

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

(21) **PI0905045-0 A2**

(22) Data de Depósito: 17/12/2009
(43) Data da Publicação: 03/11/2010
(RPI 2078)



★ B R P I 0 9 0 5 0 4 5 A 2 ★

(51) Int.Cl.:

A61K 8/35

A61K 8/60

A61Q 19/04

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

(30) Prioridade Unionista: 19/12/2008 US 12/339,525

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

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

(57) Resumo: COMPOSIÇÕES QUE COMPREENDEM AGENTES DE AUTOBRONZEAMENTO E AMINOAÇÚCARES. A presente invenção refere-se a uma composição para escurecimento da pele. A composição inclui um agente de autobronzeamento e um aminoaçúcar. Em um outro aspecto, um método de escurecimento da pele inclui aplicar topicamente a composição acima à pele.



PI0905045-0

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**COMPOSIÇÕES QUE COMPREENDEM AGENTES DE AUTOBRONZEAMENTO E AMINOAÇÚCARES**".

CAMPO DA INVENÇÃO

5 A presente refere-se a uma composição para o escurecimento da pele. A composição inclui um agente de autobronzeamento e um aminoaçuçar.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

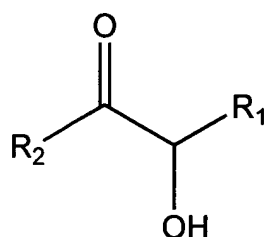
10 Muitos indivíduos desejam o escurecimento da cor da pele. A maioria das pessoas obtêm uma pele mais escura através da exposição à luz UV (por exemplo, bronzamento solar ou lâmpadas UV). A exposição UV, entretanto, resulta em um acelerado envelhecimento da pele e aumenta a incidência de câncer de pele.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

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

 As requerentes descobriram inesperadamente que aminoaçucares fornecem benefícios de escurecimento da pele quando usados topicamente em conjunto com um agente autobronzeador.

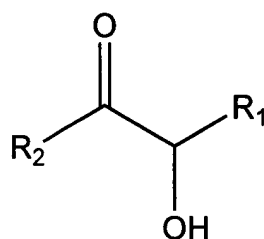
25 SUMÁRIO DA INVENÇÃO

 A invenção fornece uma composição de autobronzeamento ou sem-sol que compreende: (a) um agente de autobronzeamento que tem a seguinte fórmula:



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

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



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

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

15 DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

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

A menos que seja definido de outro modo, todos os termos técnicos e científicos usados aqui têm o mesmo significado conforme compreendido pelo versado na técnica à qual a invenção pertence. Também, todas as publicações, pedidos de patentes, patentes e outras

referências mencionadas na presente invenção estão aqui incorporadas a título de referência. Exceto onde indicado em contrário, uma porcentagem refere-se a uma porcentagem em peso (isto é, %(p/p)).

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

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

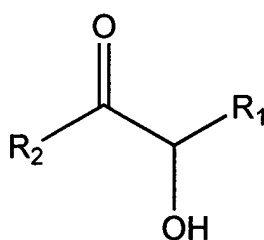
Para uso na presente invenção, "aplicar topicamente" significa pôr diretamente ou espalhar sobre a pele externa, couro cabeludo, ou cabelo, por exemplo, pelo uso das mãos ou com um aplicador como um lenço, um aplicador de esfera, ou spray.

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

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

Agente de autobronzeamento

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



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

A quantidade do agente de autobronzamento das composições da invenção varia de cerca de 0,1 a cerca de 10, de preferência de cerca de

1 a cerca de 5, com mais preferência de cerca de 2 a cerca de 5 por cento em peso do peso total da composição.

Amino açúcar

De acordo com a invenção, a composição inclui um aminoaçúcar.

- 5 A expressão "aminoaçúcar" significa um sacarídeo, como um mono ou dissacarídeo que tem pelo menos um grupo amina substituído por um grupo hidroxila. O aminoaçúcar pode ser de origem natural ou sintética e pode ser um composto puro ou misturas de compostos (por exemplo, extratos de fontes naturais ou misturas de materiais sintéticos). De preferência, o aminoaçúcar é
- 10 selecionado dentre glicosamina, N-acetil glicosamina, manosamina, N-acetil manosamina, galactosamina, N-acetil galactosamina, isômeros do mesmo (por exemplo, estereoisômeros), sais do mesmo (por exemplo, sal de HCl), ou misturas do mesmo. Em uma modalidade preferencial, o aminoaçúcar inclui glicosamina. A composição de acordo com a invenção pode compreender de
- 15 0,01% a 15%, de preferência de 0,1 % a 10%, e com mais preferência de 0,1% a 1% em peso de pelo menos um aminoaçúcar.

