano-3,3-difenilacrilato 2-etil-hexil (Neo Heliopan®303)
  - 2-ciano-3,3'-difenilacrilato de etila
  - hidróxi-4-metoxibenzofenona (Benzofenona-3, Oxibenzona) (Neo Heliopan® BB)
  - (benzofenona-4, sulisobenzona) de ácido 2-hidróxi-4-metoxibenzofenona-5-sulfônico e seus sais
  - 2,2'-di--idróxi-4,4'-dimetóxi-5,5'-dissulfobenzofenona de dissódio
  - fenol, -(2H-benzotriazol-2-il-4-metil-6-(2-metil-3-(1,3,3,3-tetrametil-1-(trimetilsilil)óxi)dissiloxianil)propila), (Mexoril®XL)
  - 2,2'-metilenobis(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol), (Tinosorb®M)
  - 2,4-bis(4-(2-etil-hexilóxi)-2-hidroxifenil(-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis[{{4-(2-etil-hexilóxi)-2-hidroxi(fenil(-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, (Tinosorb®S)
  - Sal de 2,4-bis[{{4-(3-sulfonato)-2-hidroxipropilóxi)-2-hidróxi} fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina de sódio
  - 2,4-bis[{{3-(2-propilóxi)-2-hidroxipropilóxi)-2-hidroxi} fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis[{{4-(2-etil-hexilóxi)-2-hidróxi} fenil]-6-[4-(2-metoxietil-carbonil)fenilamino]-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis[{{4-(3-(2-propilóxi)-2-hidroxipropilóxi)-2-hidróxi} fenil]-6-[4-(2-etilcarboxil) fenilamino]-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis[{{4-(2-etil-hexilóxi)-2-hidróxi} fenil]-6-(1-metilpirrol-2-il)-1,3,5-triazina
  - 2,4-bis[{{4-tris(trimetilsiloxisililpropilóxi)-2-hidróxi} fenil]-6-(4-metoxifenil)-

1,3,5-triazina

- 2,4-bis[4-(2'-metilpropenilóxi)-2-hidróxi]fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina

- 2,4-bis[4-(1',1',1',3',5',5',5'-heptametilsiloxi-2'-metilpropilóxi)-2-hidróxi]fenil]-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina.

Filtros de UV-A tais como, por exemplo:

- Ácido tereftalilidenodibornanossulfônico e sais (Mexoril®SX)
- 4-t-butil-4'-metoxidibenzoilmetano (avobenzona) (Neo Heliopan®357)
- 2,2'-(1,4-fenileno)bis ácido (1H-benzimidazol-4,6-dissulfônico), sal monossódico (Neo Heliopan®AP)
- 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil)benzoato de hexila (Uvinul® A Plus)
- 4-isopropildibenzoilmetano
- antranilato de mentíla (Neo Heliopan®MA)
- compostos de indanilideno como descritos em DE 100 55 940 ou WO 02/38537.
- Benzoilcinamil nitrilas descritas em WO 2006/015954

Absorventes de UV particularmente adequados para combinação são como se segue:

- ácido p-aminobenzoico
- metilsulfato de 3-(4'-trimetilamônio)benzilidenobornan-2-ona
- salicilato de homomentíla (Neo Heliopan®HMS)
- ácido tereftalilidenodibornanossulfônico e sais (Mexoril®SX)
- 4-terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano (Neo Heliopan®357)
- 3-(4'-sulfo)benzilidenobornan-2-ona e sais
- 2-ciano-3,3-difenilacrilato de 2-etil-hexila (Neo Heliopan®303)
- polímero de N-[(2 e 4)-[2-(oxoborn-3-ilideno)metil]benzil]acrilamida
- 2-etil-hexil p-metoxicinamato (Neo Heliopan®AV)
- p-aminobenzoato de etila (25 mols) etoxilado
- p-metoxicinamato de isoamila (Neo Heliopan®E1000)
- 2,4,6-trianilino(p-carbo-2'-etil-hexil-1'-óxi)-1,3,5-triazina (Uvinul®T150)
- fenol, 2-(2H-benzotriazol-2-il)-4-metil-6-(2-metil-3(1,3,3,3-tetrametil-1-(trimetilsilil)óxi)dissiloxianil)propil), (Mexoril®XL)

- 4,4'-[(6-[4-(1,1-dimetil)aminocarbonil)fenilamino]-1,3,5-triazin-2,4-di-il)-di-imino]bis(éster 2-etilhexílico de ácido benzoico), (Uvasorb HEB)
- 3-(4'-metilbenzilideno)-d,l-cânfora (Neo Helipan<sup>®</sup>MBC)
- 3-benzilidenocânfora
- 5 • salicilato de 2-etil-hexila (Neo Helipan<sup>®</sup>OS)
- 4-dimetilaminobenzoato de 2-etil-hexila (Padimato O)
- hidróxi-4-metoxibenzofenona (Benzofenona-3, Oxibenzona) (Neo Helio-pan<sup>®</sup> BB)
- Ácido 2-hidróxi-4-metoxibenzofenona-5-sulfônico (benzofenona-4, sulisobenzona) e seus sais
- 10 • 2,2'-metilenobis(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-1,1,3,3-tetrametilbutil)-fenol), (Tinosorb<sup>®</sup>M)
- sal dissódico de ácido fenilenobisbenzimidaziltetrassulfônico (Neo Helio-pan<sup>®</sup>AP)
- 15 • 2,4-bis[{{(4-(2-etil-hexilóxi)-2-hidróxi}fenil)-6-(4-metoxifenil)-1,3,5-triazina, (Tinosorb<sup>®</sup>S)
- benzilidenomalonato-polissiloxano (Parsol<sup>®</sup>SLX)
- antranilato de mentila (Neo Heliopan<sup>®</sup>MA)
- 2-(4-dietilamino-2-hidroxibenzoil)benzoato de hexila (Uvinul<sup>®</sup> A Plus)
- 20 • compostos de indanilideno como descrito em DE 100 55 940 (WO 02/38537)
- Benzoilcinamil nitrilas descritas em WO 2006/015954
- Benzilideno butirolactonas descritas em EP 1008593
- compostos de Benzilideno-β-dicarboníla descritos em WO 2005/107692
- 25 É possível, além disso, usar filtros de UV particulados ou pigmentos inorgânicos, que se desejado podem se tornar hidrofóbicos, tais como os óxidos de titânio (TiO<sub>2</sub>), de zinco (ZnO), de ferro (Fe<sub>2</sub>O<sub>3</sub>), de zircônio (ZrO<sub>2</sub>), de silicone (SiO<sub>2</sub>), de manganês (z.B. MnO), de alumínio (Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub>), de cério (por exemplo Ce<sub>2</sub>O<sub>3</sub>) e/ou misturas.
- 30 A quantidade total de todos os filtros de UV solúveis em água sulfonados na formulação cosmética ou dermatológica, por exemplo porém não limitada, a ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoáci-

dos básicos sozinhos ou em combinação com sal de dissódio de ácido fenilenobisbenzimidaziltetrassulfônico e ou ácido 2-hidróxi-4-metoxibenzofenona-5-sulfônico e/ou ácido tereftalilidenodibornanossulfônico, e/ou um metil sulfato de 3-(4'-sulfo)benzilidenobornan-2-ona, e seus sais (amina, base dura ou aminoácido) está na faixa de 0,1 a 15,0% em peso e mais particularmente na faixa de 0,5 a 10,0% e particularmente na faixa de 1,0 a 8,0% da formulação total.

A quantidade de sal de dissódio de ácido fenilenobisbenzimidaziltetrassulfônico e seus sais (amina, base dura ou aminoácido) usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 10,0% em peso, preferivelmente na faixa de 0,3 a 8% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 5,0% da formulação total.

A quantidade de ácido tereftalilidenodibornanossulfônico (Mexoril®SX) e seus sais (amina, base dura ou aminoácido) usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 10,0% em peso, preferivelmente na faixa de 0,3 a 8% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 5,0% da formulação total.

A quantidade de Benzofenona-4 e seus sais (amina, base dura ou aminoácido) usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 10,0% em peso, preferivelmente na faixa de 0,3 a 8% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 5,0% da formulação total.

A quantidade total de filtros de UV solúveis em óleo que pode ser usada em uma formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos, por exemplo porém não limitado a 4,4',4''-(1,3,5-triazina-2,4,6-triiltriimino)tribenzoato de (2-etil-hexila)e/ou -terc-butil-4'-metoxidibenzoilmetano, e/ou 4-dimetilaminobenzoato de 2-etil-hexila, e/ou Mexoril®XL e/ou Uvasorb®HEB e/ou de Tinosorb®S e/ou Benzofenona-3 e/ou de Parsol®SLX e/ou Neo Heliopan®MA, e/ou p-metoxicinamato de iso-

amila, e/ou salicilato de 2-etil-hexila, e/ou homossalato e/ou metoxicinamato de etil-hexila, e/ou octocrileno, e/ou Uvinul® A Plus, e/ou 3-(4'-metilbenzilideno)-d,l-cânfora está na faixa de 0,1 a 30%, particularmente na faixa de 0,5 a 25%, particularmente na faixa de 1 a 20% da formulação total.

5 A quantidade de metoxicinamato de Etil-hexila usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 20,0%, preferivelmente na faixa de 0,3 a 15% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 10,0% da formulação total.

10 A quantidade de p-metoxicinamato de isoamila usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 20,0%, preferivelmente na faixa de 0,3 a 15% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 10,0% da formulação total.

15 A quantidade de Octocrileno usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 20,0%, preferivelmente na faixa de 0,3 a 15% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 10,0% da formulação total.

20 A quantidade de ésteres de salicilato usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 20,0%, preferivelmente na faixa de 0,3 a 15% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 10,0% da formulação total. Quando salicilato de Etil-hexila é escolhido como o Filtro de UV, é vantajoso que seu total varie de 0,1 a 5,0% da formulação e quando Homossalato é escolhido como o Filtro de UV é vantajoso que seu total varie de  
25 0,1 a 15,0% da formulação

A quantidade de metoxidibenzoilmetano de Butíla usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 10,0%,  
30 preferivelmente na faixa de 0,3 a 7,0% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 5,0% da formulação total.

A quantidade de Uvinul® A Plus usada na formulação cosmética

ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 10,0%, preferivelmente na faixa de 0,3 a 7,0% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 5,0% da formulação total.

5                   A quantidade de Tinosorb®S usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 10,0%, preferivelmente na faixa de 0,3 a 7,0% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 5,0% da formulação total.

10                   A quantidade de Uvasorb HEB usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 10,0%, preferivelmente na faixa de 0,3 a 7,0% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 5,0% da formulação total.

15                   A quantidade de Uvinul® T-150 usada na formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 10,0%, preferivelmente na faixa de 0,3 a 7,0% e preferivelmente na faixa de 0,5 a 5,0% da formulação total.

20                   A quantidade total de pigmentos orgânicos e/ou inorgânicos microfinos de óleo, por exemplo porém não limitada a derivados de triazina e/ou Óxido de zinco (revestido e não revestido), e/ou dióxido de titânio (revestido ou não revestido) que pode ser usado em uma formulação cosmética ou dermatológica contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos está na faixa de 0,1 a 20,0%, preferivelmente na  
25                   faixa de 0,3 a 15% e mais preferivelmente na faixa de 0,5 a 10,0% e preferivelmente na faixa de 0,75% a 7,5%. Quando dióxido de titânio é escolhido como o Filtro de UV, é vantajoso que seu total varie de 0,1% a 10,0% da formulação. Quando Óxido de Zinco é escolhido como o Filtro de UV é vantajoso que seu total varie de 0,1% a 10,0% da formulação e quando um ou  
30                   mais pigmento orgânico de triazina escolhido é vantajoso que seu total varie de 0,1% a 10,0% da formulação.

Combinando ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com

aminoácidos básicos com outros filtros de UV, por exemplo com os filtros de UV listados acima e particularmente os filtros de UV listados como "particularmente" adequados para combinação, porém não limitados a estes, leva a efeitos sinérgicos no grau de proteção oferecido contra radiação UVB e UVA como determinado por medidas para determinar fatores de proteção solar contra radiação UVA e/ou UVB.

A invenção desse modo também fornece o ensino que combina ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos com individuais ou quaisquer misturas desejadas de quaisquer dos filtros de UV listados acima bem como quaisquer dos filtros de UV permitidos para uso em produtos de proteção solar presentemente legislados em:

USA.: pela Food and Drug Administration (FDA). publicado no Monograph for Sunscreen Drug Products for Over-The-Counter Human Use.

Europa: pela Cosmetics Directive 76/768 EEC do Conselho de Comunidades europeias, publicado no Official Journal of the European Communities.

Japão: Na lista positiva de filtros de UV permitidos na publicação dos critérios cosméticos pelo Ministério da Saúde e Bem-estar (MHW).

Austrália: Na lista positiva de filtros de UV permitidos publicada pela Australian Therapeutic Goods Administration no Australian Register of Therapeutic Goods (ARTG).

Leva a efeitos protetores sinérgicos contra radiação UVA e/ou UVB.

Combinando ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos com outros filtros de UV com filtros que absorvem na faixa de UVA leva a formulações cosméticas e dermatológicas de proteção de UV de ampla faixa.

Formulações cosméticas e dermatológicas de fotoestáveis melhoradas podem da mesma forma ser formuladas com ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos com outros filtros de UV, sozinho ou com outros filtros de UV como listado acima.

As formulações cosméticas e/ou dermatológicas de acordo com

a presente invenção podem ter a composição habitual e podem ser usadas para proteção solar cosmética e/ou dermatológica, e da mesma forma para o tratamento, cuidado e limpeza da pele e/ou do cabelo e como um produto de maquiagem em cosméticos decorativos. Desta maneira, as preparações de acordo com a presente invenção podem, dependendo de sua formulação, ser usadas, por exemplo, como creme de proteção de pele, leite de limpeza, loção de protetor solar, creme nutritivo, creme de dia ou creme noturno. As preparações de acordo com a presente invenção podem, dependendo de sua formulação, da mesma forma ser usadas por exemplo, em composições de cuidado de cabelo tal como xampus, condicionadores, formulações 2 em 1, xampus anticaspa, tônicas capilares, loções de cabelo, enxague de cabelo, produtos de modelagem, sprays, etc. Em alguns exemplos, é possível e vantajoso usar as preparações de acordo com a presente invenção como bases para formulações farmacêuticas. Preferência é dada, em particular, àqueles cosméticos e preparações dermatológicas na forma de um cuidado de pele, produtos de cuidado de cabelos ou de maquiagem. Modalidades típicas são cremes, géis por exemplo porém não limitadas a hidrogéis, géis de hidrodispersão, géis em óleo; loções, soluções alcoólicas e aquosas/alcoólicas, emulsões em suas várias formas, por exemplo porém não limitadas a, emulsões misturadas de óleo em água (O/A), água em óleo (A/O), emulsões de PIT, emulsões de Pickering, microemulsões, nanoemulsões; espumas de aerossol, espumas de não-aerossol, sprays em aerossóis, sprays não aerossóis, sprays de bomba, soros, *roll-ons*, pastas, bálsamos, ou preparações em bastão. Estas composições podem da mesma forma compreender, como outros auxiliares e aditivos, tensoativos moderados, co-emulsificadores, agentes supergordurosos, ceras peroladas, agentes de enorpamento, espessantes, polímeros, compostos de silicone, gorduras, ceras, estabilizadores, ingredientes ativos biogênicos, ingredientes ativos de desodorante, agentes anticaspa, formadores de película, agentes de dilatação, agentes hidrotrópicos, conservantes, repelentes de inseto, agentes de bronzeamento, agentes de auto-bronzeamento artificial (por exemplo dihidroxiacetona), estabilizadores, óleos de perfume, tinturas, agentes antimicrobianos.

crobianos, extratos de planta aquosos e não-aquosos e similares.

Para uso, as preparações cosméticas e dermatológicas de acordo com a presente invenção são aplicadas à pele e/ou ao cabelo em uma quantidade suficiente da maneira habitual para preparações cosméticas ou farmacológicas e dermatológicas.

Mais preferência é dada a essas preparações cosméticas e dermatológicas na forma de uma composição cosmética para a proteção da pele e cabelo. Vantajosamente, além de ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos usados de acordo com a presente invenção, estes podem conter pelo menos um pigmento inorgânico, preferivelmente um micropigmento inorgânico.

As preparações cosméticas e dermatológicas de acordo com a presente invenção podem compreender auxiliares cosméticos, como são habitualmente usados em tais preparações, por exemplo conservantes, bactericidas, perfumes, antiespumantes, tinturas, pigmentos que tem uma ação de coloração, espessantes, cremes hidratantes e/ou umectantes, gorduras, óleos, ceras ou outros componentes habituais de uma formulação cosmética ou dermatológica, tal como alcoóis, polióis, polímeros, estabilizadores de espuma, eletrólitos, solventes orgânicos ou derivados de silicone. As quantidades de auxiliares cosméticos e dermatológicos e substâncias de veículo e perfume que podem ser usados em cada caso podem ser determinadas facilmente pelo versado na técnica por tentativa simples e erro, dependendo da natureza do produto em questão.

