



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

(21) **PI 1105913-3 A2**

(22) Data de Depósito: 02/09/2011
(43) Data da Publicação: 15/01/2013
(RPI 2193)



(51) Int.Cl.:

A61K 8/98
A61K 8/97
A61K 8/90
A61K 8/891
A61K 8/81
A61K 8/73
A61K 8/42
A61K 8/41
A61K 8/37
A61K 8/362
A61K 8/35
A61K 8/34
A61K 8/31
A61K 8/25
A61K 8/04
A61Q 17/04

(54) Título: COMPOSIÇÕES DE FILTRO SOLAR

(30) Prioridade Unionista: 03/09/2010 US 12/875,163

(73) Titular(es): Neutrogena Corporation

(72) Inventor(es): Laura C. Singleton

(57) Resumo: Patente de Invenção: COMPOSIÇÕES DE FILTRO SOLAR. A presente invenção refere-se a composições de filtro solar contendo uma fase oleosa descontínua em uma fase aquosa contínua, pelo menos 10% em peso de um filtro UV orgânico, um silicone líquido C₂-C₈, insolúvel em água, um éster de ácido graxo ramificado de um ácido carboxílico poliprótico; e pelo menos 2% em peso de um particulado mineral que tem um revestimento de amido aplicado à superfície do mesmo.

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**COMPOSIÇÕES DE FILTRO SOLAR**".

CAMPO DA INVENÇÃO

A presente invenção refere-se a composições de filtro solar tópicas que têm a capacidade de serem aplicadas com êxito à pele molhada.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

Os produtos para proteção solar convencionais tomam a forma, em geral, de compostos de filtro UV e/ou compostos de filtração UV particulados (coletivamente, "ativos de proteção solar") que são solubilizados, emulsionados, ou dispersados em um veículo, que é aplicado topicamente à pele. Os ativos de proteção solar, tipicamente através de polímeros auxiliares e outros ingredientes incluídos no veículo, formam sobre a pele uma camada fina, protetora, e frequentemente resistente à água.

Os requerentes reconheceram que, infelizmente, embora os produtos de proteção solar típicos tenham êxito em fornecer uma barreira protetora durável quando aplicados à pele seca, tipicamente não é esse o resultado quando tais produtos são aplicados à pele que está umedecida por suor ou encontra-se com água residual. De fato, quando aplicado à pele, a tendência dos produtos de proteção solar convencionais é diluir os ativos de proteção solar, espalhar-se, e formar um filme incompleto, o que geralmente forma flocos ou descola na pele, e/ou assume uma aparência branca e pastosa. Os inventores descobriram que esse branqueamento indesejável é particularmente problemático quando a composição em si inclui água.

Outros têm contemplado uma solução para aplicar o protetor solar à pele molhada com o uso de um emulsificante de água em óleo para "autoemulsificar", presumivelmente na presença da água residual presente sobre a pele. Entretanto, os requerentes reconheceram que graves problemas estéticos e de desempenho ainda existem na técnica anterior de produtos para proteção solar para a "pele molhada". Conseqüentemente, os requerentes agora identificaram uma nova composição que fornece uma aplicação consistente e agradável à pele molhada, assim como a capacidade do filme resultante conferir proteção à pele contra os danos da radia-

ção ultravioleta.

SUMÁRIO DA INVENÇÃO

5 A presente invenção refere-se a composições de filtro solar que compreendem uma fase oleosa descontínua dispersa em uma fase aquosa contínua, cerca de 10 por cento ou mais em peso de um filtro UV orgânico, um silicone líquido C₂-C₈ insolúvel em água e de baixa volatilidade, um éster de ácido graxo ramificado de um ácido carboxílico poliprótico; e cerca de 2 por cento ou mais em peso de um particulado mineral que compreende um revestimento de amido aplicado à superfície do mesmo.

10 DESCRIÇÃO DETALHADA

Conforme usado na presente invenção, o termo "cosmeticamente aceitável" significa adequado para uso em contato com tecidos (por exemplo, a pele) sem toxicidade, incompatibilidade, instabilidade, irritação, resposta alérgica, ou similares. Todas as porcentagens da presente invenção são porcentagens em peso com base na concentração total da composição, fases oleosa ou aquosa, ou particulado mineral, respectivamente.

15 As composições da presente invenção incluem uma fase oleosa descontínua e uma fase aquosa contínua. Assim como o versado na técnica compreenderia, o termo "fase oleosa descontínua" significa uma agregação fisicamente distinta de compostos orgânicos intimamente misturados e hidrofóbicos, que são estabilizados dentro de uma fase aquosa. Os compostos que podem ser incluídos na fase oleosa incluem, por exemplo, compostos orgânicos, filtros UV, silicones líquidos, ésteres de ácido graxo de ácidos policarboxílicos, agentes gelificantes de óleos, e ceras, entre outros compostos hidrofóbicos. A concentração da fase oleosa na composição pode ser de 20
25 cerca de 10 por cento a cerca de 80 por cento, como de cerca de 20 por cento a cerca de 70 por cento, como de cerca de 30 por cento a cerca de por cento, como de cerca de 40 por cento a cerca de 60 por cento.