Outros agentes de escurecimento

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

- 30 Exemplos de derivados de melanina sintética são apresentados nas patentes US nº 5.618.519, 5.384.116 e 5.227.459. Exemplos de derivados de melanina solúvel são apresentados nas

patentes US nº 5.744.125, 5.225.435, 5.218.079 e 5.216.116. Exemplos de derivados de melanina solúvel disponíveis para comercialização incluem Melasyn-100® junto a San-mar laboratories, Inc. (Elmsford, NY, EUA) e MelanZe® junto a Zylepsis (Ashford, Kent, Reino Unido).

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

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

Outros ingredientes de acentuação do bronzamento

 Em outra modalidade, as composições da presente invenção incluem outros compostos que acentuam o bronzamento, isto é, compostos além de aminoaçúcares que são úteis para acentuar o desenvolvimento da
15 cor/bronzamento. Exemplos de tais compostos para acentuar o bronzamento incluem extratos naturais como extratos vegetais (filo Plantae), incluindo aqueles selecionados do grupo que consiste em extrato de sementes de soja pré-germinada, extrato de árvore de noz, e extrato de artemísia.

20 O que se entende por um "extrato de sementes de soja pré-germinada" é uma mistura de compostos isolados a partir de semente da planta de soja, por exemplo, a partir de *Glicina soja*). O extrato de sementes de soja pré-germinada pode ser preparado de maneira suave e pode omitir uma ou mais de certas etapas (por exemplo, extração de solvente não-aquoso, processamento de álcali, e/ou aquecimento a alta temperatura)
25 comumente usadas para produzir hidrolisados de proteína de soja convencionais, que produzem as menos desejáveis distribuições de amino-peptídeos de pesos moleculares mais baixos.

 Em uma outra modalidade, o processo para extração de
30 proteína de soja é o assim chamado processo de "suspensão de células únicas" que inclui a separação das células individuais por meio de um

processo enzimático para degradar a celulose na parede celular externa, mas deixar as paredes celulares internas intactas.

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

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

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

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

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

A expressão "extrato de artemísia" significa um extrato de uma planta do gênero *Artemesia*, como *Artemesia vulgaris* e também chamada de losa, erva felon, semente de crisântemo, losna selvagem, ou planta de São João (não erva de São João). O extrato pode ser de qualquer das várias partes da planta incluindo sementes, folhas, caules, ou de outras partes da planta. O extrato de artemísia pode ser combinado com extratos de outras plantas como, por exemplo, um extrato de alga verde. Um extrato de artemísia particularmente

adequado é uma mistura de extrato de artemísia e extrato de alga verde (família *Ulvaceae*) e comercialmente disponível como "Complexo Triplo A" junto a Barnet Products Corporation de Englewood Cliffs, New Jersey, EUA.

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

Composições tópicas

- 10 As composições da presente invenção são aplicadas topicamente sobre a pele ou cabelo humanos. Em uma modalidade, a composição contém uma quantidade eficaz do agente de autobronzeamento descrito acima para o escurecimento da pele, um aminoaçúcar, e um veículo topicamente aceitável. Em uma modalidade, o veículo tópico cosmeticamente aceitável é de cerca de 50% a cerca de 99,99% em peso da composição (por exemplo, de cerca de 15 80% a cerca de 99% em peso da composição). Em uma modalidade preferencial da invenção, o veículo cosmeticamente aceitável inclui água.

- As composições podem ser usadas para fabricar uma ampla variedade de tipos de produtos que incluem, porém sem caráter limitativo, loções, cremes, géis, bastões, aspersões, pomadas, sabonetes em barra e 20 líquidos, xampus e condicionadores de cabelo, fixadores de cabelos, pastas, espumas, pós, mousses, cremes de barbear, lenços umedecidos, esparadrapos, hidrogéis, produtos formadores de película, máscaras faciais e de pele, películas e maquilagem como bases, e rímel. Esses tipos de produtos podem conter vários tipos de veículos tópicos cosmeticamente 25 aceitáveis, incluindo, mas não se limitando a, soluções, suspensões, emulsões como microemulsões e nanoemulsões, géis, sólidos e lipossomas. Os seguintes são exemplos não-limitadores de tais veículos. Outros veículos podem ser formulados pelos versados na técnica.