Modalidades preferidas das preparações cosméticas farmacêuticas, especialmente dermatológicas da invenção podem da mesma forma compreender tensoativos aniônicos, catiônicos, não-iônicos e/ou anfotéricos. Tensoativos são substâncias anfífilas que podem dissolver substâncias orgânicas, não-polares em água. Neste contexto, os componentes hidrofílicos de uma molécula de tensoativos são grupos funcionais normalmente polares, por exemplo  $-\text{COO}-$ ,  $-\text{OSO}_3^{2-}$ ,  $-\text{SO}_3-$ , enquanto as partes hidrofóbicas como uma regra são radicais de hidrocarboneto não-polares. Tensoativos são em geral classificados de acordo com a natureza e carga da por-

ção molecular hidrofílica. Uma distinção pode ser feita entre quatro grupos aqui:

- . tensoativos aniônicos,
- . tensoativos catiônicos,
- 5 . tensoativos anfotéricos e
- . tensoativos não-iônicos.

Tensoativos aniônicos como uma regra contêm grupos carboxilato, sulfato ou sulfonato como grupos funcionais. Em solução aquosa, eles formam íons orgânicos negativamente carregados em um meio ácido ou neutro. Tensoativos catiônicos são quase exclusivamente caracterizados pela presença de um grupo amônio quaternário. Em solução aquosa, eles formam íons orgânicos positivamente carregados em um meio ácido ou neutro. Tensoativos anfotéricos contêm igualmente grupos aniônicos e catiônicos e desta maneira se comportam como tensoativos aniônicos ou catiônicos em solução aquosa, dependendo do pH. Em um meio fortemente ácido eles têm uma carga positiva, e em um meio alcalino uma carga negativa. Por outro lado, eles são híbridos na faixa de pH neutro. Cadeias de poliéter são típicas de tensoativos não-iônicos. Tensoativos não-iônicos não formam íons em um meio aquoso.

#### 20 A. Tensoativos aniônicos

Tensoativos aniônicos que são vantajosamente usados são ácidos de acilamino (e sais do mesmo), tal como:

- glutamatos de acila, por exemplo acil glutamato de sódio, aspartato de di-TEA-palmitoíla e glutamato caprílico/cáprico de sódio,
- 25 - peptídeos de acila, por exemplo proteína de leite hidrolisada de palmitoíla, proteína de soja hidrolisada de cocoíla de sódio e colágeno hidrolisado de cocoíla de sódio/potássio,
- sarcosinatos, por exemplo miristoil sarcosina, sarcosinato de TEA-lauroíla, sarcosinato de lauroíla de sódio e sarcosinato de cocoíla de sódio,
- 30 - tauratos, por exemplo taurato de lauroíla de sódio e taurato de metilcocoíla de sódio,
- lactilatos de acila, lactilato de lauroíla, lactilato de caproíla,

- alaninatos

ácidos carboxílicos e derivados, tal como por exemplo:

5 - Estearato de TEA, estearatos de Glicerila, estearatos de glicerila de PEG, ácido láurico, estearato de alumínio, alcanolato de magnésio e undecilenato de zinco,

ácidos éster - carboxílicos, por exemplo lactilato de estearoíla de cálcio, citrato de lauret-6 e carboxilato de lauramida de PEG-4 de sódio, estearatos de glicerila, oleilestearatos de glicerila, citratos de glicerila, citratos de oleíla de glicerila,

10 - ácidos éter- carboxílicos, por exemplo carboxilato de lauret-13 de sódio e carboxilato de cocamida de PEG-6 de sódio, ésteres de glicosídeo, tais como por exemplo

- glicosídeo de cetearila, glicosídeo de laurila, ésteres de ácido fosfórico e sais, tal como, por exemplo:

15 • fosfato de cetila (mono--, di- cetila e suas misturas), fosfato de cetila de potássio, (mono--, di-- cetila e suas misturas), fosfato de cetila de DEA (mono--, dicetila e suas misturas), DEA -fosfato de olet-10 e fosfato de dilauret-4,

ácidos sulfônicos e sais, tais como

20 - isetionatos de acíla, por exemplo isetionato de cocoíla de sódio/amônio,

- alquilarilsulfonatos,

- alquilsulfonatos, por exemplo sulfato de coco-monoglicerídeo de sódio, olefinsulfonato de C12-14 de sódio, sulfoacetato de laurila de sódio e sulfato de cocamida de magnésio de PEG-3,

25 - sulfossuccinatos, por exemplo sulfossuccinato de dioctíla de sódio, sulfossuccinato de lauret de dissódio, laurilsulfossuccinato de dissódio e undecilenamido-MEA-sulfossuccinato de dissódio

e

ésteres de ácido sulfúrico, tais como:

30 - sulfato de éter alquílico, por exemplo sódio, amônio, magnésio, MIPA, sulfato de lauret TIPA, sulfato de miret de sódio e sulfato de paret de C12-13 de sódio,

- sulfatos de alquila, por exemplo sódio, amônio e sulfato de laurila de TEA.

#### B. Tensoativos catiônicos

Tensoativos catiônicos que são vantajosamente usados são

- alquilaminas,
- 5 - alquilimidazóis,
- aminas etoxiladas,
- tensoativos quaternários,
- $\text{RNH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{COO}^-$  (em  $\text{pH}=7$ )
- $\text{RNHCH}_2\text{CH}_2\text{COO}^- \text{B}^+$  (em  $\text{pH}=12$ )  $\text{B}^+$  = qualquer cátion desejado, por e-
- 10 xemplo  $\text{Na}^+$  e
- quats de éster.

Tensoativos quaternários contêm pelo menos um átomo de N que é covalentemente ligado a grupos 4 alquila ou arila. Isto leva a uma carga positiva, independentemente do pH. Alquilbetaina, alquilamidopropilbetaina e alquilamidopropilhidroxissulfaina são vantajosas. Tensoativos catiônicos usados podem também preferivelmente ser escolhidos a partir do grupo consistindo em compostos de amônio quaternários, em particular cloreto de benziltrialquilamônio ou brometos, tais como, por exemplo, cloreto de benzil-

15 dimetilstearylamônio, e da mesma forma sais de alquiltrialquilamônio, por exemplo cloreto ou brometo de cetiltrimetilamônio, cloretos ou brometos de alquildimetil-hidroxietilamônio, cloretos ou brometos de dialquildimetilamônio, sulfatos de éter de alquilamidaetiltrimetilamônio, sais de alquilpiridínio, por exemplo cloreto de laurila ou cetilpiridínio, derivados de imidazolina e compostos tendo um caráter catiônico, tal como óxidos de amina, por e-

20 xemplo óxidos de alquildimetilamina ou óxidos de alquilaminoetildimetilamina. Sais de cetiltrimetil-amônio em particular são vantajosamente usados.

#### C. Tensoativos anfotéricos

Tensoativos anfotéricos que são vantajosamente usados são

- acila/dialquiletilenodiamina, por exemplo acilanfoacetato de sódio, acilanfo-
- 30 dipropionato de dissódio, alquilanfodiacetato de dissódio, acilanfodioxipropilsulfonato de sódio, acilanfodiacetato de dissódio e acilanfopropionato de sódio,

- Ácidos de N-alquilamino, por exemplo aminopropil alquilglutamida, ácido alquilaminopropiônico, alquilimidodipropionato de sódio e lauroanfocarboxiglicinato.

5 - acilanfoidroxipropilsulfonato, acilanfodiacetato de dissódio e acilanfopropionato de sódio,

- Ácidos de N-alquilamino, por exemplo aminopropil alquilglutamida, ácido alquilaminopropiônico, alquilimidodipropionato de sódio e lauroanfocarboxiglicinato.

#### D. Tensoativos não-iônicos

10 Tensoativos não-iônicos que são vantajosamente usados são

- alcoóis,

- alcanolamidas, tais como cocamidas MEA/DEA/MIPA,

- óxidos de amina, tais como óxido de cocoamidopropilamina,

15 - éteres, por exemplo alcoóis etoxilados/propoxilados, ésteres etoxilados/propoxilados, ésteres de glicerol etoxilados/propoxilados, colesteróis etoxilados/propoxilados, ésteres de triglicerídeo etoxilados/propoxilados, lanolina etoxilada/propoxilada, polissiloxanos etoxilados/propoxilados, éteres de POE propoxilados e poliglicosídeos de alquila, tal como lauril glicosídeo, decil glicosídeo e coco-glicosídeo.

20 - ésteres de sacarose, éteres de sacarose,

- ésteres de poliglicerol, ésteres de diglicerol, ésteres poligliceril-2 dipoliidroxistearato de monoglicerol (Dehymuls®PGPH), di--isoestearato de poligliceril-3 (Lameform®TGI), isoestearato de poligliceril-4 (Isolan®GI 34), oleato de poligliceril-3, di--isoestearato de poligliceril-3 de di--isostearila (Isolan®PDI),  
25 diestearato de poligliceril-3 metilglicose (Tego Carey®450), cera de abelha de poligliceril-3 (Cera Bellina®), caprato de poligliceril-4 (caprato de poliglicerol T2010/90), éter cetílico de poligliceril-3 (Chimexane®NL), diestearato de poligliceril-3 (Cremofor®GS 32), estearato de poligliceril-2 (Hostacerin®DGMS) e poliricineoleato de poliglicerila (Admul®WOL 1403), e misturas  
30 dos mesmos.

- ésteres de metilglicose, ésteres de hidróxi ácidos,

O uso de uma combinação de tensoativos aniônicos e/ou anfoté-

ricos com um ou mais tensoativos não-iônicos é também vantajoso.

Além disso, preparações cosméticas e dermatológicas de acordo com a presente invenção vantajosamente, porém não obrigatoriamente, compreendem pigmentos inorgânicos com base em óxidos de metal finalmente dispersos e/ou outros compostos de metal que são insolúveis ou moderadamente solúveis em água, em particular os óxidos de titânio ( $\text{TiO}_2$ ), zinco ( $\text{ZnO}$ ), ferro (por exemplo  $\text{Fe}_2\text{O}_3$ ), zircônio ( $\text{ZrO}_2$ ), silicone ( $\text{SiO}_2$ ), manganês (por exemplo  $\text{MnO}$ ), alumínio ( $\text{Al}_2\text{O}_3$ ), cério (por exemplo  $\text{Ce}_2\text{O}_3$ ), óxidos misturados dos metais correspem quentes, e misturas de tais óxidos. Estes pigmentos são raio X amorfo ou raio X não-amorfo. Mais preferência é dada a pigmentos com base em  $\text{TiO}_2$ . Pigmentos de óxido de raio X amorfo são óxidos de metal ou óxidos de semimetal que revelam nenhuma ou não reconhece nenhuma estrutura cristalina em experiências de difração de raio X. Tais pigmentos são frequentemente obteníveis por reação de chama, por exemplo reagindo-se um metal ou haleto de semimetal com hidrogênio e ar (ou oxigênio puro) em uma chama.

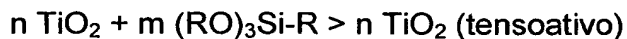
Em formulações cosméticas, dermatológicas ou farmacêuticas, pigmentos de óxido de raio X amorfo são usados como espessantes e agentes tixotrópicos, auxiliares de fluxo para emulsão e estabilização de dispersão e como substância de veículo (por exemplo para aumentar o volume de pós finamente divididos). Pigmentos de óxido de raio X amorfo que são conhecidos e frequentemente usados em galênicos cosméticos ou dermatológicos são, por exemplo, óxido de silicone de alta pureza. Preferência é dada a pigmentos de dióxido de silício de raio X amorfo de alta pureza com um tamanho de partícula na faixa de 5 a 40 nm e uma área de superfície ativa (BET) na faixa de 50 a 400  $\text{m}^2/\text{g}$ , preferivelmente 150 a 300  $\text{m}^2/\text{g}$ , em que as partículas serão consideradas como partículas esféricas de dimensão muito uniforme. Macroscopicamente, os pigmentos de dióxido de silício são reconhecíveis como pós soltos, brancos. Pigmentos de dióxido de silício são comercialmente vendidos sob o nome Aerosil® (CAS-no. 7631-85-9) ou Carb-O-Sil

Graus de Aerosil® vantajosos são, por exemplo, Aerosil®0X50,

Aerosil®130, Aerosil®150, Aerosil®200, Aerosil®300, Aerosil®380, Aerosil®MQX 80, Aerosil® MOX 170, Aerosil®COK 84, Aerosil® R 202, Aerosil®R 805, Aerosil®R 812, Aerosil®R 972, Aerosil®R 974, Aerosil®R976,.

De acordo com a presente invenção, preparações de proteção  
5 claras cosméticas ou dermatológicas compreendem 0,1 a 20% em peso, vantajosamente 0,5 a 10% em peso, mais preferivelmente 1 a 5% em peso, de pigmentos de óxido de raio X amorfos.

Os pigmentos inorgânicos de raio X não-amorfos estão, de acordo com a presente invenção, vantajosamente na forma hidrofóbica, isto é  
10 foram superfície tratadas para repelir água. Este tratamento de superfície pode envolver fornecer os pigmentos com uma camada hidrofóbica fina por processos conhecido por si próprios. Um tal processo envolve, por exemplo, produzir a camada de superfície hidrofóbica por uma reação de acordo com



15 em que n e m são parâmetros estequiométricos a ser usados quando desejado, e R e R' são os radicais orgânicos desejados. Pigmentos hidrofobicizados preparados analogamente a DE-A 33 14 742, por exemplo, são vantajosos.

Por exemplo, menção pode ser feita a partir de pigmentos de  
20  $\text{TiO}_2$ , como são vendidos sob nome comercial T805 a partir de Degussa. Preferência é da mesma forma dada a óxidos misturados de  $\text{TiO}_2/\text{Fe}_2\text{O}_3$ , como são fornecidos, por exemplo, sob o nome comercial T817, da mesma forma a partir de Degussa.

A quantidade total de pigmentos inorgânicos, em particular micropigmentos inorgânicos hidrofóbicos, nas preparações cosméticas ou  
25 dermatológicas acabadas é vantajosamente escolhida da faixa de 0,1 a 30% em peso, preferivelmente 0,1 a 10,0% em peso, preferivelmente 0,5 a 6,0% em peso, com base no peso total das preparações.

Filtros de UV são geralmente usados em formulações Cosméticas e dermatológicas para impedir a pele de escurecer e iluminar a pele.  
30 Neste caso ingredientes de iluminação de pele ativos além de ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos, sozinhos ou

em combinação com outros filtros de UV é preferido. Tais ingredientes de iluminação de pele que podem ser usados são por exemplo porém não limitados ao seguinte: ácido cômico (5-hidróxi-2-hidroximetil-4-piranona), derivados de ácidos cômicos tal como por exemplo dipalmitato cômico, arbutina, ácido ascórbico, derivados de ácido ascórbico, hidroquinona, derivados de hidroquinona, derivados de estiril resorcinol (por exemplo 4-(1-feniletil)1,3-benzenediol), moléculas contendo enxofre, tais como glutathione ou cisteína por exemplo, alfa-hidróxi ácidos (por exemplo ácido cítrico, ácido láctico, ácido málico) e seus derivados, N-acetil tirosina e derivados, undecenoilfenilalanina, ácido glucônico, derivados de cromona tais como aloesina, flavonoides, derivados de timol, ácido 1-aminoetilfosfínico, derivados de tiourea, ácido elágico, nicotinamida, sais de zinco por exemplo tal como cloreto de zinco ou Gliconato de zinco, tujaplicina e derivados, triterpenos tais como ácido málico, esteróis tais como ergosterol, benzofuranonas tais como senquiunolida, vinil- e etilguaiacol, ácidos diônicos tais como ácido octodeceno-diônico e ácido azelaico, inibidores de síntese de óxido de nitrogênio tais como L-nitroarginina e seus derivados, 2,7-dinitroindazol ou tiocitrulina, quelantes de metal (por exemplo ácidos graxos de alfa-hidróxi, ácido palmítico, ácido fítico, lactoferrina, ácido húmico, ácido gálico, extratos biliares, bilirrubina, biliverdina), retinoides, leite de soja, extrato de soja, inibidores de serina protease ou ácido lipoico ou outros compostos ativos sintéticos ou naturais para clareamento de pele e cabelo, estes compostos da mesma forma sendo usados na forma de um extrato a partir de plantas, tal como extrato de *Ramnus Purshianus* (*bearberry*), extrato de arroz, extrato de mamão, extrato de raiz de alcaçuz ou componentes concentrados destes, tal como glabridina ou licocalcona A, extrato de *Artocarpus*, extrato de espécies de *Rumex* and *Ramulus*, a partir de espécies de pinheiro (*Pinus*) e extratos a partir de espécies de *Vitis* ou derivados de estilbeno concentrados destes, extrato a partir de saxifraga, amora, *Scutellaria* e/ou uvas.

Um teor adicional de antioxidantes nas preparação cosméticas ou dermatológicas é geralmente preferido. De acordo com a presente invenção, antioxidantes favoráveis que podem ser usados são todos os antioxi-

dantes habituais ou adequados para aplicações cosméticas e/ou dermatológicas.