O termo "fase aquosa contínua" significa uma agregação fisicamente distinta de água e outros ingredientes opcionais que são, em geral, hidrofílicos e intimamente misturados com isso. Os ingredientes adequados para uso na fase aquosa incluem, por exemplo, sais dissolvidos com cloreto

de sódio, tensoativos solúveis em água, conservantes e corante solúveis em água, agentes quelantes, ajustadores e tampões de pH (por exemplo, ácido cítrico, hidróxido de sódio, bicarbonato e similares), compostos biologicamente ativos solúveis em água, glicerina, glicóis, e similares. Em certas modalidades da invenção, a concentração da fase aquosa na composição é de 20% a cerca de 90%, como de cerca de 30% a cerca de 80%, como de cerca de 35% a cerca de 65%, como de cerca de 40% a cerca de 65% em peso da composição. Em certas modalidades, a concentração da fase aquosa é maior que a concentração da fase oleosa.

Em certas modalidades, a fase oleosa descontínua pode ser substancialmente dispersa de modo homogêneo na fase aquosa e pode ser de fase estável. O termo "fase estável", significa que não há separação notável ou decantação da fase oleosa em relação à fase aquosa após exposição a 40°C durante duas semanas. Em certas modalidades, não há separação notável ou decantação da fase oleosa em relação à fase aquosa após exposição a 40°C durante seis semanas, ou em outras modalidades, após exposição a 40°C durante três meses. Nas composições de fase estável, a fase oleosa descontínua pode ser estabilizada dentro da fase aquosa contínua de modo que a fase oleosa discreta está presente, sendo que a maioria das partículas tem um tamanho de partícula que é de cerca de 0,2 microns a cerca de 10 microns, com mais preferência de cerca de 0,5 microns a cerca de 5 microns, e com a máxima preferência de cerca de 0,75 microns a cerca de 5 microns. Em outras modalidades, as composições podem ser de tal modo que a fase oleosa pode estar dispersa dentro da fase aquosa na luz e em agitação moderada antes do uso.

As composições da presente invenção incluem um filtro UV orgânico. Os filtros UV orgânicos úteis na presente invenção são compostos cosmeticamente aceitáveis que absorvem radiação na faixa UV são, em geral, solúveis em um ou mais solventes hidrocarbonetos orgânicos. O filtro UV orgânico absorve a radiação em alguma porção do espectro ultravioleta (290 nm a 400 nm), e pode ser um coeficiente de extinção de pelo menos cerca de $1000 \text{ mol}^{-1} \text{ cm}^{-1}$, por exemplo, maior que 10.000 ou 100.000 ou

1.000.000 mol⁻¹ cm⁻¹, por pelo menos um comprimento de onda dentro do espectro ultravioleta definido acima.

Exemplos de filtros UV orgânicos incluem, porém não se limitam a, 3-benzilideno cânfora, especificamente 3-benzilideno norcânfora e derivados dessas substâncias, por exemplo 3-(4-metil benzilideno) cânfora; derivados de ácido 4-amino benzóico, especificamente ésteres 2-etil hexílicos de ácido 4-(dimetilamino)benzóico, ésteres 2-octílicos de ácido 4-(dimetilamino)benzóico e éster amílico de ácido 4-(dimetilamino)benzóico; ésteres de ácido cinamônico, em particular éster 2-etil hexílico de ácido 4-metóxi cinamônico, éster propílico de ácido 4-metóxi cinamônico, éster isoamílico de ácido 4-metóxi cinamônico, éster 2-etil hexílico de ácido 2-ciano-3,3-fenil cinamônico (octocrileno); ésteres de ácido salicílico, isto é, éster 2-etil hexílico de ácido salicílico, éster 4-isopropil benzílico de ácido salicílico, éster homomentílico de ácido salicílico; derivados de benzofenonas, em particular 2-hidróxi-4-metóxi benzofenona, 2-hidróxi-4-metóxi-4'-metil benzofenona, 2,2'-diidróxi-4-metóxi benzofenona; ésteres de ácido benzalmalônico, em particular éster di-2-etil hexílico de ácido 4-metóxi benzomalônico; derivados de triazina, por exemplo 2,4,6-trianilino-(p-carbo-2'-etil-1'-hexilóxi)-1,3,5-triazina e octil triazona; ou ácido benzóico, 4,4'-[[6-[[[(1,1-dimetil etil)amino]carbonil]fenil]amino]-1,3,5-triazina-2,4-diil]diimino]bis-, éster bis (2-etil hexílico) (UVASORB HEB); propano-1,3-dionas, por exemplo 1-(4-ter.butil fenil)-3-(4'-metóxi fenil) propano-1,3-diona; derivados de cetotriciclo (5.2.1.0) decano; derivados de benzoil metano, por exemplo 1-(4'-ter.butil fenil)-3-(4'-metóxi fenil)propano-1,3-diona, 4-ter-butil-4'-metóxi dibenzoil metano (PARSOL 1789), 1-fenil-3-(4'-isopropil fenil)-propano-1,3-diona, derivados de ácido benzóico, éster hexílico de ácido 2-(4-dietilamino-2-hidróxi benzoil)-benzóico (UVINUL A+), ou ácido 1H-benzimidazol-4,6-dissulfônico, 2,2'-(1,4-fenileno)bis-, sal dissódico (NEO HELOPAN AP); e benzotriazóis, em particular o derivado de benzotriazol conhecido como 2,2'-metileno-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-il)-4-(1,1,3,3-tetrametil butil)-fenol) [INCI: bisoctil triazol], que está disponível sob o nome comercial TINOSORB M junto à CIBA Chemicals. Um outro derivado útil de benzotriazol é 2-(2H-benzotria-