- 30 As composições úteis na presente invenção podem ser formuladas como soluções. As soluções incluem tipicamente um solvente aquoso ou orgânico (por exemplo, de cerca de 50% a cerca de 99,99% ou de cerca de 90% a cerca de 99% de um solvente orgânico ou aquoso

cosmeticamente aceitável). Exemplos de solventes orgânicos aceitáveis incluem propileno glicol, polietileno glicol (200-600), polipropileno glicol (425-2025), glicerol, 1,2,4-butanotriol, ésteres de sorbitol, 1,2,6-hexanotriol, etanol e misturas dos mesmos.

5 Composições úteis na presente invenção podem ser formuladas como uma solução que compreende um emoliente. Tais composições contêm, de preferência, de cerca de 2% a cerca de 50% de emoliente(s). Para uso na presente invenção, "emolientes" referem-se a materiais usados para a prevenção ou alívio da secura, como pela prevenção da perda
10 transepidérmica de água da pele. Exemplos de emolientes incluem, porém sem caráter limitativo, aqueles apresentados no *International Cosmetic Ingredient Dictionary and Handbook*, editores Pepe, Wenninger e McEwen, páginas 2930 a 36 (The Cosmetic, Toiletry, and Fragrance Association, Washington, D.C., 9ª Edição, 2002) (deste ponto em diante no presente
15 documento "Manual ICI"). Exemplos de emolientes particularmente aceitáveis incluem óleos vegetais, óleos minerais, ésteres graxos e similares.

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

Um outro tipo de produto que pode ser formulado a partir de uma solução é um creme. Um creme contém tipicamente de cerca de 5% a cerca de 50% (por exemplo, de cerca de 10% a cerca de 20%) de emoliente(s) e de cerca de 45% a cerca de 85% (por exemplo, de cerca de
25 50% a cerca de 75%) de água.

Embora seja preferido que a composição da presente invenção inclua água, a composição pode ser alternativamente anidra, ou uma pomada que não inclui água, porém solventes de silicone e/ou orgânicos, óleos, lipídios e ceras. Uma pomada pode conter uma base simples de óleos animais ou
30 vegetais ou hidrocarbonetos semissólidos. Uma pomada pode conter de cerca de 2% a cerca de 10% de emoliente(s) mais cerca de 0,1% a cerca de 2% de

agente(s) espessante(s). Exemplos de agentes espessantes incluem, porém sem caráter limitativo, aqueles apresentados no Manual ICI páginas 2979 a 84.

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

10 Loções e cremes podem ser formulados como emulsões. Tipicamente, tais loções contêm de 0,5% a cerca de 5% de emulsificante(s). Tais cremes contêm tipicamente de cerca de 1% a cerca de 20% (por exemplo, de cerca de 5% a cerca de 10%) de emoliente(s); de cerca de 20% a cerca de 80% (por exemplo, de 30% a cerca de 70%) de água; e de cerca de 1% a cerca de 10% (por exemplo, de cerca de 2% a 15 cerca de 5%) de emulsificante(s).

Preparações de emulsões simples para o tratamento da pele, como loções e cremes, do tipo óleo em água e água em óleo são bem conhecidas da técnica cosmética e são úteis na presente invenção. As composições de emulsão multifase, como do tipo água em óleo em água ou 20 do tipo óleo em água em óleo, são também úteis na presente invenção. Em geral, tais emulsões simples ou multifase contêm água, emolientes, e emulsificantes como ingredientes essenciais.

As composições desta invenção podem também ser formuladas como um gel (por exemplo, um gel aquoso, em álcool, álcool/água, ou óleo 25 usando-se agente(s) gelificante(s) adequado(s)). Os agentes gelificantes adequados para géis aquosos e/ou alcoólicos incluem, porém sem caráter limitativo, gomas naturais, ácido acrílico, e polímeros e copolímeros de acrilato, e derivados de celulose (por exemplo, hidroximetil celulose e hidroxipropil celulose). Os agentes gelificantes adequados para óleos (como óleo mineral) 30 incluem, porém sem caráter limitativo, copolímero de butileno/etileno/estireno hidrogenado e copolímero de etileno/propileno/estireno hidrogenado. Estes géis contêm tipicamente cerca de 0,1% e 5% em peso de tais agentes gelificantes.