Os antioxidantes são vantajosamente escolhidos a partir do grupo aminoácidos (por exemplo glicina, histidina, tirosina, triptofano) e derivados dos mesmos, imidazóis (por exemplo ácido urocânico) e derivados dos mesmos, peptídeos, tais como D,L-carnosina, D-carnosina, L-carnosina e derivados dos mesmos (por exemplo anserina), carotenoides, carotenos (por exemplo  $\alpha$ -caroteno,  $\beta$ -caroteno, licopeno) e derivados dos mesmos, ácido clorogênico e derivados dos mesmos, ácido lipoico e derivados dos mesmos (por exemplo ácido di-idrolipoico), aurotioglicose, propiltiouracila e outros tióis (por exemplo tioredoxina, glutathiona, cisteína, cistina, cistamina e a glicosíla, N-acetila, metila, etila, propíla, amila, butíla e laurila, palmitoíla, oleíla,  $\gamma$ -linoleíla, colesterila e ésteres de glicerila dos mesmos) e sais dos mesmos, tiodipropionato de dilaurila, tiodipropionato de distearila, ácido tiodipropiônico e derivados dos mesmos (ésteres, éteres, peptídeos, lipídios, nucleotídeos, nucleosídeos e sais), e compostos de sulfoximina (por exemplo butionina sulfoximinas, homocisteína sulfoximina, butionina sulfonas, penta-, hexa-, heptationina sulfoximina) em doses toleradas muito baixas (por exemplo pmol a  $\mu$ mol/kg), e da mesma forma (metal) agentes de quelação (por exemplo ácidos graxos de  $\alpha$ -hidróxi, ácido palmítico, ácido fítico, lactoferrina), ácidos de  $\alpha$ -hidróxi (por exemplo ácido cítrico, ácido láctico, ácido maleico), ácido húmico, ácido biliar, extratos biliares, bilirrubina, biliverdina, EDTA, EGTA e derivados dos mesmos, ácidos graxos insaturados e derivados dos mesmos (por exemplo ácido  $\gamma$ -linolênico, ácido linoleico, ácido oleico), ácido fólico e derivados dos mesmos, ubiquinona e ubiquinol e derivados dos mesmos, vitamina C e derivados (por exemplo palmitato de ascorbília, fosfato de Mg ascorbília, acetato de ascorbília), tocoferóis e derivados (por exemplo acetato de vitamina E), vitamina A e derivados (palmitato de vitamina A), e benzoato de coniferilas de resina de benzoína, ácido rutínico e derivados dos mesmos,  $\alpha$ -glicosilrutina, ácido ferúlico, furfurilidenoglucitol, carnosina, butil-hidroxi-tolueno, butil-hidroxianisol, ácido nordi-idroguaiácico, ácido nordi-idroguaiarético, triidroxibutirofenona, ácido úrico e derivados dos mesmos,

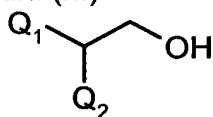
manose e derivados dos mesmos, zinco e derivados dos mesmos (por exemplo ZnO, ZnSO<sub>4</sub>), selênio e derivados dos mesmos (por exemplo selenometionina), estilbenos e derivados dos mesmos (por exemplo óxido de estilbeno, óxido de trans-estilbeno) e os derivados (sais, ésteres, éteres, açúcares, nucleotídeos, nucleosídeos, peptídeos e lipídios) dos ingredientes ativos adequados de acordo com a presente invenção.

A quantidade dos antioxidantes mencionados acima (um ou mais compostos) nas preparações é preferivelmente 0,001 a 30% em peso, mais preferivelmente 0,05 a 20% em peso, e preferivelmente 1 a 10% em peso, com base no peso total da preparação.

Modalidades preferidas das preparações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção, podem vantajosamente da mesma forma compreender vitaminas e precursores de vitamina, sendo possível para todas as vitaminas e precursores de vitamina que são adequados ou habituais para aplicações cosméticas e/ou dermatológicas a serem usadas. Esses mencionados aqui são, em particular, vitaminas e precursores de vitamina, tal como tocoferóis, vitamina A, ácido de niacina e niacinamida, outras vitaminas do complexo de B, em particular biotina, e vitamina C e pantenol e derivados dos mesmos, em particular os ésteres e éteres de pantenol, e pantenóis cationicamente derivatizados, tal como triacetato de pantenol, éter monoetílico de pantenol e o monoacetato dos mesmos e derivados de pantenol catiônicos. Se vitamina E e/ou derivados das mesmas representam o(s) antioxidante(s), é vantajoso escolher suas respectivas concentrações da faixa de 0,001 a 10% em peso, com base no peso total da formulação. Se vitamina A ou derivados de vitamina A, ou caroteno ou derivados dos mesmos representam o(s) antioxidante(s), é vantajoso escolher suas respectivas concentrações da faixa de 0,001 a 10% em peso, com base no peso total da formulação.

Modalidades preferidas das preparações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatológicas da invenção podem da mesma forma compreender lipídios escolhidos a partir do seguinte grupo substâncias:

- (i) parafinas saturadas lineares ou ramificadas (óleos minerais) tendo 15 ou mais átomos de C , em particular tendo 18 a 45 átomos de C;
- (ii) ésteres tendo 12 ou mais átomos de C de ácidos graxos lineares ou ramificados tendo 6 a 30 átomos de C e mono-, di- ou três lineares ou ramificados, saturados ou insaturados, tendo 3 a 30 átomos de C, ésteres estes que não têm grupos hidroxila livres,;
- (iii) ésteres de ácido benzoico e monoalcanóis lineares ou ramificados, saturados ou insaturados tendo 8 a 20 átomos de C;
- (iv) monoésteres ou diésteres de alcoóis tendo 3 a 30 átomos de C e ácidos naftaleno-monocarboxílicos ou ácidos dicarboxílicos; especialmente C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub> ésteres de ácido naftalenomonocarboxílicos e di--C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub> ésteres de ácido naftalenodicarboxílico;
- (v) éteres di--C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub>-alquílicos lineares ou ramificados, saturados ou insaturados;
- (vi) óleos de silicone;
- (vii) 2-alkil-1-alcanóis da fórmula (III)



(III)

em que

- Q<sub>1</sub> é um radical alquila linear ou ramificado tendo 6 a 24 átomos de C e
- Q<sub>2</sub> é um radical alquila linear ou ramificado tendo 4 a 16 átomos de C.

Uma fase de óleo ou componente de óleo no sentido mais restrito (e preferido) da presente invenção, isto é, das substâncias inventivamente limitadas ou substâncias presentes apenas em uma fração menor, abrange os seguintes grupos de substâncias:

- (i) parafinas lineares ou ramificadas, saturadas tendo 20 a 32 átomos de C;
- (ii) ésteres tendo pelo menos 14 átomos de C de ácidos graxos saturados, lineares ou ramificados tendo 8 a 24 átomos de C e mono-, di- ou três lineares ou ramificados, saturados ou insaturados tendo 3 a 24 átomos de C, ésteres estes não contendo grupo hidroxila livre;
- (iii) ésteres de ácido benzoico e monoalcanóis saturados, lineares ou ramifi-

cados tendo 10 a 18 átomos de C;

(iv) di--C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub> ésteres de ácidos 2,6-naftalenodicarboxílicos;

(v) éteres di--C<sub>6</sub>-C<sub>18</sub>-alquílicos saturados, lineares ou ramificados, especialmente éteres di--C<sub>6</sub>-C<sub>12</sub>-alquílicos (de cadeia linear);

5 (vi) óleos de silicone do grupo dos ciclotrissiloxanos, ciclopentassiloxanos, dimetilpolissiloxanos, dietilpolissiloxanos, metilfenilpolissiloxanos, difenilpolissiloxanos e formas híbridas dos mesmos;

(vii) 2-alquil-1-alcanóis tendo 12 a 32 átomos de C da fórmula (III)

em que

10 Q<sub>1</sub> é um radical alquila (preferivelmente linear) tendo 6 a 18 átomos de C e

Q<sub>2</sub> é um radical alquila (preferivelmente linear) tendo 4 a 16 átomos de C.

Uma fase em óleo no sentido mais restrito (e mais preferido) da presente invenção abrange os seguintes grupos de substâncias:

(i) parafinas lineares ou ramificadas, saturadas tendo 20 a 32 átomos de C tal como isoeicosano ou esqualano;

(ii) ésteres tendo pelo menos 16 átomos de C de ácidos graxos saturados, lineares ou ramificados tendo 8 a 18 átomos de C e mono-, di- ou trióis lineares ou ramificados, saturados tendo 3 a 18 átomos de C, ésteres estes não contêm grupo hidroxila livre;

20 (iii) ésteres de ácido benzoico e monoalcanóis saturados, lineares ou ramificados tendo 12 a 15 átomos de C, especialmente benzoatos de C<sub>12</sub>-15-alquila;

(iv) ésteres di--C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub> de ácidos 2,6-naftalenodicarboxílicos, especialmente 2,6-naftalenodicarboxilato de dietil-hexila;

25 (v) éteres di--C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-alquílicos de cadeia linear; especialmente éter di--n-octílio (éter dicaprílico);

(vi) óleos de silicone do grupo undecametilciclotrissiloxano, ciclometicona, decametilciclopentassiloxano, dimetilpolissiloxanos, dietilpolissiloxanos, metilfenilpolissiloxanos e difenilpolissiloxanos;

30 (vii) 2-alquil-1-alcanóis tendo 12 a 32 átomos de C da fórmula (III)

em que

Q<sub>1</sub> é um radical alquila (preferivelmente linear) tendo 6 a 18 átomos de C e

Q<sub>2</sub> é um radical alquila (preferivelmente linear) tendo 4 a 16 átomos de C.

Componentes particularmente preferidos do tipo (i) na fase de óleo são como segue: miristato de isopropila, palmitato de isopropila, estearato de isopropila, oleato de isopropila, estearato de n-butila, laurato de n-hexila, oleato de n-decila, estearato de iso-octila, estearato de isononila, isononanoato de isononila, palmitato de 2-etil-hexila, laurato de 2-etil-hexila, estearato de 2-hexildecila, palmitato de 2-octildodecila, oleato de oleila, erucato de oleila, oleato de erucila, erucato de erucila, isoestearato de 2-etil-hexila, isononanoato de isotridecila, cocoato de 2-etil-hexila, triglicerídeo caprílico/cáprico, e da mesma forma sintético, semissintéticos e misturas naturais de tais ésteres, por exemplo óleo de jojoba.

Triglicerídeos de ácido graxo (componentes de óleo do tipo (i) na fase de óleo) podem também estar na forma de, ou na forma de um componente de, óleos sintéticos, semissintéticos e/ou naturais, exemplos sendo azeite de oliva, óleo de girassol, óleo de soja, óleo de amendoim, óleo de semente de colza, óleo de amêndoa, óleo de palma, óleo de coco, óleo de semente de palma e misturas dos mesmos.

Componentes de óleo particularmente preferidos do tipo (vii) na fase de óleo são como segue: 2-butil-1-octanol, 2-hexil-1-decanol, 2-octil-1-dodecanol, 2-deciltetradecanol, 2-dodecil-1-hexadecanol e 2-tetradecil-1-octadecanol.

Componentes de óleo particularmente preferidos na fase de óleo são misturas compreendendo benzoato de C<sub>12</sub>-C<sub>15</sub>-alquila e isoestearato de 2-etil-hexila, misturas compreendendo benzoato de C<sub>12</sub>-C<sub>15</sub>-alquila e isononanoato de isotridecila, misturas compreendendo benzoato de C<sub>12</sub>-C<sub>15</sub>-alquila, isoestearato de 2-etil-hexila e isononanoato de isotridecila, misturas compreendendo ciclometicona e isononanoato de isotridecila, e misturas compreendendo ciclometicona e isoestearato de 2-etil-hexila.

Modalidades preferidas das preparações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção podem vantajosamente da mesma forma compreender o uso de polímeros para melhorar a capacidade de dispersão da formulação na pele ou cabelo, ou me-

lhorar a resistência a água e ou suor e ou atrito da fórmula e melhorar o fator de proteção da formulação. Exemplos de tais polímeros são: copolímeros de VP/Eicoseno vendidos sob o nome comercial de Antaron V-220 por International Speciality Products, copolímero de VP/Hexadeceno vendidos sob os  
5 nomes comerciais Antaron V-216 e Antaron V-516 por International Speciality Products, Tricontanil PVP vendido sob o nome comercial de Antaron WP-660 por International Speciality Products, Isoexadecano e copolímero de Etileno/Propileno/Estireno e copolímero de Butileno/Estireno vendido sob os nomes comerciais de Versagel MC e MD por Penreco, poliisobuteno Hidrogenado e copolímero de Etileno/Propileno/Estireno e copolímero de Butileno/Estireno vendido sob o nome comercial de Versagel Me por Penreco, Copolímeros de Acrilatos/Octilacrilamida vendido sob o nome comercial de Dermacril 79, Dermacril AQF e Dermacril LT por National Starch, Poliuretanos tais como copolímero de PPG-17/IPDI/DMPA, vendido sob o nome comercial de Avalure UR 450 & 525 vendido por Noveon, Poliuretanos-2 e -4  
10 vendidos sob o nome comercial Avalure UR-405, -410, -425, -430 e -445 525, vendidos por Noveon, Poliuretano 5 e Acetato Butílica e álcool isopropílico vendidos sob o nome comercial Avalure UR - 510 e -525 vendido por Noveon, Poliuretanos -1 e -6 vendido sob o nome comercial de Luviset PUR por  
15 BASF, Copolímero de Dímero Hidrogenado Dilinoleíla/Dimetilcarbonato vendido sob o nome comercial de Cosmedia DC por Cognis.

Claro que, como alguém bem versado na técnica de formulação cosmética e dermatológica conhece, esta não é uma lista exaustiva e outros polímeros adequados não listados aqui podem ser usados. Exemplos de tais  
25 polímeros podem ser encontrados na edição mais recente do CTFA's International Cosmetic Ingredient Dictionary

A quantidade de polímeros usados para obter o efeito desejado na faixa de formulação varia de 0,10% a 5,0% em peso da formulação e especialmente na faixa de 0,25% a 3,0% em peso da formulação.

30 Modalidades preferidas das preparações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção compreendem, se desejado, outros ingredientes tendo propriedades de cuidado, tais

como, por exemplo, alcoóis graxos tendo 6 a 30 C átomos. Alcoóis graxos aqui podem ser saturados ou insaturados e lineares ou ramificados. Além disso, estes alcoóis graxos podem em alguns casos ser parte da fase em óleo (III), se eles corresponderem quem à definição determinada aqui. Alcoóis que podem ser empregados são, por exemplo, decanol, decenol, octanol, octenol, dodecanol, dodecenol, octadienol, decadienol, dodecadienol, álcool oleílico, álcool ricinoleílico, álcool erucílico, álcool estearílico, álcool isosteárico, álcool cetílico, álcool laurílico, álcool miristílico, álcool aracidílico, álcool caprilílico, álcool caprílico, álcool linoleílico, álcool linolenílico e álcool benílico, e da mesma forma alcoóis de Guerbet dos mesmos, tal como, por exemplo, 2-octil-1-dodecanol, sendo possível para a lista a ser estendida virtualmente como desejado para outros alcoóis de química estrutural relacionada. Os alcoóis graxos preferivelmente originam-se de ácidos graxo naturais, sendo convencionalmente preparados a partir dos ésteres correspondentes dos ácidos graxos por redução. Frações de álcool graxo que são formadas por redução a partir de óleos graxos e gorduras de ocorrência natural, tal como sebo de carne de boi, óleo de amendoim, óleo de colza, óleo de caroço de algodão, óleo de soja, óleo de girassol, óleo de semente de palma, óleo de linhaça, óleo de milho, óleo de rícino, óleo de semente de colza, óleo de gergelim, manteiga de cacau e gordura de coco, podem também ser empregados.

Substâncias tendo propriedades de cuidado que podem ser empregadas de uma maneira excelente nas preparações cosméticas e/ou dermatologicamente ativas estabilizadas por meios dos métodos da invenção e compreendendo compostos fenólicos da fórmula (I), também incluem

- ceramidas, onde ceramidas são entendidas como significando N-acilsfingosinas (amidas de ácido graxo de esfingosina) ou análogos sintéticos de tais lipídios (assim chamados pseudo-ceramidas), que significativamente melhoram a capacidade de retenção de água do estrato córneo.
- fosfolipídeos, por exemplo lecitina de soja, lecitina de ovo e cefalinas,
- ácidos graxos
- fitosteróis e gorduras ou ceras contendo fitosterol

- vaselina, óleos de parafina e óleos de silicone; o último inclui, entre outros, dialquila e alquilarilsiloxanos, tal como dimetilpolissiloxano e metilfenilpolissiloxano, e da mesma forma derivados alcoxilados e quaternizados dos mesmos.

5 Hidrolisados de proteína animal e/ou de planta podem vantajo-  
samente da mesma forma ser adicionados a modalidades preferidas de pre-  
parações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamen-  
te ativas, da invenção. Substâncias que são vantajosas neste caso são, em  
particular, elastina, colágeno, queratina, proteína de leite, proteína de soja,  
10 proteína de aveia, proteína de ervilha, proteína de amêndoa e frações de  
proteína de trigo ou hidrolisados de proteína correspem quentes, e da mes-  
ma forma produtos de cem quensação dos mesmos com ácidos graxos, e  
hidrolisados de proteína quaternizados, o uso de hidrolisados de proteína de  
planta sendo preferido.