zol-2-il)-4-metil-6-[2-metil-3-[1,3,3,3-tetrametil-1-[(trimetilsilil)óxi]dissiloxa-
nil]propil]-fenol (CAS n°: 155633-54-8), também identificado pelo nome INCI
drometrizol trissiloxano, e disponível junto à Chimex sob o nome comercial
MEXORYL XL. Também são disponíveis derivados de triazina assime-
5 tricamente substituídos, e 2,4-bis-[[4-(2-etil-hexilóxi)-2-hidróxi]-fenil]-6-(4-me-
tóxi fenil)-1,3,5-triazina (INCI: anisotriazina) que está comercialmente dispo-
nível sob o nome comercial TINOSORB S junto à CIBA.

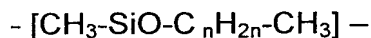
Em uma modalidade, o filtro UV orgânico é selecionado a partir
do grupo que consiste em octocrileno, a benzotriazol, anisotriazina, e éster
10 de ácido salicílico, um éster de ácido cinâmico e um derivado de um ben-
zoilmetano.

O filtro UV orgânico está presente na composição em uma con-
centração que é de cerca de 10% ou mais, como cerca de 10% a cerca de
40%, como de cerca de 10% a cerca de 35%, como de cerca de 15% a
15 cerca de 35%, por exemplo, de cerca de 20% a cerca de 35% em peso.

Conforme o versado na técnica reconhecerá prontamente, o
termo "filtro UV orgânico" não inclui partículas de filtração ultravioleta,
("partículas de filtração UV") usadas tipicamente pelo menos em parte para
dispersar a radiação ultravioleta. Os exemplos incluem óxidos orgânicos que
20 incluem dióxido de titânio, óxido de zinco; óxidos de ferro, óxidos de silicone;
ou outros óxidos metálicos (por exemplo, metal de transição, como metal de
transição cristalino). As partículas de filtração UV são, tipicamente, partículas
sólidas tendo uma dimensão (*por exemplo.*, um diâmetro) de cerca de 0,1
mícron a cerca de 10 microns. Embora em certas modalidades da invenção,
25 as partículas de filtração UV podem ser incluídas em composições da pre-
sente invenção, elas são excluídas em certas outras modalidades. Para
aquelas modalidades em que as partículas de filtração UV são incluídas, a
concentração das partículas UV na composição pode ser de cerca de 0,1% a
cerca de 10%, como de cerca de 0,5% a cerca de 5%, como de cerca de
30 0,5% a cerca de 2%.

As composições da presente invenção incluem um silicone líqui-
do C₂-C₈ insolúvel em água e de baixa volatilidade. O termo "baixa-volati-

lidade" significa compostos que têm um ponto de fulgor acima de cerca de 150°C, como acima de cerca de 200°C. O termo silicone líquido significa um composto que tem pelo menos um siloxano (ligação Si-O-Si) tendo um ponto de fusão abaixo de 25°C. O silicone líquido é, em certas modalidades, insolúvel em água, e, em certas modalidades, solúvel em isopropanol. O silicone líquido pode ter uma estrutura que inclui uma ou múltiplas unidades de:



em que n é de 2 a 8, como de 2 a 4. Um exemplo particularmente adequado é o composto em que n=2, disponível como SILWAX D02 (INCI: etil meticona) junto à Siltech de Dacula, Georgia, EUA.