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

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

Agentes adicionais cosmeticamente ativos

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

Em uma modalidade, o agente é selecionado a partir de, porém sem caráter limitativo, o grupo consistindo em hidroxiácidos, peróxido de benzoíla, D-pantenol, octil metoxicinamato, dióxido de titânio, octil salicilato, homosalato, avobenzona, carotenoides, limpadores de radicais livres,
25 armadilhas de spin, aminas (por exemplo, DMAE e neutrol), retinoides como retinol e palmitato de retinila, ceramidas, ácidos graxos poliinsaturados, ácidos graxos essenciais, enzima, inibidores de enzimas, minerais, hormônios como estrogênios, esteroides como hidro cortisona, 2-dimetilaminoetanol, sais de cobre como cloreto de cobre, peptídeos contendo cobre como Cu:Gli-His-Lis,
30 coenzima Q10, peptídeos, aminoácidos como prolina, vitaminas, ácido lactobiônico, acetil-coenzima A, niacina, riboflavina, tiamina, ribose, transportadores de elétron como NADH e FADH₂, e outros extratos botânicos

como aloe vera, matricária, farinha de aveia e derivados e misturas do mesmos. O agente cosmeticamente ativo estará tipicamente presente na composição da invenção em uma quantidade de cerca de 0,001% a cerca de 20% em peso da composição, por exemplo, cerca de 0,005% a cerca de 10%
5 como cerca de 0,01% a cerca de 5%.

Exemplos de vitaminas incluem, porém sem caráter limitativo, vitamina A, vitamina B, como vitamina B3, vitamina B5, e vitamina B12, vitamina C, vitamina K, e diferentes formas de vitamina E como alfa, beta, gama ou delta tocoferóis ou suas misturas, e derivados das mesmas.

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

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

As composições da presente invenção podem ser preparadas com o uso de água mineral, por exemplo, uma água mineral que tenha sido mineralizada naturalmente como a Evian® Mineral Water (Evian,
30 França). Em uma modalidade, a água mineral tem uma mineralização de pelo menos cerca de 200 mg/L (por exemplo, de cerca de 300 mg/L a

cerca de 1000 mg/L). Em uma modalidade, a água mineral contém pelo menos cerca de 10 mg/L de cálcio e/ou pelo menos 5 mg/L de magnésio.

Outros materiais

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

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

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

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

Os seguintes exemplos não-limitadores ilustram adicionalmente a invenção.

Exemplo A: A glicosamina fornece um bronzeamento da pele superior (escurecimento)

Foi preparada uma base ("Composição 1") com uma concentração de 1,5% de di-hidroxiacetona (DHA), propileno glicol, água desionizada e o remanescente etanol. Foi preparada uma série de composições similares com as mesmas concentrações de DHA, propileno glicol, água, e etanol, entretanto, para cada uma das composições adicionais, foi também incluído 2% de um extrato natural particular ou 0,2% de glicosamina.

Os seguintes extratos foram avaliados: Gatuline Age Defense (mistura de água e semente de *Juglans regia* (noz), disponível comercialmente junto a Gattefosse de Saint-Priest, França), Complexo Triplo A (mistura de extrato de artemísia e extrato de alga verde *Ulvaceae*, disponível comercialmente junto a Barnet Products Corporation de Englewood Cliffs, New Jersey, EUA), Vegerysyl LP (uma proteína de soja hidrolisada processada convencionalmente), e leite de soja NA22077 (um hidrolisado de proteína total de soja convencionalmente processado, disponíveis comercialmente junto a Crodarom de Les Plaines, Chanac, França). Em adição à avaliação de vários extratos, a glicosamina foi também avaliada por sua capacidade de acentuar o desenvolvimento de cor de DHA.

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

Teste *in vivo* de escurecimento da pele

Foram identificados dois seres humanos com tipos de pele I a III, de acordo com a classificação de Fitzpatrick, com idade variando de 21 a 50 anos. Para cada indivíduo, foi determinada uma localização para cada uma das composições a ser testada e foram tomadas leituras X iniciais de cromômetro com o uso de um cromômetro disponível junto à Konica Minolta Sensing de Ramsey, NJ, EUA. Foi calculada a média dessas leituras para chegar à leitura de referência para cada indivíduo. Cada uma das composições descritas acima foi aplicada, por esfregação, a uma área distinta do antebraço de cada indivíduo em uma quantidade de 18 mg sobre uma área da pele de

9 cm². As composições foram deixadas secar e após três períodos de tempo: 3 horas, 6 horas e 24 horas, foram tomadas leituras adicionais de cromômetro. A mudança na tonalidade (dL) foi calculada como a diferença entre a leitura média após o tratamento e a leitura média da referência.