15 A fase aquosa das preparações de acordo com a presente in-  
venção opcionalmente vantajosamente compreende alcoóis, dióis ou polióis  
(alquila inferior), e éteres dos mesmos, preferivelmente etanol, isopropanol,  
propileno glicol, 1,2-hexanodiol, 1,2-octanodiol, 1,2-decanodiol, uma mistura  
de 1,2-hexanodiol e 1,2-octanodiol, uma mistura de 1,2-hexanodiol e 1,2-  
20 decanodiol, uma mistura de 1,2-octanodiol e 1,2-decanodiol, uma mistura de  
1,2-hexanodiol, 1,2-octanodiol e 1,2-decanodiol, glicerol, etileno glicol-  
monoetila ou éter monobutílico, monometil propileno glicol, éter monoetílico  
ou éter monobutílico, monometil dietileno glicol ou éter monoetílico e produ-  
tos análogos, e da mesma forma alcoóis (alquila inferior), por exemplo eta-  
25 nol, 1,2-propanodiol, glicerol, e, em particular, um ou mais espessantes que  
podem vantajosamente ser escolhidos a partir do grupo dióxido de silicone,  
silicatos de alumínio, polissacarídeos e derivados dos mesmos, por exemplo  
ácido hialurônico, goma xantana, hidroxipropilmetilcelulose, particularmente  
vantajosamente a partir do grupo poliacrilatos, preferivelmente um poliacrila-  
30 to do grupo assim chamado Carbopóis, por exemplo, grau de Carbopol-980,  
981, 1382, 2984, 5984, em cada caso individualmente ou em combinação.

Modalidades preferidas das preparações cosméticas e/ou far-

macêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção podem da mesma forma compreender anti-inflamatórios ativos e/ou compostos de alívio de coceira e/ou vermelhidão (anti-irritantes). Todos os anti-inflamatórios ativos ou de alívio vermelhidão e/ou compostos de alívio de coceira que são adequados ou habituais para aplicações cosméticas e/ou dermatológicas podem ser usados aqui. Compostos anti-inflamatórios ativos e de alívio de coceira e/ou vermelhidão que são vantajosamente empregados são substâncias anti-inflamatórias esteroides do tipo corticosteroide, tal como hidrocortisona, dexametasona, fosfato de dexametasona, metilprednisolona ou cortisona, sendo possível a lista ser estendida por adição de outros anti-inflamatórios esteroides. Anti-inflamatórios não esteroides podem da mesma forma ser empregados. Aqueles a serem mencionados aqui por meio de exemplo são oxicams, tais como piroxicam ou tenoxicam; salicilatos, tais como aspirina, Disalcid, Solprin ou fendosal; derivados de ácido acético, tais como diclofenaco, fenclofenaco, indometacina, sulindac, tolmetina, ou clindanaco; fenamatos, tais como mefenâmico, meclofenâmico, flufenâmico ou niflúmico; derivados de ácido propiônico, tais como ibuprofeno, naproxeno, benoxaprofeno ou pirazóis, tais como fenilbutazona, oxifenilbutazona, febrazona ou azapropazona.

Alternativamente, substâncias anti-inflamatórias naturais ou de alívio de vermelhidão - dor podem ser empregadas. Extratos de planta, frações de extrato de planta altamente ativas específicas e substâncias ativas altamente puras isoladas a partir de extratos de planta podem ser empregados. Extratos, frações e substâncias ativas de camomila, aloe vera, espécies de Comifora, espécies de Rubia, salgueiro, erva de salgueiro de louro rubra, aveias, e da mesma forma substâncias puras, tal como, entre outros, bisabolol, 7-glicosídeo de apigenina, ácido boswélico, fitosteróis, ácido glicirrízico, glabridina ou licocalcona A, são particularmente preferidos. As preparações compreendendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos podem da mesma forma compreender misturas de dois ou mais compostos anti-inflamatórios ativos. Bisabolol, ácido boswélico, e da mesma forma extratos e compostos ativos altamente puros isolados de avei-

as e Echinacea são particularmente preferidos para uso no contexto da invenção como substâncias anti-inflamatórias e de alívio de vermelhidão - e/ou coceira, e alfa-bisabolol e extratos e compostos ativos altamente puros isolados de aveias são especialmente preferidos.

5 A quantidade de anti-irritantes (um ou mais compostos) nas preparações é preferivelmente 0,0001% a 20% em peso, com preferência particular 0,0001% a 10% em peso, em particular 0,001% a 5% em peso, com base no peso total da preparação.

10 Modalidades preferidas das preparações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção podem vantajosamente da mesma forma compreender reguladores de retenção de umidade. As seguintes substâncias por exemplo são usadas como reguladores de retenção de umidade (hidratantes): lactato de sódio, ureia, alcoóis, sorbitol, glicerol, propileno glicol, 1,2-dióis alifáticos com um número de C de  
15 5-10, colágeno, elastina ou ácido hialurônico, adipatos de diacila, petrolato, ectoína, ácido urocânico, lecitina, panteol, fitantriol, licopeno, extrato de algas, ceramidas, colesterol, glicolípideos, quitosana, sulfato de condroitina, ácidos de poliamino e açúcares de poliamino, lanolina, ésteres de lanolina, aminoácidos, alfa-hidróxi ácidos (por exemplo ácido cítrico, ácido láctico, ácido maleico) e derivados dos mesmos, açúcares (por exemplo, inositol), alfa-hidróxi ácidos graxos, fitosteróis, ácidos de triterpeno, tal como ácido betulínico ou ácido ursólico, extratos de algas.

25 Modalidades preferidas das preparações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção podem vantajosamente da mesma forma compreender mono-, di- e oligossacarídeos, tais como, por exemplo, glicose, galactose, frutose, manose, açúcares de fruta e lactose.

30 Modalidades preferidas das preparações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção podem vantajosamente da mesma forma compreender extratos de planta que são preparados convencionalmente por extração da planta inteira porém da mesma forma em casos individuais exclusivamente a partir de flor e/ou folhas, madeira, casca ou raízes da planta. Em relação aos extratos de

lhas, madeira, casca ou raízes da planta. Em relação aos extratos de planta que podem ser usados, referência é feita em particular aos extratos que são listados na tabela a partir da página 44 da 3ª edição do Leitfaden zur Inhaltsstoffdeklaration kosmetischer Mittel [Manual of Declaration of the Constituents of Cosmetic Compositions], publicado por Industrieverband Körperpflegemittel und Waschmittel e.V. (IKW), Frankfurt. Extratos que são vantajosos em particular são aqueles de aloe, hamamélia, algas, casca de carvalho, erva de salgueiro de louro rubra, urtiga, urtiga morta, flores secas de lúpulo, camomila, milefólio, arnica, calêndula, raiz de bardana, rabo de cavalo, crataegus (hawtorn), flor de linden, amêndoa, agulha de pinheiro, castanha-da-índia, sândalo, junípero, coco, manga, abricó, laranja, limão, lima, toronja, maçã, chá-verde, pevide de toranja, trigo, aveia, cevada, salva, tomilho, tomilho silvestre, alecrim, bétula, malva, blusa de moça, casca de salgueiro, unha-de-gato, unha-de-cavalo *coltsfoot*, hibisco, ginseng e raiz de gengibre.

Neste contexto, os extratos de aloe vera, camomila, algas, alecrim, calêndula, ginseng, pepino, salva, urticária, flor de linden, arnica e hamamélia são particularmente preferidos. Misturas de dois ou mais extratos de planta pode da mesma forma ser empregada. Agentes de extração que podem ser usados para a preparação de extratos de planta mencionados são, entre outros, água, alcoóis e misturas dos mesmos. Neste contexto, entre os alcoóis, alcoóis inferiores, tal como etanol e isopropanol, porém da mesma forma alcoóis poli-ídricos, tais como etileno glicol, propileno glicol e butileno glicol, são preferidos e em particular ambos como o agente de extração exclusivo e em misturas com água. Os extratos de planta podem ser empregados igualmente na forma pura e na forma diluída.

Modalidades preferidas das preparações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção podem em numerosos casos vantajosamente compreender os seguintes conservantes:

Conservantes que são preferivelmente escolhidos aqui são aqueles tais como ácido benzoico, seus ésteres e sais, ácido propiônico e

seus sais, ácido salicílico e seus sais, ácido 2,4-hexadienoico (ácido sórbico) e seus sais, formaldeído e paraformaldeído, éter 2-hidroxibifenílico e seus sais, N-óxido de 2-zincosulfidopiridina, sulfitos inorgânicos e bissulfitos, iodato de sódio, clorobutanolum, ácido 4-etilmercuril(II)-5-amino-1,3-bis(2-  
5 hidroxibenzoico), seus sais e ésteres, ácido desidracético, ácido fórmico, 1,6-bis(4-amidino-2-bromofenóxi)-n-hexano e seus sais, o sal de sódio de ácido etilmercúrio(II)-tiossalicílico, fenilmercúrio e seus sais, ácido 10-undecilênico e seus sais, 5-amino-1,3-bis(2-etil-hexil)-5-metil-hexaidropirimidina, 5-bromo-5-nitro-1,3-dioxano, 2-bromo-2-nitro-1,3-  
10 propanodiol, álcool 2,4-diclorobenzílico, N-(4-clorofenil)-N'-(3,4-diclorofenil)ureia, 4-cloro-m-cresol, éter 2,4,4'-triclora-2'-hidroxidifenílico, 4-cloro-3,5-dimetilfenol, 1,1'-metileno-bis(3-(1-hidroximetil-2,4-dioximidazolidin-5 il)ureia), cloridrato de poli(hexametileno diguanida), 2-fenoxietanol, hexametilenotetramina, cloreto de 1-(3-cloroalil)-3,5,7-triaza-1-azoniaada-  
15 mantano, 1-(4-clorofenóxi)-1-(1H-imidazol-1-il)-3,3-dimetil-2-butanona, 1,3-bis-(hidroximetil)-5,5-dimetil-2,4-imidazolidinadiona, álcool benzílico, octopirox, 1,2-dibromo-2,4-dicianobutano, 2,2'-metilenobis(6-bromo-4-clorofenol), bromoclorofeno, mistura de 5-cloro-2-metil-3(2H)-isotiazolinona e 2-metil-3(2H)isotiazolinona com cloreto de magnésio e nitrato de magnésio, 2-  
20 benzil-4-clorofenol, 2-cloroacetamida, clorexidina, acetato de clorexidina, Gliconato de clorexidina, cloridrato de clorexidina, 1-fenoxipropan-2-ol, brometo e cloreto de N-alkuil(C<sub>12</sub>-C<sub>22</sub>)trimetilamônio, 4,4-dimetil-1,3-oxazolidina, N-hidroximetil-N-(1,3-di-(hidroximetil)-2,5-dioxoimidazolidin-4-il)-N'-hidroxi-  
etilureia, 1,6-bis(4-amidinofenóxi)-n-hexano e seus sais, glutaraldeído, 5-etil-  
25 1-aza-3,7-dioxabicyclo[3.3.0]octano, 3-(4-clorofenóxi)-1,2-propanodiol, hiaminas, cloreto de alquil-(C<sub>8</sub>-C<sub>18</sub>)-dimetilbenzilamônio, brometo de alquil-(C<sub>8</sub>-C<sub>18</sub>)-dimetilbenzilamônio, sacarinato de alquil-(C<sub>8</sub>-C<sub>18</sub>)-dimetilbenzil-amônio, hemiformal de benzila, butilcarbamatato de 3-iodo-2-propinila, hidroximetilaminoacetato de sódio ou hidroximetilaminoacetato de sódio.

30 Em vários casos pode da mesma forma ser vantajoso empregar substâncias que são principalmente empregadas para inibição do crescimento de micro-organismos indesejáveis ou em organismos animais em prepa-

rações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção. Neste caso, além de conservantes convencionais, outros compostos ativos que são também mencionados, além do grupo grande de antibióticos convencionais são, em particular, os produtos relevantes para cosméticos, tal como triclosano, climbazol, octoxiglicerol, octopirox (1-hidróxi-4-metil-6-(2,4,4-trimetilpentil)-2(1H)-piridona, 2-aminoetanol), quitosana, farnesol, monolaurato glicerol ou combinações das substâncias mencionadas, que são empregadas, entre outros, contra odor sob o braço, odor do pé ou formação de caspa.

10 Além disso, preparações cosméticas e/ou farmacêuticas, especialmente dermatologicamente ativas da invenção podem da mesma forma compreender substâncias tendo uma ação refrescante. Compostos refrescantes ativos individuais que são preferidos para uso no contexto da presente invenção são listados abaixo. A pessoa versada é capaz de suplementar a

15 seguinte lista com um número grande de outros compostos refrescantes ativos; os compostos refrescantes ativos listados podem da mesma forma ser empregados em combinação um com outro: l-mentol, d-mentol, mentol racêmico, acetal glicerol de mentona (nome comercial: Frescolat®MGA), lactato de mentila (nome comercial: Frescolat®ML, lactato de mentila é preferivelmente lactato de l-mentila, em particular l-lactato de l-mentila), amidas de ácido mentil-3-carboxílico substituídas (por exemplo N-etilamida de ácido mentil-3-carboxílico), 2-isopropil-N-2,3-trimetilbutanamida, amidas de ácido ciclo-hexanocarboxílico substituídas, 3-mentoxipropano-1,2-diol, carbonato de 2-hidroxietilmentila, carbonato de 2-hidroxi-propil mentila, N-éster metílico

20 de acetilgicina, isopulegol, ésteres de ácido mentil hidroxicarboxílico (por exemplo 3-hidroxi-butirato de mentila), succinato de monomentila, 2-mercaptociclo-decanona, 2-pirrolidin-5-onocarboxilato de mentila, 2,3-di-ídróxi-p-mentano, 3,3,5-trimetilciclo-hexanona glicerol cetal, 3,6-di- e trioxalcanoatos de 3-mentila, metoxiacetato de 3-mentila, icilina.

30 Compostos refrescantes ativos preferidos são: l-mentol, d-mentol, mentol racêmico, acetal glicerol de mentona (nome comercial: Frescolat®MGA), lactato de mentila (preferivelmente lactato de l-mentila, em par-

5 ticular l-lactato de l-mentila, nome comercial: Frescolat®ML), amidas de ácido mentil-3-carboxílico substituído (por exemplo N-etilamida de ácido mentil-3-carboxílico), 2-isopropil-N-2,3-trimetilbutanamida, amidas de ácido ciclohexanocarboxílico substituídas, 3-mentoxipropano-1,2-diol, carbonato de 2-hidroxtetil mentila, carbonato de 2-hidroxiopropil mentila, isopulegol.

Compostos refrescantes ativos particularmente preferidos são: l-mentol, mentol racêmico, acetal glicerol de mentona (nome comercial: Frescolat®MGA), lactato de mentila (preferivelmente lactato de l-mentila, em particular l-lactato de l-mentila, nome comercial: Frescolat®ML), 3-mentoxipropano-1,2-diol, carbonato de 2-hidroxietyl mentila, carbonato de 2-hidroxiopropil mentila.

Compostos refrescantes ativos muito particularmente preferidos são: l-mentol, acetal glicerol de mentona (nome comercial: Frescolat®MGA), lactato de mentila (preferivelmente lactato de l-mentila, em particular l-lactato de l-mentila, nome comercial: Frescolat®ML).

A concentração de uso dos compostos refrescantes ativos a serem empregados está, dependendo da substância, preferivelmente na faixa de concentração de 0,01% a 20% em peso, e mais preferivelmente na faixa de concentração de 0,1% a 5% em peso, com base no peso total da preparação cosmética ou farmacêutica completa (pronta para uso).

A invenção é também descrita pelas figuras acompanhantes e exemplos, sem limitar o escopo das reivindicações.

Figura 1: Uma microfotografia de uma emulsão de óleo em água em pH 6,9 contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com hidróxido de sódio, cristais de ácido fenilbenzimidazol sulfônico sendo claramente visível;

Figura 2: Uma microfotografia de emulsão de óleo em água do exemplo 1c, formulação A (neutralizada com Arginina em pH 7,0);

Figura 3: Uma microfotografia de uma emulsão de óleo em água exemplo 1c, formulação B (neutralizada com Trietanolamina em pH 7,0);

Figura 4: Uma microfotografia de uma emulsão de óleo em água exemplo 1c, formulação C (neutralizada com Hidróxido de sódio em pH 7,0);

Figura 5: Uma microfotografia de emulsão de óleo em água do exemplo 1a,

formulação A (neutralizada com Arginina em pH 6,0) mostrando que nenhuma cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico ocorre;

Figura 6: uma microfotografia de uma emulsão de óleo em água do exemplo 1a, formulação B (neutralizada com Trietanolamina em pH 6,0), mostrando cristais de ácido fenilbenzimidazol sulfônico; e

Figura 7: uma microfotografia de uma emulsão de óleo em água exemplo 1a, formulação B (neutralizada com Hidróxido De sódio em pH 6,0), mostrando cristais de ácido fenilbenzimidazol sulfônico.

### Exemplos

10 Ácido 2-fenilbenzimidazol-5-sulfônico comercialmente disponível foi usado [Neo Heliopan<sup>®</sup> Hydro, from Symrise GmbH & Co. KG, Holzmin-den, Alemanha]. A menos que de outra maneira declarado, os dados refe-rem-se ao peso.