O silicone líquido C₂-C₈ insolúvel em água e de baixa volatilidade funciona, em geral, para fornecer plasticidade ao filme que é criado sobre a pele, e para evitar o branqueamento (por exemplo, pelo aumento do índice de refração do filme) que poderia de outro modo ocorrer quando a composição entra em contato com a água presente sobre a pele. A concentração do silicone líquido não-volátil presente na composição pode ser de cerca de 0,5% a cerca de 10%, ou de cerca de 1% a cerca de 6%, ou de cerca de 2% a cerca de 4%.

As composições da presente invenção incluem um éster de ácido graxo ramificado de um ácido carboxílico poliprótico ("BFEPCA"). O éster de ácido graxo de um ácido carboxílico poliprótico tem um ponto de fusão abaixo de 25°C, é insolúvel em água e pode ser solúvel em isopropanol. Em uma modalidade notável, o BFEPCA é um produto da reação de um ácido poliprótico com um ácido graxo C₁₀-C₃₀, como um ácido graxo C₁₂-C₂₂. O ácido graxo pode ser ramificado. O ácido poliprótico pode ser selecionado a partir do grupo que consiste em ácido cítrico, ácido ascórbico, ácido fosfórico e ácido sulfúrico. Em uma modalidade, o ácido poliprótico é ácido cítrico ou ácido ascórbico. O ácido cítrico é particularmente notável.

Por exemplo, o BFEPCA pode ter cinco ou mais grupos éster por molécula. Um exemplo adequado de um BFEPCA é um poliéster citrato de octildodecila que está comercialmente disponível como COSMOSURF CE-

100 junto à SurfaTechCorporation/Siltech Corporation de Dacula, Geórgia, EUA.

O BFECPA participa na capacidade da composição excluir água durante a formação do filme, e serve também para evitar o descolamento no filme e resistir à degradação pela água após a formação do filme.

A concentração de BFECPA presente na composição pode ser de cerca de 2% a cerca de 40%, ou de cerca de 4% a cerca de 25%, ou de cerca de 8% a cerca de 18%. O BFEPKA e o silicone líquido estão, em certas modalidades, presentes em uma razão de BFEPKA para silicone líquido que é de cerca de 1,5 a cerca de 8, como de cerca de 2 a cerca 4.

As composições da presente invenção incluem um mineral particulado revestido pelo menos parcialmente com amido. O termo "particulado" significa um sólido dividido finamente que é, em geral, insolúvel em água, como um que apresenta um tamanho médio de partícula em uma faixa de cerca de 0,1 microns a cerca de 20 microns. O mineral particulado compreende uma porção mineral, como uma que inclui qualquer das várias sílicas, óxidos e/ou aluminossilicatos; e uma porção de revestimento que é aplicada à superfície do mineral de modo a cobrir pelo menos parcialmente a porção mineral. O revestimento pode ser contínuo e cobrir substancialmente toda a superfície da porção mineral, ou pode ser descontínuo e cobrir uma porção substancial, mas não toda a superfície da porção mineral. A porção de revestimento inclui um amido.

O amido pode ser derivado de plantas como milho, trigo, arroz, tapioca, batata, sagu, e similares, incluindo qualquer das versões cerosas de tais amidos (contendo menos que 5% de amilose), gomas com alta amilase (contendo mais que 40% de amilose), aqueles com um comprimento de cadeia modificado, e/ou combinações dos mesmos. Em certas modalidade preferenciais, o amido é amido de arroz.

A porção mineral pode estar presente em uma porcentagem em peso do particulado mineral que é de cerca de 80% a cerca de 98%, como de cerca de 80% a cerca de 97%, como de cerca de 85% a cerca de 96%. A porção de revestimento pode estar presente em uma porcentagem em peso

do particulado mineral que é de cerca de 2% a cerca de 20%, como de cerca de 3% a cerca de 20%, como de cerca de 4% a cerca de 15%.

O particulado mineral, em certas modalidades, tem uma capacidade de absorção de óleo mineral de cerca de 20 ml/100 g ou maior, como
5 cerca de 100 ml/100 g ou maior, como cerca de 200 ml/100 g ou maior. A
capacidade de absorção de óleo mineral é determinada ao colocar 3 a
5 gramas da amostra de teste sobre uma placa de vidro e adicionar uma
gota de óleo mineral, misturando com uma espátula. O ponto de extremi-
dade é indicado quando a amostra produz uma pasta muito compacta que
10 não se quebra ou não se separa. A pasta deve ser capaz de ser espalhada
com a espátula sem separação. O teste é realizado em triplicata.

O particulado mineral pode ser preparado por quaisquer meios conhecidos pelos versados na técnica. O métodos adequados incluem partí-
culas minerais de revestimento com amido por meio de aspensão do amido
15 sobre as partículas minerais e secagem subsequente.