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

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

Os resultados do teste são mostrados na tabela 1.

15

Tabela 1

Exemplo	Descrição	dL (3 h)	% dL _{norm} (3 h)	dL (6 h)	% dL _{norm} (6 h)	dL (24 h)	% dL _{norm} (24 h)
Comp. 1	Nenhum extrato	0,185	0,0	-1,473	0,0	-3,191	0,0
Ex. 1	Glicosamina	-0,454	283	-1,227	-16,7	-4,14	29,9
Comp. 2	"Gatuline Age Defense"	-0,605	411	-1,506	2,2	-3,62	13,6
Comp. 3	Complexo Triplo A	-0,320	170	-1,689	14,6	-3,05	-4,4
Comp. 4	Vegerysyl	-0,067	43,2	-0,485	-67,137.7	-3,07	-3,6
Comp. 5	Leite de soja NA22077	0,534	54,9	-0,918	-	-3,62	13,4

- Em comparação com as composições contendo extratos naturais de alto desempenho, isto é, o extrato de semente de noz (Composição 2) e o extrato de artemísia (Composição 3), a composição de glicosamina (Exemplo 1)
- 20 forneceu em 24 horas um aumento dramático de escurecimento em relação ao escurecimento da DHA sozinha. Ele também foi muito mais alto (cerca do triplo)

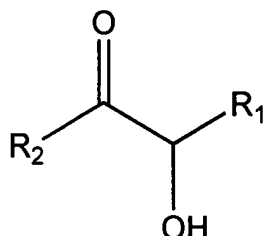
do que a outra melhor composição testada. A glicosamina também tem uma vantagem de não somente ser derivada naturalmente, mas também de ter um maior grau de consistência em composição química.

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

REIVINDICAÇÕES

1. Composição compreendendo:

um agente de autobronzeamento que tem a seguinte fórmula:



5

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

2. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o aminoaçúcar é selecionado do grupo que consiste em glicosamina, N-acetil glicosamina, manosamina, N-acetil manosamina, galactosamina, N-acetil galactosamina e misturas dos mesmos.

3. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o aminoaçúcar é glicosamina.

4. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o aminoaçúcar é glicosamina e o agente de autobronzeamento é di-hidroxiacetona.

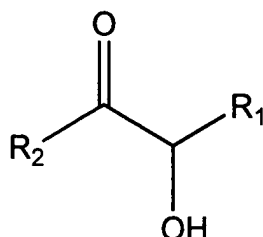
5. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o agente de autobronzeamento é di-hidroxiacetona.

6. Composição, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que o agente de autobronzeamento está presente na composição em uma quantidade de cerca de 0,01% a 15% em peso da composição.

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

8. Composição, de acordo com a reivindicação 1, em que o aminoaçúcar está presente na composição em uma quantidade de cerca de 0,1% a cerca de 1% em peso da composição.

9. Método de escurecimento da pele, o dito método compreendendo aplicar topicamente à dita pele uma composição compreendendo um agente de autobronzeamento que tem a seguinte fórmula:



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

10. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que o aminoaçúcar é selecionado do grupo que consiste em glicosamina, N-acetil glicosamina, manosamina, N-acetil manosamina, galactosamina, N-acetil galactosamina e misturas dos mesmos.

11. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que o aminoaçúcar é glicosamina.

12. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que o aminoaçúcar é glicosamina e o agente de autobronzeamento é di-hidroxiacetona.

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

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

15. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que o aminoaçúcar está presente na composição em uma quantidade de cerca de 0,1% a cerca de 10% em peso da composição.

16. Método, de acordo com a reivindicação 9, em que o aminoaçúcar está presente na composição em uma quantidade de cerca de 0,1% a cerca de 1% em peso da composição.

RESUMO

Patente de Invenção: **"COMPOSIÇÕES QUE COMPREENDEM AGENTES DE AUTOBRONZEAMENTO E AMINOAÇÚCARES"**.

5 A presente invenção refere-se a uma composição para escurecimento da pele. A composição inclui um agente de autobronzeamento e um aminoaçúcar. Em um outro aspecto, um método de escurecimento da pele inclui aplicar topicamente a composição acima à pele.