### Cristalização

15 Por meio de exemplo, observações comparativas entre formulações contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminoácidos básicos com formulações contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico neutralizado com aminas tradicionais ou bases duras são listadas abaixo:

### Exemplo 1a.

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de vctela	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decila	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil- hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Par- kii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, dia- zolidenil ureia, Metil parabeno, pro- pil parabeno,	0,44	0,44	0,44

	Neo Heliopan Hydro	Ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Arginina		2,00	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	1,60	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,50
	pH depois da fabricação		6,0	6,0	6,0

**Exemplo 1b.**

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decila	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etilhexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1.2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Arginina		2,05	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	1,70	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,65
	pH depois da fabricação		6,5	6,5	6,5

**Exemplo 1c.**

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00

	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decíla	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Arginina		2,10	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	2,00	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,75
	pH depois da fabricação		7,0	7,0	7,0

#### Procedimento de fabricação

Ingredientes da fase A foram misturados e aquecidos com agitação a 80°C. Os ingredientes da fase A foram misturados juntamente e aquecidos a 80°C com agitação vigorosa até que todos os ácidos fenilbenzimidazol sulfônicos foram neutralizados e dissolvidos em solução. Fases A & B foram em seguida misturadas juntas com agitação e permitidas resfriar em temperatura ambiente e postas em teste de armazenamento.

Resultados: Nenhuma cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi observada depois de fabricação de emulsões 1c - A, B & C depois de 1 mês de armazenamento a 5°C e temperatura ambiente (22°C) (vide figura 2-7).

Cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi vista em todas as outras emulsões exceto de 1a - A e 1b - A depois do mesmo período de tempo.

**Exemplo 2a.**

	Ingrediente	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decíla	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Lisina		2,00	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	1,65	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,55
	pH depois da fabricação		6,2	6,2	6,2

**Exemplo 2b.**

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decíla	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64

	glicol				
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Lisina		2,1	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	1,7	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,7
	pH depois da fabricação		6,5	6,5	6,5

**Exemplo 2c.**

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decila	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Lisina		2,2	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	2,0	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,8
	pH depois da fabricação		7,0	7,0	7,0

Procedimento de fabricação

Ingredientes da fase A foram misturados e aquecidos com agitação a 80°C. Os ingredientes da fase A foram misturados juntamente e aquecidos a 80°C com agitação vigorosa até que todo ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi neutralizado e dissolvido em solução. Fases A & B foram em seguida misturadas juntas com agitação e permitidas resfriar em temperatura ambiente e postas em teste de armazenamento.

Resultados. Nenhuma cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi observada depois da fabricação de emulsões 2c - A, B & C depois de 1 mês de armazenamento a 5°C e temperatura ambiente (22°C).

Cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi vista em todas as outras emulsões exceto 2a - A e 2b - A depois do mesmo período de tempo.

Nos exemplos acima 1 e 2, os sais de ácido fenilbenzimidazol sulfônico podem ser preparados como uma pré-mistura aquosa e adicionados a fase B.

### Exemplo 3a.

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decila	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Histidina		2,5	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	1,6	0,0
	Hidróxido de só-		0,0	0,0	4,5

	dio			
	pH depois da fabricação		6,1	6,0

**Exemplo 3b.**

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decila	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Histidina		2,55	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	1,7	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,7
	pH depois da fabricação		6,5	6,5	6,5

**Exemplo 3c.**

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decila	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00

B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Histidina		2,60	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	2,0	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,8
	pH depois da fabricação		7,0	7,0	7,0

#### Procedimento de fabricação

Ingredientes da fase A foram misturados e aquecidos com agitação a 80°C. Os ingredientes da fase A foram misturados juntamente e aquecidos a 80°C com agitação vigorosa até que todo ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi neutralizado e dissolvido em solução. Fases A & B foram em seguida misturadas juntas com agitação e permitidas resfriar em temperatura ambiente e postas em teste de armazenamento.

Resultados. Nenhuma cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi observada depois da fabricação de emulsões 3c - A, B & C depois de 1 mês de armazenamento a 5°C e temperatura ambiente (22°C).

Cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi vista em todas as outras emulsões com exceção de 3a - A e 3b - A depois do mesmo período de tempo.

#### Exemplo 4a

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decila	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00

	shea				
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	Ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Ornitina		2,2	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	1,6	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,5
	pH depois da fabricação		6,0	6,0	6,0

**Exemplo 4b.**

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decila	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Ornitina		2,35	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	1,7	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,65

	pH depois da fabricação		6,5	6,5	6,5

**Exemplo 4c.**

	Ingrediente:	INCI	A % em p.	B % em p.	C % em p.
A	Emulgade SE PF	Glicerilestearato, Álcool cetearílico, Palmitato de cetila	6,00	6,00	6,00
	Lanette O	Álcool cetearílico	1,50	1,50	1,50
	CetioL V	Oleato de Decila	4,00	4,00	4,00
	Cetiol 868	Estearato de Etil-hexila	8,00	8,00	8,00
	Manteiga de shea	Butyrospermum Parkii	3,00	3,00	3,00
B	Água	Água	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,64	2,64	2,64
	Germaben 2	Propileno Glicol, diazolidenil ureia, Metil parabeno, propil parabeno,	0,44	0,44	0,44
	Neo Heliopan Hydro	ácido fenilbenzimidazol sulfônico	3,30	3,30	3,30
	Ornitina		2,5	0,0	0,0
	Trietanolamina		0,0	2,0	0,0
	Hidróxido de sódio		0,0	0,0	4,75
	pH depois da fabricação		7,0	7,0	7,0

**Procedimento de fabricação**

- Ingredientes da fase A foram misturados e aquecidos com agitação a 80°C. Os ingredientes da fase A foram misturados juntamente e aquecidos a 80°C com agitação vigorosa até que todo ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi neutralizado e dissolvido em solução. Fases A & B foram em seguida misturadas juntas com agitação e permitidas resfriar em temperatura ambiente e postas em teste de armazenamento.
- 10 Resultados. Nenhuma cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi observada depois da fabricação de emulsões 4c - A, B & C depois de 1 mês

de armazenamento a 5°C e temperatura ambiente (22°C).

Cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico foi vista em todas as outras emulsões exceto 4a - A e 4b - A depois do mesmo período de tempo.

## 5 Exemplos de formulação.

**Exemplo de formulação 1** Creme de protetor solar macia (O/A), *in vitro* SPF 5, resistente à água

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
A	Emulsifos	Fosfato de Potássio Cetila, Glicerídeos de Palma Hidrogenados,	1,50
	Cutina GMS/V	Estearato de Glicerila	2,00
	Coferol 1250	Acetato de Tocoferila	0,50
	Lanette 16	Álcool cetílico	1,00
	Tegosoft TN	Benzoato de C12-15 alquila	24,00
	Prisorine 3505	Ácido Isosteárico	1,00
	B	Água, dist.	Água (Água)
Neo Heliopan® Hydro		Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico	3,0
Lisina		Lisina	2,10
EDETA B liq.		Tetrassódio EDTA	0,20
Glicerol, 99%,		Glicerina	3,00
Fenoxietanol		Fenoxietanol	0,70
Solbrol M		Metilparabeno	0,20
Solbrol P		Propilparabeno	0,10
Carbopol ETD 2050	Carbomer	0,20	
C	Óleo de perfume	Perfume (Fragrância)	0,30

Procedimento de fabricação.

Parte A: Aquecimento a cerca de 85°C.

10 Parte B: Peso em matérias-primas sem Carbopol.

Carbopol disperso aqui usando o Ultra Turrax.

Aquecimento a cerca de 85°C. Adicionar B a A. e em seguida homogeneizar enquanto quente (Ultra Turrax). Leva a resfriamento com agitação.

- 5 Separe C: Adicionar a A/B a 30°C ou menos com agitação valor do pH da emulsão 6,2.

**Formulação Exemplo 2. Loção de protetor solar (O/A), *in vitro* SPF 20**

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
A	Emulsifos	Fosfato de Potássio Cetila, Glicerídeos de Palma Hidrogenados,	1,50
	Cutina GMS/V	Estearato de Glicerila	2,00
	Coferol 1250	Acetato de Tocoferila	0,50
	Lanette 16	Álcool cetílico	1,00
	Tegosoft TN	Benzoato de C12-15 alquila	10,60
	Prisorine 3505	Ácido Isosteárico	1,00
	Neo Heliopan® 357	Butil Metoxidibenzolimetano	2,00
	Neo Heliopan® AV	Metoxicinamato de Etilhexila	5,00
	EDETA BD	EDTA Dissódico	0,10
	Carbopol ETD 2050	Carbômero	0,20
B	Água, dist.	Água (Água)	Ad 100
	Glicerol, 99%,	Glicerina	3,00
	Dragocid Líquido	Fenoxietanol, Metilparabeno, Etilparabeno, Butilparabeno, Propilparabeno, Isobutilparabeno,	0,80
C	L-arginina CG	Arginina	0,40
	Neo Heliopan® Hydro, 25% solução, resistência neutralizada com Arginina	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico, arginina,	8,00
D	Óleo de perfume	Perfume (Fragrância)	0,30

Procedimento de fabricação.

Parte A: Aquecimento a cerca de 85°C.

Parte B: Peso em matérias-primas sem Carbopol.

Carbopol disperso aqui usando Ultra Turrax.

Aquecimento a cerca de 85°C. Adicionar B a A.

- 5 Parte C: Imediatamente adicionar a A/B e em seguida homogeneizar enquanto quente (Ultra Turrax). Leva a resfriamento com agitação.

Parte D: Adicionar e agitar em.

valor de pH - da emulsão 6,0

**Exemplo de formulação 3** Leite de Protetor solar de teor de óleo baixo

10 (O/A), *in vitro* SPF 25

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	A % (p.)	B % (p.)
A	Tegin M	Estearato de Glicerila	2,50	2,50
	Tagat S	PEG-30 Estearato de Glicerila	1,95	1,95
	Lanette O	Álcool Cetearílico	2,20	2,20
	Coferol 1250	Acetato de Tocoferila	0,50	0,50
	Phenonip	Fenoxietanol (e) metilparabeno (e) Butilparabeno (e) etil parabeno (e) Propilparabeno	0,15	0,15
	Neo Heliopan® AV	Metoxicinamato de Etil-hexila	5,00	5,00
	Neo Heliopan® 303	Octocrileno	5,00	5,00
	Neo Heliopan® 357	Butil Metoxidibenzolimetano	2,00	2,00
	EDETA BD	EDETA Dissódico	0,10	0,10
	Carbopol 2050	Carbômero	0,40	0,40
B	Água, dist.	Água (Água)	Ad 100	Ad 100
	Neo Heliopan® Hydro	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico	3,30	3,30
	Neo Heliopan® AP	Tetrasulfonato de Dibenzimidazol de Fenila de Dissódio, arginina	2,20	2,20
	Arginina	Arginina	3,50	2,86

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	A % (p.)	B % (p.)
	1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol	2,00	2,00
	Phenonip	Fenoxietanol (e) Metilparabeno (e) Butilparabeno (e) Etilparabeno (e) Propilparabeno	0,30	0,30
<b>C</b>	Água, dist.	Água (Água)	19,00	19,00
	NaOH, 10% de resistência,	Hidróxido de sódio	0,00	1,70
<b>D</b>	Óleo de perfume	Perfume (Fragrância)	0,30	0,30
	pH depois da fabricação		6,0	6,5

Procedimento de fabricação.

Parte A: Aquecimento a 80-85°C.

Parte B: Aquecimento a 80-85°C, Adicionar parte B a parte A com agitação.

Parte C: Carbopol Disperso na água e neutralizar com NaOH, com agitação. Adicionar parte C a cerca de 60°C com agitação. Permitir resfriar em Temperatura ambiente.

Parte D: Adicionar e agitar.

10 **Exemplo de formulação 4** Loção de Protetor solar (O/A), *in vitro* SPF 18

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
<b>A</b>	<b>Eumulgin VL 75</b>	Glicosídeo de Lauril (e) Poligliceril-2-Dipoliidroxistearato (e) Glicerina	3.00
	Tegosoft TN	Benzoato de C12-25 alquila	20,00
	Coferol 1250	Acetato de Tocoferila	0,50
	Óleo de perfume	Perfume (Fragrância)	0.20
	Neo Heliopan® 357	Butil Metoxidibenzolimetano	2.00

	Neo Heliopan® E1000	P-Metoxicinamato de Isoamila	5,00
	Neo Heliopan® 303	Octocrileno	5,00
	Carbopol 2050 ETD	Carbômero	0,35
	Pemulen TR-1	Acrilatos/Polímero cruzado de Acrilato de C10-30 alquila	0,15
	EDETA BD	EDTA Dissódico	0,10
B	Água, dist.	Água (Água)	Ad 100
	Glicerol, 99%,	Glicerina	5,00
	Dragocid Líquido	Fenoxietanol, Metilparabeno, Etilparabeno, Butilparabeno, Propilparabeno, Isobutilparabeno,	0.80
	Neo Heliopan® Hydro	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico	2.00
	Histidina	Histidina	2.30

Procedimento de fabricação.

- Parte A: Dissolver os sólidos nos óleos e filtros de UV líquidos (aquecer a cerca de 70°C). Permitir resfriar a cerca de 30°C, adicionar os componentes restantes aparte de Carbopol e Pemulen e misturar em temperatura ambiente (agitar durante cerca de 5 minutos). Agitar em Carbopol e Pemulen.in
- 5 Parte B: Adicionar água e glicerol, em seguida dispersar Neo Heliopan® Hydro com agitação vigorosa e aquecer a 70°C, adicionar histidina até que todo Neo Heliopan® Hydro foi dissolvido e adicionar todo parte B a parte A
- 10 com agitação. Agitar durante cerca de 60 minutos com resfriamento e homogenisar usando o Ultra Turrax.
- pH - valor de emulsão 6,2.

**Exemplo de formulação 5** Creme de Protetor solar (AO), *in vitro* SPF 10, resistente à água

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
A	<u>Dehymuls PGPH</u>	Poligliceril-2 Dipolihidroxiestearato	5,00
	Coferol 1250	Acetato de Tocoferila	0,50
	Permulgin 3220	Ozokerite	0,50
	Estearato de alumínio	Estearato de Alumínio	0,50
	Tegosoft TN	Benzoato de C12-15 alquila	25,00
	Neo Heliopan® 357	Butil Metoxidibenzolimetano	2,00
	EDETA BD	EDTA Dissódico	0,10
B	Água, dist.	Água (Água)	Ad 100
	Glicerol, 99%,	Glicerina	4,00
	Dragocid Líquido	Fenoxietanol, Metilparabeno, Etilparabeno, Butilparabeno, Propilparabeno, Isobutilparabeno,	1,00
	Neo Heliopan® Hydro, 25% de solução de resistência neutralizada com Arginina	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico, Arginina,	20,00
	Lisina	Lisina	0,20
	Sulfato de magnésio	Sulfato de magnésio	0,50

Procedimento de fabricação.

Parte A: Aquecimento a cerca de 85°C.

Parte B: Aquecimento a cerca de 85°C Adicionar B a A.. Permitir resfriar com agitação em seguida homogeneizar.

**Exemplo de formulação 6** Creme mole de Protetor solar (A/O), *in vitro* SPF

50

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)	
A	<u>Dehymuls PGPH</u>	Poligliceril-2 Dipoliidroxiestearato	5,00	
	Coferol 1250	Acetato de Tocoferila	0,50	
	Permulin 3220	Ozokerite	0,50	
	Estearato de zinco	Estearato de Zinco	0,50	
	Tegosoft TN	Benzoato de C12-15 alquila	10,00	
	Neo Heliopan®BB	Benzofenona-3	3,00	
	Neo Heliopan® HMS	Homossalato	5,00	
	Neo Heliopan® 303	Octocrileno	5,00	
	Neo Heliopan® OS	Salicilato de Etil-hexila	5,00	
	Uvinul (T-150)	Etil-hexil Triazona	3,00	
	Óxido de zinco neutro	Óxido de zinco	5,00	
	B	Água, dist.	Água (Água)	Ad 100
		EDETA BD	EDTA Dissódico	0,10
Glicerol		Glicerina	4,00	
Dragocid Líquido		Fenoxietanol, Metilparabeno, Etilparabeno, Butilparabeno, Propilparabeno, Isobutilparabeno,	1,00	

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
	Neo Heliopan® Hydro, 20% solução de resistência neutralizado com Lisina	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico, Lisina,	10,00
	Arginina	Arginina	0,15
	Sulfato de magnésio	Sulfato de magnésio	0,50
C	Óleo de Perfume	Perfume (Fragrância)	0,20

Procedimento de fabricação.

Parte A: Aquecimento a cerca de 85°C.

5 Parte B: Aquecimento a cerca de 85°C (sem óxido de zinco; óxido de zinco disperso aqui usando Ultra Turrax). Adicionar B a A. Permitir resfriar com agitação.

Parte C: Adicionar e em seguida homogeneizar.

**Exemplo de formulação 7** Creme para o dia com proteção de UV de espectro amplo

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
A	Emulgade PL 68/50	Cetearil Glicosídeo (e) Ál- cool Cetearílico	4,50
	Cetiol PGL	Hexildecanol (e) Laurato de Hexildecila	8,00
	Myritol 331	Cocoglicerídeos	8,00
	Coferol 1250	Acetato de Tocoferila	0,50
	Neo Heliopan® 303	Octocrileno	3,00
	Neo Heliopan® OS	Salicilato de Etil-hexila	5,00
B	Água, dist.	Água (Água)	Ad 100
	Mistura aquosa de 15% de Neo Heliopan® Hydro e 10% de Neo Heliopan® AP	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico, Tetrasulfonato de Dibenzi- midazol de	22,00

	neutralizado com Arginina	Fenila de Dissódio, Arginina,	
	Glicerol	Glicerina	3,00
	Dragocid Líquido	Fenoxietanol (e) Metilparabeno (e) Butiparabeno (e) Etiparabeno (e) Propilparabeno	0,50
C	Água, dist.	Água (Água)	25,00
	Carbopol ETD 2050	Carbômero	0,20
	Arginina	Arginina	0,40
D	Óleo de perfume	Perfume (Fragrância)	0,30

Procedimento de fabricação.