Em um processo exemplificador, a água e o amido de arroz são misturados e aquecidos por tempo suficiente para gelatinizar o amido. Essa
mistura de amido gelatinizado é pulverizada com alta pressão sobre as
partículas de sílica esféricas e porosas que têm um diâmetro na faixa de
20 cerca de 1 micron a cerca de 10 microns. Durante o processo de pulve-
rização, a sílica é misturada em um misturador de alta intensidade e alta
velocidade para assegurar um revestimento homogêneo. A mistura de sílica
e amido gelatinizado é então seca à vácuo durante um período de tempo
suficiente para remover a água. As proporções relativas de sílica e amido re-
vestidas sobre isso são selecionadas para alcançar uma razão entre peso de
25 sílica para amido de cerca de 95:5.

Uma vez que o particulado mineral é insolúvel na fase oleosa ou na fase aquosa, o particulado existe na composição, em geral, como uma
fase dispersa discreta, isto é, que não é parte da fase oleosa nem da fase
30 aquosa.

A quantidade de particulado mineral na composição é cerca de 2% ou mais em peso. Em certas modalidades o particulado mineral está

presente em uma concentração de cerca de 4% ou mais, como cerca de 4% a cerca de 10%, ou de cerca de 4% a cerca de 8%.

As composições da presente invenção podem incluir qualquer agente gelificante de óleo. O termo "agente gelificante de óleo" significa um composto que é capaz de formar um gel com óleo mineral ou dimeticona. Em particular, quando o agente gelificante de óleo é misturado com óleo mineral ou dimeticona em uma concentração de agente gelificante de óleo que está entre cerca de 0,25% a 2,0% em peso, a mistura resultante tem um limite elástico de pelo menos cerca de 5 pascals (Pa), como pelo menos cerca de 10 Pa, como cerca de 10 Pa a cerca de 1100 Pa.

Agentes gelificantes de óleos adequados incluem ésteres de glicerol de vários ácidos graxos, por exemplo, ésteres de glicerol de ácidos graxos que têm um comprimento de cadeia de carbono de pelo menos C₁₆. Um exemplo adequado é uma mistura de mono, di, e triglicerídeos de ácido beênico (C₂₂) vendido sob o nome comercial COMPRITOL 888 junto à Gattefosse da França.

Outros agentes gelificantes de óleos adequados incluem copolímeros de siloxanos e incluindo porções hidrofílicas, como copolímeros de siloxanos e monômeros tendo porções alcóxi. Exemplos adequados incluem materiais algumas vezes classificados como emulsificantes de água em óleo. Um exemplo adequado é o PEG/PPG-19/19 dimeticona, que é vendido em solvente ciclopentasiloxano como Dow Corning BY-11030 disponível junto à Dow Corning de Midland, Michigan, EUA.

Outros agentes gelificantes de óleos incluem copolímeros de tais monômeros como etileno, propileno, butileno, e/ou estireno, por exemplo, terpolímeros of etileno, propileno, e estireno e terpolímeros de butilenos, etileno, e estireno. Esses terpolímeros são vendidos sob o nome comercial VERSAGEL F-1000 junto à Penreco de Los Angeles, Califórnia, EUA.

Outros agentes gelificantes de óleos particularmente adequados incluem metilcelulose, e éter etílico de celulose compreendendo um polímero de cadeia longa consistindo em unidades de anidrocélulose unidas por ligações acetal. Uma forma adequada de etilcelulose está disponível como uma

mistura com cocoato mono- e di-ésteres de butileno glicoleálcool isoestearílico (álcool graxo). A mistura é vendida como "EMULFREE CBG disponível junto à Gattefosse de Paris, França.

As composições da presente invenção podem incluir um polímero formador de filme para melhorar a formação de filme e fornecer resistência à água. O termo "polímero formador de filme," significa um polímero que quando dissolvido na composição, permite a formação de um filme contínuo ou semi-contínuo quando a composição é espalhada sobre, por exemplo, vidro liso, permitindo que o veículo líquido evapore. Como tal, o polímero deve secar sobre o vidro de maneira que a área sobre a qual o polímero é espalhado deve ser predominantemente contínua, em vez de formar uma pluralidade de estruturas discretas semelhantes a ilhas. Em geral, os filmes formados pela aplicação de composições sobre a pele de acordo com modalidades da presente invenção aqui descritas, têm menos que, em média, cerca de 100 microns de espessura, como cerca de menos de 50 microns.

Os polímeros formadores de filme adequados incluem polímeros naturais como polissacarídeos ou proteínas e polímeros sintéticos como poliésteres, poliacrílicos, poliuretanos, polímeros de vinila, polissulfonatos, poliureias, polioxazolinias, e similares. Exemplos específicos de polímeros formadores de filme incluem, por exemplo, homopolímeros ou copolímeros acrílicos com grupos hidrofóbicos como copolímeros de acrilato/ocilacrilamida incluindo DERMACRYL 79 disponível junto à Akzo Chemical de Bridgewater, Nova Jersey, EUA; copolímero de dimeticona/acrilato dimeticona disponível junto à X-22-8247D de Shin-Etsu do Japão; copolímero hidrogenado de dilinoleil/carbonato dimetílico, disponível junto à Cognis Corporation de Ambler, Pensilvânia como COSMEDIA DC; copolímero de vinilpirrolidona e uma alfa-olefina de cadeia longa, como aqueles disponíveis comercialmente junto à ISP Specialty Chemicals de Wayne, Nova Jersey, EUA como GANEX V220; copolímeros de vinilpirrolidona/tricontanill disponíveis como GANEX WP660 também junto à ISP; poliésteres dispersíveis em água, incluindo sulfopoliésteres como aqueles disponíveis comercial-

mente junto à Eastman Chemical como EASTMAN AQ 38S. Em certas modalidades, o polímero formador de filme é insolúvel em água, mas é entregue sob a forma solúvel mediante a exposição a alcalinidade para facilitar a remoção do polímero da pele durante a lavagem com sabão.

5 A quantidade de polímero formador de filme presente na composição pode ser de cerca de 0,25% a cerca de 15%, ou de cerca de 0,5% a cerca de 10%, ou de cerca de 1% a cerca de 3%.

Em certas modalidades, a composição inclui uma cera. O termo cera significa um ou mais compostos hidrofóbicos que têm um ponto de fusão que está na faixa de 30°C a 120°C, como na faixa de 45°C a 100°C. Em uma modalidade, o componente de cera inclui um composto de cera que tem um ponto de fusão de cerca de 75°C a 100°C.

O termo "composto hidrofóbico adicional," significa um composto que inclui uma porção hidrofóbica que satisfaz a um ou mais dos seguintes critérios: (a) ter uma cadeia de carbono de pelo menos seis carbonos em que nenhum dos seis carbonos é um carbono carbonila ou tem uma porção hidrofílica (definida abaixo) ligada diretamente a isso; (b) ter dois ou mais grupos alquila silóxi; ou (c) ter dois ou mais grupos oxipropileno em sequência. A porção hidrofóbica pode incluir grupos lineares, cíclicos, aromáticos, saturados ou insaturados. O composto hidrofóbico não é anfifílico e, como tal, não inclui porções hidrofílicas como um grupo aniônico, catiônico, zwitteriônico, ou não-iônico que é polar, incluindo sulfato, sulfonato, carboxilato, fosfato, fosfonatos, amônio, incluindo espécies mono-, di-, e triálquil amônio, piridínio, imidazólio, amidínio, poli(etilenoimínio), amônio alquil sulfonato, amônio alquil carboxilato, anfoacetato, e porções poli(etilenóxi)sulfonil. Em certas modalidades, o composto hidrofóbico não inclui porções hidroxila.

As ceras adequadas incluem qualquer entre vários hidrocarbonetos (alcanos ou alquenos de cadeia reta ou ramificada, cetona, dicetona, álcoois primários ou secundários, aldeídos, ésteres de esteróis, ácido alcanóicos, turpenos, monoésteres), como aqueles que têm um comprimento de cadeia de carbono que varia de C₁₂-C₃₈. Também são adequados

diésteres ou outros ésteres ramificados. Em uma modalidade, o composto é um éster de um álcool (glicerol ou outro além de glicerol) e um ácido graxo C₁₈ ou maior.

Os exemplos não-limitadores incluem qualquer entre várias ceras naturais incluindo cera de lótus, (por exemplo, Nelumbo Nucifera Floral Wax disponível junto à Deveraux Specialties, Silmar, Califórnia, EUA); cera de abelhas (por exemplo, White Beeswax SP-422P disponível junto à Strahl and Pitsch de West Babylon, Nova York, EUA), ceras de insetos, óleo de esperma de baleia, lanolina, ceras de origem vegetal como cera de canaúba, óleo de jojoba, cera candelilla; ceras minerais como cera de parafina; e ceras sintéticas como palmitato de cetila, palmitato de laurila, estearato de cetoestearila, e cera de polietileno (por exemplo, PERFORMALENE 400, tendo um peso molecular de 450 e um ponto de fusão de 84°C, disponível junto à New Phase Technologies de Sugar Land, Texas, EUA); e ceras de silicone como alquila meticona C₃₀₋₄₅ e olefina C₃₀₋₄₅ (por exemplo, Dow Corning AMS-C30, tendo um ponto de fusão de 70°C, disponível junto à Dow Corning de Midland, Michigan, EUA). Em certas modalidades, o componente de cera inclui um éster de glicerol de alto ponto de fusão como o monoestearato de glicerol.