Parte A: Aquecimento a 80°C.

Parte B: Aquecimento a 80°C Adicionar a parte A com agitação.

- 5 Parte C: Carbopol Disperso em água e neutralizar com solução de hidróxido de sódio. Adicionar a parte A/B a cerca de 55°C.

pH - valor de emulsão 6,1.

**Exemplo de formulação 8** Protetor solar em spray *in vitro* SPF 20

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
A	Água, demin.	Água (Água)	Ad 100
	Glicerol, 99%,	Glicerina	4,00
	Hydrolyte 5	1,2-Pentileno Glicol	5,00
	D-Pantenol	Pantenol	0,50
	Lara Care UM-200	Galactoarabinan	0,25
B	Baysilone oil M 10	Dimeticona	1,00
	Edeta BD	EDTA Dissódico	0,10
	Coferol 1250	Acetato de Tocoferila	0,50
	Cetiol OE	Éter Dicaprílico	3,00
	Neo Heliopan® HMS	Homossalato	5,00

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
	Neo Heliopan® AV	Metoxicinamato de Etil-hexila	6,00
	Neo Heliopan® 357	Butil Metoxidibenzoilmetano	1,00
	Tinosorb®S	Bis Etil-hexilaoxifenol Metoxifenil Triazina	2,00
	alfa-Bisabolol	Bisabolol	0,10
	Pemulen TR-2	Acrilatos/Polímero cruzado de Acrilato de C10-30 alquila	0,25
C	Fenoxietanol	Fenoxietanol	0,70
	Solbrol M	Metilparabeno	0,20
	Solbrol P	Propilparabeno	0,10
	Neo Heliopan® Hydro, 25% de solução de resistência neutralizada com Arginina	Ácido Fenilbenzimidazol Sul- fônico, arginina,	8,00
	Arginina	Arginina	0,40
D	Óleo de perfume	Fragrância (Parfum)	0,20

#### Procedimento de fabricação

Parte A: Dissolver Lara Care A-200 nos outros componentes da parte A com agitação.

Parte B: Peso em todas as matérias-primas (sem Pemulen) e dissolver as substâncias cristalinas com aquecimento. Pemulen disperso aqui. Adicionar  
5 parte B a parte A em seguida homogeneizar durante 1 minuto.

Adicionar parte C+D e homogeneizar novamente durante 1-2 minutos usando Ultra Turrax.

valor de pH - da formulação 6,1.

**Exemplo de formulação 9** Gel de hidrodispersão de Protetor solar (bálsamo)

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
A	Água, dist.	Água (Água)	Ad 100
	Carbopol Ultrez 21	Acrilatos/Polímero cruzado de Acrilato de C10-30 alquila	1,00
	Trietanolamina	Trietanolamina	1,20
	Lisina	Lisina	1,50
B	Neo Heliopan® Hydro, 20% de solução de resistência neutralizada com Lisina	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico, Lisina,	10,00
C	Neo Heliopan® E1000	P-I-Metoxicinamato de de Isoamila	3,00
	Neo Heliopan® 357	Butil Metoxidibenzoilmetano	2,00
	Miristato de Isopropila	Miristato de Isopropila	4,00
	Baysilone oil PK 20	Fenil Trimeticona	3,00
	Dragocid Líquido	Fenoxietanol (e) Metilparabeno (e) Butiparabeno (e) Etiparabeno (e) Propilparabeno	0,50
	Óleo de perfume	Perfume (Fragrância)	0,30
	Edeta BD	EDTA Dissódico	0,10
	alfa Bisabolol	alfa Bisabolol	0,10

Procedimento de fabricação.

5 Parte A: Carbopol Disperso em água e neutralizar com solução de trietanolamina.

Parte B: Adicionar a parte A com agitação.

Parte C: Dissolver componentes cristalinos nas outras matérias-primas da parte C com aquecimento (max.40°C) e adicionar a parte A/B. Agitar bem e em seguida homogeneizar. (Homozenta).

valor de pH - da formulação 6,2.

**Exemplo de formulação 10** Condicionador de Cabelo com filtros de UV

Parte	Matérias-primas	Nome de INCI	% (p.)
A	Lanette O	Álcool Cetearílico	4,0
	<b>Dragoxat 89</b>	Isononanoato de Etil-hexila	4,0
	<b>Emulsifos</b>	Fosfato de Potássio Cetila, Glicerídeos de Palma Hidrogenados,	0,50
B	Natrosol 250 HR	Hidroxietilcelulose	0,25
	Água, dist.	Água (Água)	Ad 100
	<b>Neo Heliopan® Hydro</b>	Ácido Fenilbenzimidazol Sul- fônico	2,00
	L - Arginina	Arginina	1,23
	Edeta BD	EDTA Dissódico	0,05
	<b>Dragocid Líquido</b>	Fenoxietanol (e) Metilparabe- no (e) Butiparabeno (e) Etiparabeno (e) Propilparabeno	0,80
C	Dow Corning 949 Emul- são Catiônica	Amodimeticona, Cloreto de Cetrimônio, Trideceth-12,	2,00
	Dow Corning 5200	Laurilmeticona Copoliol	0,50
	<b>Óleo de perfume</b>	Perfume (Fragrância)	0,80

Procedimento de fabricação.

Parte A: Aquecimento a 80°C.

Parte B: Swell Natrosol em água, Neo Heliopan Hydro e Arginina, adicio-  
5 nar Dragocid Líquido e aquecer a 80°C. Adicionar a parte A com agitação e  
emulsificar. Resfriar com agitação.

Parte C: Adicionar a 35°C e resfriar em Temperatura ambiente com agita-  
ção.

valor de pH: 6,1

10 **Exemplo de formulação 11** Gel Aquoso de Espectro Amplo *in vitro* SPF  
12,0

	Ingredientes	INCI-nome	%
A	Água desmineralizada	Água (Água)	Ad 100
	Pasme XT	Goma Desidroxantana	1,00

B	Água desmineralizada	Água (Água)	15,00
	Neo Heliopan® Hydro	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico	3,00
	Neo Heliopan® AP	Tetrasulfonato de Dibenzimidazol de Fenila de Dissódio	3,00
	L-arginina	Arginina	3,20
C	Symdiol 68	1,2-Hexanodiol e 1,2-Octanodiol	0,50
	Hydrolite 5	Pentileno Glicol	2,00
	Dragoderm	Glicerina, Triticum Vulgare (Trigo) Glúten, Água (Água)	2,00
D	Dow Corning 193	PEG-12 Dimeticona	1,00
	Etanol 96%	SD-álcool 39-C	10,00
	Perfume	Fragrância	0,10

#### Procedimento de fabricação

Parte A: Agitar Pasmex XT na água com agitação até que seja inchado e um gel formado

Parte B: Agitar os ingredientes juntos e adicionar a parte A e em seguida a adicionar Partes C com agitação até que uniforme e em seguida adicionar Parte D com agitação suave.

valor de pH - da formulação 6.0

A mesma formulação em que arginina foi substituída com hidróxido de sódio para neutralizar o ácido fenilbenzimidazol sulfônico com a fórmula tendo um pH de 7,3 produziu um SPF *in vitro* de 9,2. Isto indica que o uso de aminas básicas para neutralizar ácido fenilbenzimidazol sulfônico em um pH abaixo de 7,0 em preparações cosméticas ou dermatológicas aumenta a proteção solar da formulação comparada a outras bases de neutralização em que o valor de pH - da emulsão é maior do que 7,0.

15 **Exemplos de formulação 12** Emulsões de O/A de Espectro amplo resistentes a água *in vitro* SPF 50+

	Ingredientes	INCI	A % em p/p	B % em P/p	C % em p/p
A	Emulsifos	Fosfato de Potássio Cetila, Glicerídeos de Palma Hidrogenados,	3,50	3,50	3,50

	Lanette O	Álcool cetearílico	1,00	1,00	1,00
B	Neo Heliopan® HMS	Homossalato	5,00	5,00	5,00
	Neo Heliopan® 303	Octocrileno	10,00	10,00	10,00
	Neo Heliopan® OS	Salicilato de Etil-hexila	5,00	5,00	5,00
	Neo Heliopan® 357	Butil Metoxidibenzoilmetano	5,00	4,50	5,00
	Eusolex (T2000)	Dióxido de titânio, Alumínio, Simeticona,	4,00	4,00	4,00
	Tinosorb(S)	Bis Etil-hexilaoxifenol Me- toxifenil Triazina	0,00	4,50	3,00
	Abil Wax 9801	cetil Dimeticona	1,00	1,00	1,00
	Silcare Silicone 41M65	Estearil Dimeticona	1,00	1,00	1,00
	Baysilone Oil PK 20	Fenil Trimeticona	2,00	2,00	2,00
	Isoadipat	Di--isopropiladipato	2,00	2,00	2,00
	Tocoferilacetat	Acetato de Tococferila	0,50	0,50	0,50
	Antaron V216	VP/Copolímero de Hexade- ceno	0,50	0,50	0,50
	EDTA BD	EDTA Dissódico	0,10	0,10	0,10
	Keltrol T	Goma Xantana	0,50	0,50	0,50
	Água desmineralisa- da	Água (Água)	Ad 100	Ad 100	Ad 100
	Neo Heliopan® Hy- dro	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico	2,00	2,00	2,00
	Neo Heliopan® AP	Tetrasulfonato de Dibenzi- midazol de Fenila de Dissódio	2,00	0,00	1,00
	Phenonip	Fenoxietanol (e) Metilpara- bena (e) Butiparabeno (e) Etiparabe- no (e) Propilparabeno	0,70	0,70	0,70
	Arginina	Arginina	2,20	1,15	1,65
	Lara Care A-200	Galactoarabinan	0,25	0,25	0,25
Hydrolite 5	Pentileno Glicol	3,00	3,00	3,00	
C	Fragrância	Fragrância (parfum)	0,30	0,30	0,30
	pH		6,0	6,1	6,1

#### Procedimento de fabricação

Parte A: Aquecer todos os componentes exceto para a Goma Xantana e TiO<sub>2</sub> a 85°C. Adicionar Goma Xantana e TiO<sub>2</sub> e homogeneizar.

Parte B: Aquecer todos os componentes a 85°C e adicionar a parte A com agitação, agitar em temperatura ambiente.

Parte C: Adicionar Parte C a Partes A & B e homogeneizar.

**Exemplos de formulação 13** *Sunspray O/A. exp SPF 20*

Parte	Ingredientes	INCI	A % em p.
A	Dracorin GOC	Citrato de Oleate de Glicerila, Triglicérido Caprílico/Cáprico,	2,00
	Neo Heliopan HMS	Homossalato	7,00
	Neo Heliopan 357	Butil Metoxidibenzoilmetano	4,00
	Neo Heliopan OS	Salicilato de Etil-hexila	5,00
	Isoadipat		6,00
	Corapan TQ	2.6 Naftalato de Dietil-hexila	3,00
	Edeta BD	EDTA Dissódico	0,10
	Vitamina E Acetat	Acetato de Tocoferila	0,50
	Baysilone Oil M 10	Dimeticona	1,00
	Alfa-Bisabolol	Bisabolol	0,10
	Pemulen TR 2	Acrilatos/C10-30 Acrilatos Copolímero	0,25
	Perfume		0,25
B	Wasser Desion.	Água (Água)	Ad 100
	Glicerina 99%	Glicerina	4,00
	Butilenglicol	Butileno Glicol	5,00
	Dragocid Líquido	Fenoxietanol, Metilparabeno, Etilparabeno, Butilparabeno, Propilparabeno, Isobutilparabeno,	0,80
	Neo Heliopan Hydro, usado como 25% de solução aquosa neutralizada com Arginina	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico	8,00
C	Arginina	Arginina	0,47
	valor de pH		6,0

Parte A: Dissolver o Neo Heliopan 357 nos outros componentes da fase A (exceto Pemulen e EDTA) aquecendo-se até 50°C. Adicionar Goma Xantana e TiO<sub>2</sub> e homogeneizar.

5 Parte B: Adicionar a parte A sem agitação, em seguida começo emulsificação.

Parte C: Adicionar Parte C a Partes A & B enquanto homogenizar.

**Exemplo de formulação que 14** Shampoo para cabelo claro com proteção UV

	Ingredientes	INCI-nome	%
A	Água desmineralizada	Água (Água)	Ad 100
	Merquat 550	Poliquatério-7	0,50
B	Neo Heliopan® Hydro	Ácido Fenilbenzimidazol Sulfônico	2,00
	L-arginina	Arginina	1,45
C	Genapol LRO Líquido	Sulfato de Laureth de sódio	30,00
	Tego Betain F 50	Cocoamidopropil Betaína	5,00
	Antil 141	Propileno Glicol, Dioleato de PEG-55 Propileno Glicol	0,80
	Dragocide Líquido 660079	Fenoxietanol, Metilparabeno, Etilparabeno, Butilparabeno, Propilparabeno, Isobutilparabeno,	0,80
	D-Pantenol 75 L	Pantenol	1,00
	Extrapone® Lime (616268)	Propileno Glicol, Água (Água), Suco de Aurantifolia Cítrico (Lima)	1,00
	Cloreto de sódio	Cloreto de sódio	0,70
	Perfume	Fragrância	0,40

Procedimento de fabricação

10 Parte A: Dissolver Merquat em água com agitação

Parte B: Adicionar Neo Heliopan Hydro e neutralizar com Arginina, dissolver até que uma solução clara formou-se.

15 Parte C: Adicionar os ingredientes a parte AB como listado e agitar até que uma solução uniforme formou-se. A viscosidade pode ser ajustada pela quantidade de cloreto de sódio.

valor de pH - da formulação 6.0

### Outros Exemplos de Formulação:

#### 1. Emulsões de O/A:, SPF > 20

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11
		<b>Emulsificador</b>										
Emulsifos (Symrise)	Fosfato de Cetila de Potássio, Glicerídeos de Palma Hidrogenados				2,0							
Dracorin CE	Citrato de Estearato de Glicerila	1,0	1,0									
Dracorin GOC (Symrise)	Citrato de Oleila de Glicerila					4,0						
	2-Dipoliidroxistearato de Poliglicerila	0,25	0,25									
	Álcool Cetearílico, PEG-40 Óleo de ricino, Sulfato de Cetearila de sódio,							3,75				
	Dipoliidroxistearato de PEG-30							1,0				
	Diesterato de Poligliceril-3 Metilglicose								2,0			
	Estearato de Sorbitano				0,5				1,0			
	Estearato de Glicerila SE							1,5				
	Estearato de Glicerila			2,5	1,0		4,0				4,0	
	Ácido Isosteárico						1,0					
	Ácido Esteárico				1,0					4,0		0,5
	Estearato de PEG 40			1,0						1,0		
	Estearato de PEG 100										2,0	0,5
	Fosfato de Cetila de Potássio						2,0				0,5	2,0
Lanette E® (Cognis)	Sulfato de Cetearila de sódio									0,5		
Emulgin B2® (Cognis)	Ceteareth-20							0,7			1,0	
Filtros de UV Solúveis em Óleo												
Neo Heliopan® AV (Symrise)	Metóxi-cinamato de Etil-hexila	8,0	8,0				4,0			5,0		
Neo Heliopan® 303 (Symrise)	Octocrileno				5,0	5,0			5,0		2,4	10,0
Neo Heliopan® 357 (Symrise)	butil Metoxidibenzoilmetano	4,5	4,5		2,5	0,5	3,0	0,5	2,0	2,0	3,0	3,0
Neo Heliopan® E 1000 (Symrise)	P-Metóxi-cinamato de Isoamila				5,0		4,0					

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11
		Neo Heliopan® HMS (Symrise)	Homossalato				5,0	5,0				3,0
Neo Heliopan® OS (Symrise)	Salicilato de Etil-hexila				2,0	5,0				5,0	5,0	3,0
Neo Heliopan® MBC (Symrise)	4-Metilbenzilideno- cânfora				1,0							
Neo Heliopan® MA (Symrise)	Antranilato de Mentila					1,0						
Neo Heliopan® BB (Symrise)	Benzofenona-3				0,5		1,0	0,5	0,5	4,0	5,0	
Mexoril®XL	Drometrisol Trissiloxa- no				1,0							3,0
Tinosorb®S	Bis-Etil-hexilaoxifenol Metoxifenil Triazina	0,5	0,5		0,5							
Uvinul ®T-150	Etil-hexil Triazona	1,0	1,0	1,0	0,5							0,5
	-Bis[5-1(dimetilpropil) benzoxazol-2-il-1.5 5 3 (4-fenil)imino]-6- (2-etil- hexil)imino-1,3,5- tria- zina						1,0					
Uvinul ®A Plus	Dietilamino Hidroxi- benzoil Hexil Benzoato	1,0	1,0	2,0	0,5	2,0						
Derivado de Indani- lideno de acordo com DE 10055940					0,5	0,5						
Derivado de Ben- zoilcinnaminitrila de acordo com WO 2006/015954				2,0	0,5	0,5						
Parsol SLX	Polisiloxano-15				2,0							
Uvasorb HEB	Dietil-hexil Butamido Triazona				0,5		2,0					
Butirolactonas de Benzilideno de acordo com EP 1008593					1,0	2,0						
Compostos de Benzilideno- dicarbonila descri- tos em WO/2005/107692					0,5							
Filtros de UV Solú- veis em Água												
Neo Heliopan® AP (Symrise), neutrali- zado com lisina ou arginina ou ornitina ou histidina	Dulfonato de Dissódio Fenil- dibenzimidazol- tetra			1,0	0,2	1,5			0,5			



MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11
			Coco-glicerídeos hidrogenados	1,0	1,0				1,0	0,5		
	Dicaprilato/Dicaprato de Butileno Glicol	1,0	1,0	4,0			1,0	7,5				
	Adipato de Dibutila				2,0							
	Trimetoxicaprililsilano						1,0					
Lanette O® (Cognis)	Álcool Cetearílico				1,5							
Lanette 16® (Cognis)	Álcool cetílico					1,0		1,0		0,5	1,0	
Lanette 18® (Cognis)	Álcool Estearílico	1,0	1,0	2,0			1,0		4,5			
alfa-Bisabolol (Symrise)	Bisabolol				0,2	0,1						
Coferol 1250® (Cognis)	Acetato de Tocoferila	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5		0,5		0,5
D-Pantenol (BASF)	Pantenol			0,5				0,5		0,5		
	Palmitato de Retinila						0,5					
Frescolat® ML	Lactato de Mentila				0,5				0,5			
Fragrância	Fragrância/Perfume	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs		
	Cretinina	0,05	0,05									
EDTA BD® (BASF)	EDTA Dissódico	0,2	0,2	0,15	0,15	0,15	0,2	0,15	0,15	0,15	0,2	0,2
Modificadores de viscosidade/ajudas de estabilidade												
Bentone Gel® M IO V (Elementis Specialties)	Óleo mineral e Quaternio-Distearidimônio Hectorito e Carbonato de Propileno								0,5			
Carbopol Ulrez 10 (Noveon)	Carbômero					0,10				0,2		
Carbopol ETD 2001 (Noveon)	Carbômero				0,5		0,1					
Keltrol T® (Calgon)	Goma Xantana	0,2	0,2	0,3	0,3	0,4	0,2	0,2			0,2	0,2
Pemulen TR 2 (Novion)	Acrilatos/ Polímero cruzado de Acrilato de C10-30 alquila						0,2		0,1			0,1
Veegum Ultra® (Vanderbilt)	Sulfato de Alumínio de magnésio	1,0	1,0			0,2	1,0					
Aerosil 200	Silica									0,5	0,2	
Polímeros de Formação de Película												
Antaron V-216/516	VP/Copolímero de Hexadeceno	0,5	0,5			2,0	0,5			1,0	1,0	2,0
Antaron V-220	VP/Eicosene Copolímero								2,0			
Dermacril 79	Acrilatos/ Copolímero de Octilacrilamida				2,0		0,5				1,0	

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI											
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11
Antaron WP-660	Tricantonil PVP		1,0					2,0				
Avalure UR 450/525	Copolímero de PPG-17/IPDI/DMPA			1,0			1,0					
Outros componentes solúveis em água												
Água	Água (Água)	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs
Base de neutralização para componentes ácidos tais como carbômeros, e/ou ácido esteárico etc		qs	qs	qs	qs	qs	qs		qs	qs	qs	qs
Agentes de preservação		qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs
1,3-Butileno glicol	1,3-Butileno Glicol					1,0						
Etanol (96%)	Álcool etílico	3,0	3,0				3,0	3,0	2,0			
Glicerina 99%	Glicerina	5,0	5,0	4,5		0	5,0	3,0	5,0	3,0	3,0	4,0
Hydrolite-5 (Symrise)	Pentileno Glicol	5,0	5,0	3,0	3,0	2,0	5,0	4,0	3,0			
Symdiol 68	1,2-hexilenediol e 1,2-Caprilidilol				0,5							
1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol					1,0				5,0		5,0
Extrato de soja	Extrato de germe de soja de glicina (soja)				0,5					1,0	2,0	0,5
	Fosfato de Ascorbilita de sódio				0,2							
DHA	Di-ídroxiacetona					3,0			5,0			
Corante solúvel em água		qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs
Extrato(s) de planta		qs	qs	5,00	qs	qs	qs	qs	qs	5,0	qs	qs

## 2. Emulsões de A/O:, SPF > 20

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI											
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	
Emulsificador												
	2-Dipoliidroxiestearato de Poliglicerila	4,0	5,0								3,0	2,5
	PEG-45/Dodecil Glicol Copolímero					1,0						
	3-Poliricinoleato de Poliglicerila										3,0	3,5
	PEG/PPG-10/1-cetil Dimeticona					1,5						
	Lauril PEG/PPG-18/18 Meticona						3,0					

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRI- CANTE)	INCI										
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
	Álcool Cetearílico, PEG-40 Óleo de rici- no, Sulfato de Ceteari- la De sódio,							3,75			
	Dipoliidroxiestearato de PEG-30			3,5	3,5		3,5	1,0			
	Diestearato de Poligli- ceril-3 Metilglicose					2,0			2,0		
	Estearato de Sorbitano								1,0		
Filtros de UV Solúveis em Óleo											
Neo Helio- pan® AV (Symrise)	Metóxi-cinamato de Etil-hexila	8,0	2,0		2,0	3,0					5,0
Neo Helio- pan® 303 (Symrise)	Octocrileno	5,0	2,0	3,0	3,0	3,0	8,0		5,0	10,0	3,0
Neo Helio- pan® 357 (Symrise)	Butil Metoxidibenzoil- metano	4,5	1,0		2,0	2,0	3,0	0,5	2,0	3,0	3,0
Neo Helio- pan® E 1000 (Symri- se)	P-Metóxi-cinamato de Isoamila		1,0		1,0	3,0					5,0
Neo Helio- pan® HMS (Symri- se)	Homossalato		1,0		1,0	3,0	2,0			3,0	3,0
Neo Helio- pan® OS (Symrise)	Salicilato de Etil-hexila		1,0		1,0	3,0	3,0			5,0	5,0
Neo Helio- pan® MBC (Symri- se)	4-Metilbenzilideno- cânfora		0,5		0,5						1,0
Neo Helio- pan® MA (Symrise)	Antranilato de Mentila		1,0		0,5						
Neo Helio- pan® BB (Symrise)	Benzofenona-3		1,0		1,0			0,5	0,5		
Mexoril (XL	Drometrizol Trissiloxa- no		2,0		3,0		3,0				
Tinosorb ®S	Bis-Etil-hexilaoxifenol Metoxifenil Triazina	1,0	0,5	2,5	0,5	3,0				1,5	1,5
Uvinul ®T-150	Etil-hexil Triazona		0,5	2,0	0,5	3,0	1,0			1,0	1,0

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRI- CANTE)	INCI	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
			- Bis[5-1(dimetilpropil) benzoxazol-2-il-1.5 5 3 (4-fenil)imino]-6- (2- etil-hexil)imino- 1,3,5 - triazina	0,5	0,5		0,5				
Uvinul ® A Plus	Hexilbenzoato de Dietilamino Hidroxi-benzoíla	1,0	0,5	2,0	0,5	0,5				1,0	1,0
Derivado de Indanilideno de acordo com DE 10055940			0,5		0,5						
Derivados de Benzoilcinnamílnitrila de acordo com WO 2006/015954			0,5		0,5						
Parsol SLX	Polisiloxano-15		1,0		1,0						3,0
Uvasorb HEB	Dietil-hexil Butamido Triazona	0,5	0,5		0,5						
Butirolactones de Benzilideno de acordo com EP 1008593			0,5		0,5						
Compostos de Benzilideno-dicarbonila descritos em WO/2005/107 692			0,5		0,5						
Filtros de UV Solúveis em Água											
Neo Helio-pan® AP (Symrise), neutralizado com lisina ou arginina ou ornitina ou histidina	Dissódio Fenil-diben-zimidazol-tetra-sulfonato	1,2	0,5	1,0	0,5	0,5			0,5		0,8

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRI- CANTE)	INCI	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
		Neo Helio- pan® Hydro (Symri- se) neutralizado com lisina ou argi- nina ou orniti- na ou histidina	Fenilbenzimidazol- Ácido sulfônico	1,3	1,3	2,6	1,3	1,8	1,8	2,6	2,6
Mexoril SX	Tereftalilideno Dican- for Ácido Sulfônico		0,5		0,5		1,0				
Sulisobenzona	Benzofenona -4							1,0			
Aminoácido ou base de amina ou base dura para neutralizar Mexoril SX e/ou sulisobenzona			qs		qs		qs	qs			
Pigmentos atenuantes de UV Microfinos											
	Dióxido de titânio	3,0	3,0	3,0	3,0	3,0		6,0	1,0	3,0	3,0
	Óxido de zinco							6,0			
Tinosorb M	Metileno Bis- Benzo- triazolil Tetrametilbutil- fenol		1,0		1,0						3,0
Outros componentes solúveis em óleo											
PCL Líquido 100	Octanoato de Ceteari- la										
Corapan TQ® (Symrise)	1,6-Naftalato de Dietil- hexila							3,0			
Dragoxat 89 (Symrise)	Isononoato de Etil- hexila				1,0						
Isoadipato	Adipato de Di- isopropila			3,0	5,0	5,0					
Miristato de Isopropi- la(Symrise)	Miristato de Isopropila	3,0						2,0		4,0	
Óleo neutro (Symrise)	Triglicerídeo Caprili- co/Cáprico		5,0		3,0			5,0		4,0	4,0

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRI- CANTE)	INCI	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
		Isodragol (Symrise)	Triisononanoína								6,0
	Isoexadecano						6,0				
	Carbonato de Dicapri- lila			5,0			8,0				
Cetiol OE (Cognis)	Éter Dicaprílico		5,0		5,0			1,0	3,0		
Óleo de para- fina	Óleo mineral										
Tegosoft TN® (Goldschmidt)	Benzoato de C12-15 alquila	10,0	10,0	10,0	4,0	9,0			1,0	5,0	5,0
Abil 100® (Goldschmidt)	Dimeticona		1,0		1,0				2,0		
Dow Corning® 193 Fluido (Dow corning)	PEG-12 Dimeticona						1,0				
	cetil Dimeticona				2,0					2,0	2,0
	Ciclometicona					15					
	Ciclo-hexasiloxano						5,0				
	Ciclopentassiloxano						5,0				
	Simeticona									2,0	2,0
	Coco-glicerídeos hi- drogenados				1,0			0,5			
	Butileno Glicol Dicaprilato/Dicaprato	7,5	3,0		3,0	8,0		7,5			
	Trimetoxicaprililsilano					0,2					
Lanette 16® (Cognis)	Álcool cetílico							1,0		0,5	0,5
Lanette 18® (Cognis)	Álcool Estearílico								3,0		
alfa-Bisabolol (Symrise)	Bisabolol		0,2		0,2	0,2				0,1	0,1
Coferol 1250® (Cognis)	Acetato de Tocoferila	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5		0,5	0,5
D-Pantenol (BASF)	Pantenol	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5		0,5	0,5
	Palmitato de Retinila			0,5			0,5				
Fragrância	Fragrância/Perfume	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs
	Cretinina	0,05	0,05	0,05							
	Taurino			1,0							
EDTA BD® (BASF)	EDTA Dissódico	0,2	0,2	0,15	0,15	0,15	0,2	0,15	0,15	0,15	0,15

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRI- CANTE)	INCI	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
		modificadores de viscosida- de /ajudas de estabilidade									
Bentone Gel® MIOV (Elementis Specialties)	Óleo mineral e Hecto- rito de Disteardimônio e Carbonato de Propi- leno								0,5		
	Cera Microscritalina									2,0	2,0
	Cera de abelha				0,3						
	Tricontanil PVP									2,0	2,0
Keltrol T® (Calgon)	Goma Xantana							0,2			
Pemulen TR 2 (Novion)	Acrilatos/ Polímero cruzado de Acrilato de C10-30 alquila				0,3				0,1		
	Octenilsucinato de Amido de sódio	0,5	0,5	0,4							
Aerosil 200	Sílica										
	Sulfato de magnésio	0,3	0,3	0,3							
	Cloreto de sódio					0,5	0,5				
Outros componentes solúveis em água											
Água	Água (Água)	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs
Base de Neutralização para componentes ácidos tais como carbômeros, e/ou ácido esteári- co etc		qs	qs	qs	qs		qs		qs	qs	qs
Agentes de preservação		qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs
1,3-Butileno glicol	1,3-Butileno Glicol	5,0	5,0	3,0	3,0						
Etanol (96%)	Álcool etílico	2,0	2,0	2,0	3,0	3,0	10,0	3,0	2,0	4,0	4,0
Glicerina 99%	Glicerina	5,0	5,0	2,0	2,0	4,0	5,0	3,0	5,0	3,0	3,0
Hydrolite-5 (Symrise)	Pentileno Glicol	1,0	1,0	3,0	3,0	2,0	2,0	4,0	3,0		
Symdiol 68	1,2-hexilenediol e 1,2- Caprilidol			0,5	0,5	0,5					

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRI- CANTE)	INCI										
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol						3,0			5,0	5,0
Extrato de soja	Extrato de germe de soja de glicina (soja)			0,5	0,5						
	Fosfato de Ascorbila de sódio			0,5	0,2	0,2					
Corante solúvel em água		qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs
Extrato(s) de planta		qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	qs	5,0	5,0

### 3. Spray/Emulsões de Musse:, SPF > 20

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI										
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
<b>Emulsificador</b>											
	2-Dipoliidroxiestearato de Poliglicerila	3,0									
	Dissódio PEG-5 Citrato de Lauril Sulfossuccinato	2,5									
	Capril/Capramidopropil Betaina	0,7									
	Sulfato de Laureth de sódio	0,3									
Emulgin B2® (Cognis)	Ceteareth-20		1,5	1,5						2,0	
	Poliéster-5				2,5						
	Laurato de Sorbitano					2,5					
	10 Laurato de Poliglicerila					2,0					
	PPG-15 Éter Estearílico						4,0				
	Poliacrilato-3				1,0						
	Fosfato de Estearila							2,5			
	Estearato de Sorbitano									0,5	
	Ácido Esteárico						1,0			1,0	
	Estearato de PEG 40									1,0	
Filtros de UV Solúveis em Óleo											
Neo Helio-pan® AV (Symrise)	Cinamato de Metóxi-Etil-hexila		6,0						5,0		6,0

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI										
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
Neo Helio- pan® 303 (Symrise)	Octocrileno	5,0		8,0	10,0	10,0	5,0	4,0		4,0	
Neo Helio- pan® 357 (Symrise)	Butil Metoxidibenzoil- metano	3,0	4,0	4,0	2,0	2,5	3,0	5,0		2,0	3,0
Neo Helio- pan® E 1000 (Symrise)	Cinamato de P- Metóxi- de Isoamila								5,0		
Neo Helio- pan® HMS (Symrise)	Homossalato			3,0	3,0	5,0	5,0			3,0	
Neo Helio- pan® OS (Symrise)	Salicilato de Etil-hexila			3,0	5,0	5,0	5,0	4,0		3,0	
Neo Helio- pan® MBC (Symrise)	4-Metilbenzilideno- cânfora									0,5	
Neo Helio- pan® MA (Symrise)	Antranilato de Mentila			2,0							
Neo Helio- pan® BB (Symrise)	Benzofenona-3							0,5			
Mexoril®XL	Drometrizol Trissiloxa- no				4,0	3,0				2,0	
Tinosorb®S	Bis-Etil-hexilaoxifenol Metoxifenil Triazina		2,5	2,5	1,0	0,5			2,5	1,0	1,5
Uvinul®T-150	Etil-hexil Triazona	1,0	3,0	1,0	1,0	0,5	2,0		1,0	1,0	
	-Bis[5-1(dimetilpropil) benzoxazol-2-il- 1.553(4-fenil)imino]-6- (2-etil-hexil)imino- 1,3,5-triazina de ben- zoato		1,0	1,0						1,0	
Uvinul®A Plus	Benzoato de Dietila- mino Hidroxibenzoil Hexila		1,0	1,0		0,5	1,0	0,5		1,0	
Derivado de Indanilideno de acordo com DE 10055940										0,5	
Derivado de Benzoilcinn- amitrila de acordo com WO 2006/015954										1,0	
Parsol SLX	Polisiloxano-15	3,0		2,0		2,0				1,0	
Uvasorb HEB	Dietil-hexil Butamido Triazona			1,0		0,5		1,0		0,5	1,0

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI											
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	
Butirolactones de Benzilideno de acordo com EP 1008593											1,0	
Compostos de Benzilideno-dicarbonila descrito em WO/2005/107 692											1,0	
Filtros de UV Solúveis em Água												
Neo Helio-pan® AP (Symrise), neutralizado com lisina ou arginina ou ornitina ou histidina	Fenil- dibenzimidazol-tetra- sulfonato dissódico	0,8	1,8	1,8							1,0	
Neo Helio-pan® Hydro (Symrise) neutralizado com lisina ou arginina ou ornitina ou histidina	Fenilbenzimidazol-Ácido sulfônico	2,6	3,2	3,2	2,6	2,6	2,6	1,8	1,3	1,3	2,6	
Mexoril SX	Tereftalilideno Dicancor Ácido Sulfônico				1,0	0,5					0,5	
Sulisobenzona	Benzofenona -4						1,0					
Aminoácido ou base de amina ou base dura para neutralizar Mexoril SX e/ou sulisobenzona					qs	qs	qs				Qs	
Pigmentos atenuantes de UV Microfinos												
	Dióxido de titânio				3,0						1,5	
	Óxido de zinco						3,0				1,5	
Tinosorb®M	Metileno Bis- Benzo-triazolil Tetrametilbutil-fenol		3,0	3,0							1,0	
Outros componentes solúveis em óleo												
PCL Líquido 100	Octanoato de Cetearila							10,0				



MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI										
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
Avicel PC 611 (FMC Corporation)	Celulose Microcristalina e Goma Celulósica					0,80					
Keltrol T® (Calgon)	Goma Xantana						0,3		0,2		
Pemulen TR 2 (Novion)	Acrilatos/Polímero cruzado de Acrilato de C10-30 alquila		0,2	0,2		0,25			0,2	0,2	
Polímeros de Formação de Película											
Antaron V-216/516	VP/Copolímero de Hexadeceno		0,5	0,5			2,0			0,5	
Dermacril 79	Acrilatos/Octilacrilamida Coploymer							1,0			
	copolímero de glicerina de ácido adípico de trimetilpentanediol							1,0			
Avalure UR-450/525	Copolímero de PPG-17/IPDI/DMPA			0,5						0,5	
Outros componentes solúveis em água											
Água	Água (Água)	qs	qs	qs	qs	qs	Qs	Qs	Qs	Qs	Qs
Base de Neutralização para componentes ácidos tais como carbômeros, e/ou ácido esteárico etc		qs	qs	qs	qs	qs	Qs	Qs		Qs	Qs
Agentes de preservação		qs	qs	qs	qs	qs	Qs	Qs	Qs	Qs	Qs
1,3-Butileno glicol	1,3-Butileno Glicol					3,0					
Etanol (96%)	Álcool etílico	5,0	3,0	3,0	4,0	12,0		10,0		5,0	5,0
Glicerina 99%	Glicerina	3,0	5,0	5,0	4,5		5,0		5,0	3,0	3,0
Hydrolite-5 (Symrise)	Pentileno Glicol		5,0	5,0	3,0					3,0	
Symdiol 68	1,2-hexilenediol e 1,2-Caprilidol									0,5	
1,2-Propileno glicol	Propileno Glicol				5,0		1,0	1,0	2,0		
Extrato de soja	Extrato de germe de soja de glicina (soja)				1,0	0,5					
	Fosfato de Ascorbila de sódio					0,2					
DHA	Di--idroxiacetona										
Corante solúvel em água		qs	qs	qs	qs	qs	Qs	Qs	Qs	Qs	Qs

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI										
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10
Extrato(s) de planta		qs	qs	qs	qs	qs	Qs	Qs	Qs	Qs	Qs
Propulsor											Qs

#### 4. Diariamente Formulações de Proteção:

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI									
		1	2	3	4	5	6	7	8	9
<u>Emulsificador</u>										
Emulsifos (Symrise)	Fosfato de Potássio Cetila, Glicerídeos de Palma Hidrogenados,	1,5	1,5	1,5						
Dracorin CE	Citrato de Estearato de Glicerila						2,5			
	PPG-1 Trideceth-6						0,5			
	Oleato de Sorbitano						0,5			
	Estearato de sacarose								0,8	
Hostaceron AMPS	Amônio Poliacrilamido tauramida									2,0
	Poligliceril-3 Metilglicose Diestearato							3,5		
	Estearato de Sorbitano								2,0	
	Estearato de Glicerila									
	Ácido Isosteárico	1,0	1,0	1,0						
	Ácido Esteárico					2,0			1,0	4,0
	Estearato de PEG 40									1,0
	Estearato de PEG 100				0,2	2,0				
	Laurato de PEG-4								0,3	
Lanette (Cognis)	E® Sulfato de Cetearila de sódio									0,5
	Estearete-2				0,2					
	Steareth -21				1,0					
	Laurete-7				0,75					
Filtros de UV Solúveis em Óleo										
Neo Heliopan® AV (Symrise)	Metóxi-cinamato de Etil-hexila	8,0					4,0	3,0	5,5	5,0
Neo Heliopan® 303 (Symrise)	Octocrileno		3,0	3,0	1,0	2,0				
Neo Heliopan® 357 (Symrise)	Butil Metoxidibenzoil-metano	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0	2,0	1,5	2,0	1,0
Neo Heliopan® HMS (Symrise)	Homossalato		3,0	3,0		5,0				
Neo Heliopan® OS (Symrise)	Salicilato de Etil-hexila		3,0	3,0	4,0	5,0			3,0	

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI									
		1	2	3	4	5	6	7	8	9
Filtros de UV Solúveis em Água										
Neo Heliopan® AP (Symrise), neutralizado com lisina ou arginina ou ornitina ou histidina	Dissódio Fenil- dibenzimidazoltetra- sulfonato		0,8	0,8				0,8		
Neo Heliopan® Hydro (Symrise) neutralizado com lisina ou arginina ou ornitina ou histidina	Fenilbenzimidazol Ácido sulfônico	2,8	2,8	2,8	1,8	2,64	1,8	1,3	2,9	1,3
Mexoril SX	Tereftalideno Dicanfor Ácido Sulfônico									0,5
Sulisobenzona	Benzofenona -4					0,5				
Aminoácido ou base de amina ou base dura para neutralizar Mexoril e/ou SX Sulisobenzona						qs				qs
Pigmentos atenuantes de UV Microfinos										
	Dióxido de titânio				1,0	1,0				
Outros componentes solúveis em óleo										
Manteiga de shea	Butiropemum Parkii									2,0
Corapan TQ® (Symrise)	1,6-Naftalato de Dietilhexila									
Dragoxat 89 (Symrise)	Isononoato de Etilhexila	3,0	3,0	3,0		3,0				
Isoadipato	Adipato de Diisopropila					3,0				
Miristato de Isopropila (Symrise)	Miristato de Isopropila				5,0	5,0				
	Tridecil Trimelitato						2,0			
	Miristato de Miristila							5,0		
Óleo neutro (Symrise)	Triglicerídeo Caprílico/Cáprico						3,0		4,0	
Cetiol OE (Cognis)	Éter Dicaprílico						2,0			
	Carbonato de Dicaprila	2,0	2,0	2,0				3,0		
	Isoexadecano								8,0	
	Etil-hexilglicerina						0,5			

MATÉRIA-PRIMA NOME (FABRICANTE)	INCI									
		1	2	3	4	5	6	7	8	9
Óleo de parafina	Óleo mineral				2,0		0,5			
Tegosoft TN® (Goldschmidt)	Benzoato de C12-15 alquila							3,0		
Abil 100® (Goldschmidt)	Dimeticona				1,0			2,0		1,0
Dow Corning® 193 Fluido (Dow corning)	PEG-12 Dimeticona				1,0	1,0				
	Coco-glicerídeos hidrogenados						1,0	0,5		
	Dicaprilato/Dicaprato de Butileno Glicol							7,5		
	Adipato de Dibutila				2,0					
Lanette O® (Cognis)	Álcool Cetearílico				1,5					
Lanette 16® (Cognis)	Álcool cetílico	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	2,0	0,2	
Lanette 18 ® (Cognis)	Álcool Estearílico				0,5	0,5			4,5	
	Álcool Miristílico								1,0	
	Ceramida(s)								0,5	
alfa-Bisabolol (Symrise)	Bisabolol				0,2	0,1	0,2	0,1		
Coferol 1250® (Cognis)	Acetato de Tocoferila	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
D-Pantenol (BASF)	Pantenol	1,0	1,0	1,0	0,5	0,5	0,5		0,5	0,5
	Palmitato de Retinila	0,5	0,5	0,5					0,5	
	Ubiquinona	0,1								
Frescolat® ML	Lactato de Mentila	0,5								
Fragrância	Fragrância/Perfume	Qs	Qs	Qs	Qs	Qs	Qs	Qs	Qs	Qs
	Niacinamida		0,1		0,5	0,5				
	Arbutina		0,2							
4-(1- Pheniletil)1,3- benzenediol		0,2				0,5				
	Ácido Cójico			0,5						
Extrato de Alca- çus							0,5			
	Glicosil rutina + Quer- citrina	0,1	0,1				0,2			
	Isoquercitrina						0,1			
	Cretinina	0,05								
EDTA (BASF)	BD® EDTA Dissódico	0,2	0,2	0,2	0,15	0,15	0,2	0,15	0,15	0,15





## REIVINDICAÇÕES

1. Preparação tendo um valor de pH na faixa dentre 5,5 a 7,0, compreendendo,

(i) 1 - 8% em peso, com base no peso total da formulação, de  
5 ácido 2-fenilbenzimidazol-5-sulfônico (ácido fenilbenzimidazol sulfônico), e

(ii) um total de pelo menos 50% em peso de um ou mais amino-ácidos básicos, com base na quantidade de ácido fenilbenzimidazol sulfônico (i).

2. Preparação de acordo com a reivindicação 1, tendo um valor de pH na faixa dentre 6,0 a 7,0, preferivelmente de 6,0 a 6,8 e preferivelmente dentre 6,0 a abaixo de 6,8.

3. Preparação de acordo com a reivindicação 1 ou 2, em que o um ou mais aminoácido(s) básico(s) é/são selecionado(s) a partir do grupo que consiste em arginina, lisina, histidina e ornitina.

4. Preparação de acordo com quaisquer uma das reivindicações 1, 2 ou 3, a preparação sendo uma preparação cosmética ou dermatológica.

5. Preparação de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, compreendendo lisina e/ou ornitina e tendo um valor de pH de pelo menos 6,2.

6. Preparação de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, compreendendo um ou mais outros absorventes de UV, e em que preferivelmente a quantidade total de absorventes de UV está na faixa de 0,1% a 40% em peso, com base no peso total da preparação.

7. Preparação de acordo com a reivindicação 6, compreendendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico em uma quantidade suficiente para realce sinérgico da absorção de UV de um ou mais outros absorventes de UV.

8. Preparação de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, em que a quantidade total de todos filtros de UV solúveis em água sulfonados na faixa de 0,1 a 15,0% em peso, com base no peso total da preparação.

9. Preparação de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, tendo um fator de proteção solar de pelo menos 2.

10. Preparação de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, tendo um valor de pH de 6,2 a 6,8 e compreendendo

5                   - ácido fenilbenzimidazol sulfônico: 1 a 8% em peso, com base no peso total da preparação,

                  - um total de 60 - 150% em peso de um ou mais aminoácidos básicos, com base na quantidade de ácido fenilbenzimidazol sulfônico, e

10               a) uma fase de óleo de 5 a 75% em peso, com base no peso total da preparação, e/ou

                  b) uma fase aquosa de 5 a 75% em peso, com base no peso total da preparação.

15               11. Uso de um ou mais aminoácidos básicos para prevenção ou atraso da cristalização de ácido fenilbenzimidazol sulfônico em um valor de pH de 5,5 a 7,0, preferivelmente de 6,0 a 7,0 e preferivelmente de 6,0 a 6,8.

20               12. Uso de uma mistura tendo um pH de 5,5 a 7,0, preferivelmente de 6,0 a 7,0 e preferivelmente de 6,0 a 6,8, compreendendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico e um ou mais ácido sulfônico de fenilbenzimidazol de estabilização de aminoácidos básicos, para sinergisticamente realçar a absorção de UV de um ou mais outros absorventes de UV.



Fig. 1

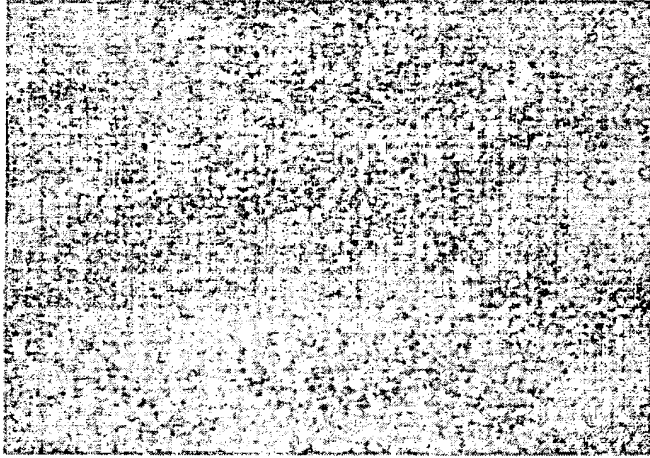


Fig. 2

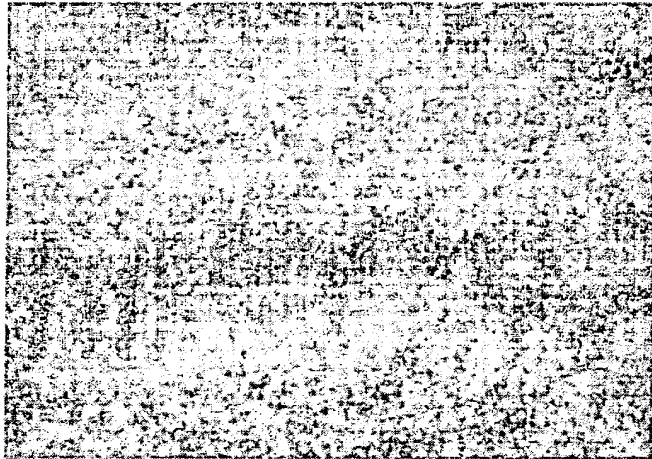


Fig. 3

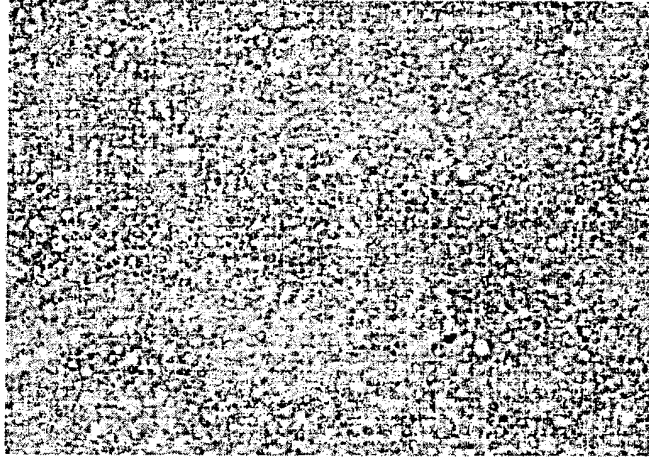


Fig. 4

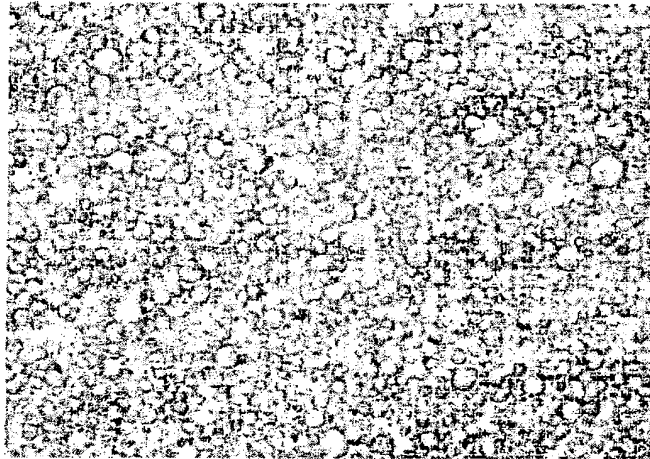


Fig. 5

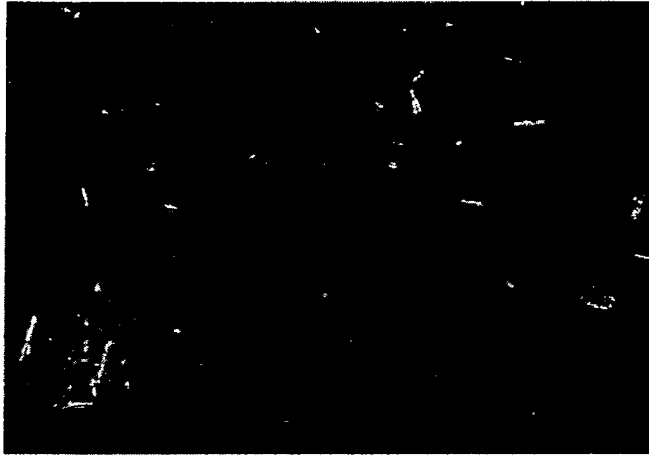


Fig. 6



Fig. 7

## RESUMO

Patente de Invenção: **"SAIS SOLÚVEIS ESTÁVEIS DE ÁCIDO FENILBENZIMIDAZOL SULFÔNICO EM pHs EM OU ABAIXO DE 7,0"**.

5 A presente invenção refere-se a preparações, particularmente preparações cosméticas ou farmacêuticas/dermatológicas, contendo ácido fenilbenzimidazol sulfônico (isto é, ácido 2-fenilbenzimidazol-5-sulfônico) neutralizado com aminoácidos básicos tais como arginina, lisina, ornitina e histidina de forma que o pH da preparação possa estar em ou abaixo de 7,0 sem incorrer a cristalização do ácido fenilbenzimidazol sulfônico.