A quantidade de cera pode estar presente na composição de cerca de 0,1% a cerca de 5%, ou de cerca de 0,1% a cerca de 2%, ou de cerca de 0,1% a cerca de 1%.

As composições da presente invenção podem incluir um polímero de silicone modificado por alquila. O polímero de silicone disperso modificado por alquila pode ser insolúvel em isopropanol assim como insolúvel em água. O polímero de silicone modificado por alquila inclui, em geral, um grupo alquila C₈– C₃₀ linear ou cíclico, saturado ou insaturado, como um grupo alquila C₁₂– C₂₂.

O silicone modificado por alquila serve, em geral, para reduzir a tensão superficial, melhorar a exclusão de água e reduzir o branqueamento. Um exemplo de um polímero de silicone modificado por alquila adequado que se dispersa satisfatoriamente em solventes como o isopropanol inclui

copolímeros de cetil dimeticona e bis-vinil dimeticona, como SILWAX CR-5016, disponível comercialmente junto à SilTech de Dacula, Geórgia, EUA. Para as modalidades em que o polímero de silicone modificado por alquila é insolúvel seja na fase oleosa ou na fase aquosa, o polímero de silicone modificado por alquila pode existir na composição como uma fase dispersa discreta, isto é, não faz parte da fase oleosa nem da fase aquosa.

A quantidade de polímero de silicone disperso modificado por alquila pode estar presente na composição de cerca de 0,1% a cerca de 1%, ou de cerca de 0,1% a cerca de 0,5%, ou de cerca de 0,1% a cerca de 0,25%.

Quaisquer de vários outros ingredientes cosmeticamente aceitáveis podem ser incluídos na composição em quantidades que não se oponham aos efeitos dos vários outros ingredientes. Por exemplo, os ingredientes como óleos (incluindo ésteres e triglicerídeos emolientes) de origem vegetal, animal ou mineral, fragrâncias, corantes, conservantes, agentes de benefícios para pele, fotoestabilizadores, antioxidantes, agentes gelificantes de fase aquosa (como diestearato de glicerila ou acrílico modificado hidrofobicamente ou outros polímeros de espessamento), agentes neutralizantes (como trietanolamina, hidróxido de sódio, e similares).

Os outros ingredientes podem ser incluídos, em concentrações totais de, por exemplo, menos que cerca de 10%, como menos que cerca de 5%, como menos que cerca de 2%, por exemplo, menos que cerca de 1%.

Exemplos

Os seguintes exemplos não-limitadores ilustram adicionalmente a invenção reivindicada:

Exemplo I: Preparação de Exemplos da Invenção

As seguintes composições foram preparadas:

| Nome comercial | Nome CTFA | Ex. 1 | Ex. 2 | Ex. 3 | Ex. 4 | Ex. 5 |
|----------------|--|-------|-------|-------|-------|-------|
| Água | Água | 45,25 | 47,48 | 43,46 | 55,22 | 51,50 |
| PEMULEN TR-2 | Acrilatos/C ₁₀₋₃₀ Polímero Cruzado de Acrilato de Alquila | 0,25 | 0,25 | 0,25 | 0,25 | 0,3 |
| | EDTA dissódico | 0,2 | 0,1 | 0,1 | 0,2 | 0,2 |

| | | | | | | |
|--|---|------|------|------|------|------|
| | Glicirizato de dipotássio | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 | 0,1 |
| | Clorfenesina | 0,2 | 0,2 | 0,2 | 0,2 | 0,2 |
| | fenóxi etanol | 0,5 | | | 0,5 | 0,5 |
| Uvinul M40 (BASF) | Oxibenzona; Benzofenona -3/ | 6,00 | 5,00 | 5,00 | 5,00 | 5,00 |
| Octisalato | Salicilato de Octila | 5,00 | 5,00 | 5,00 | 5,00 | 5,00 |
| Avobenzona | Neo Heliopan 357 (Symrise) | 3,00 | 3,00 | 3,00 | 3,00 | 3,00 |
| Neo Heliopan 303 (Symrise) | Octocrileno | 10 | 10 | 10 | 4 | 4 |
| | homosalato | 7,0 | 4,0 | 7,0 | 4,0 | 4,0 |
| CorapanTQ (CP Hall) | Diethylhexil 2,6 Naftalato | 0,1 | 0,10 | 0,10 | 0,10 | 0,1 |
| Cera de Lótus (Deveraux) | | 0,5 | 0,50 | 0,50 | 0,50 | 0,50 |
| Cera de Abelha | | 2,0 | 2,0 | 2,0 | 2,0 | 0,3 |
| X-22 -8247D (ShinEtsu) | Copolímero de Dimeticona (e) Acrilatos/ Dimeticona | 1,5 | 1,50 | 1,50 | 1,50 | 1,75 |
| Sesnsiva | Etilhexilglicerina | 1,0 | 1,0 | 1,0 | 1,0 | 1,0 |
| Lexguard O (Inolex) | caprilil glicol | 0,5 | 0,5 | 0,5 | 0,5 | 0,5 |
| Arlacel 165 VEG | Estearato de glicerina/Estearato PEG-100 | 1,9 | 1,9 | 1,9 | 1,9 | 1,9 |
| Amphisol K | Cetil fosfato de potássio | 0,9 | 1,0 | 1,0 | 1,0 | |
| Compritol 888 (Gattefosse) | Behenato de glicerina (mono,di,tri) | | | | | 1,0 |
| Polímero Cruzado de Citrato de Octildodecila (e) Etil Meticona (e) Cetil Dimeticona / Polímero Cruzado de bis-Vinil Dimeticona ¹ | japonesa | 5,0 | 3,5 | 5,0 | 3,0 | 3,0 |

| | | | | | | |
|-------------------------|---|------|------|------|------|------|
| | BHT | 0,7 | 0,7 | 0,7 | 0,7 | 0,7 |
| Sunspheres | Copolímero de estireno/acrilato | 2,0 | 1,0 | | | |
| Água (Neutralização) | | 1,5 | 1,5 | 1,5 | 1,5 | 6,5 |
| Trietanolamina | | 0,3 | 0,25 | 0,27 | 0,16 | 0,45 |
| Água | | | 2,4 | 2,4 | | |
| Cosmocil CQ | Propilamidopropil guanida | | 0,4 | 0,4 | | |
| Reosol AVH | Estearato de etilexila; trideceth-6 | 0,1 | 0,1 | 0,5 | 0,15 | |
| | Álcool benzílico | 1,0 | 1,0 | 1,0 | 1,0 | 1,0 |
| Fragrância | | 0,13 | 0,15 | 0,15 | 0,15 | 0,3 |
| Particulado Mineral | Sílica, revestida com amido de arroz | 4,0 | 6,0 | 6,0 | 8,0 | 8,0 |
| TOTAL | | 100 | 100 | 100 | 100 | 100 |

¹Mistura de 79,8% de poliéster citrato de octildodecila (COSMOSURF CE-100), 20% de etil meticona (SILWAX D02), e 0,2% de um copolímero de cetil dimeticona e bis-vinyl dimeticona (SILWAX CR-5016), cada um disponível junto à SilTech.

- 5 Os exemplos foram preparados primeiramente pelo preparo de uma mistura preliminar de fase aquosa carregando o recipiente com a água, PEMULEN TR-2, EDTA dissódico, glicirrizato dipotássico, e clorfenesina, aquecendo a mistura a 80°C e misturando até obter a homogeneidade. Então foi adicionado fenoxietanol (agente gelificante) no caso dos Exemplos
- 10 1, 4 e 5 e a mistura foi novamente misturada até obter a homogeneidade. Em um recipiente secundário foi preparada uma mistura de fase oleosa pela mistura de filtros UV orgânicos e os outros ingredientes listados na Tabela 1, até e incluindo Sunspheres. A mistura de fase aquosa e a mistura de fase oleosa foi misturada durante 5 minutos e, então, homogeneizada durante 3
- 15 minutos para formar uma emulsão preliminar. A emulsão preliminar foi então neutralizada pelo resfriamento até 65°C, adicionando trietanolamina e então misturando até obter uniformidade. A emulsão neutralizada foi deixada para resfriar naturalmente até 40°C e foram adicionados álcool benzílico e fragrância. O particulado mineral foi então adicionado vagarosamente à mistura

para resfriar naturalmente até 30°C-32°C. A mistura foi homogeneizada durante 1 minuto adicional e uma quantidade de água suficiente foi adicionada. No caso do Exemplo 5, 6,5% do total de água presente na formulação foi retida a partir do carregamento inicial do recipiente e foi adicionada após a emulsificação.

Os exemplos foram avaliados quanto à estabilidade a 40°C e branqueamento adverso sobre a pele. A estabilidade, uma medida acelerada de vida útil prevista, foi avaliada colocando as composições a 40°C e então observando qualquer sinerese considerável, por exemplo, uma quantidade considerável de fase oleosa (líquida) visível no topo da composição emulsificada. Uma estabilidade de três meses a 40°C é equivalente, em geral, a 3 anos de vida útil do produto, enquanto que dois meses a 40°C é equivalente, em geral, a 2 anos de vida útil.

O branqueamento sobre a pele foi avaliado pela imersão do braço de um indivíduo humano em água durante aproximadamente 1 a 2 minutos, aplicando em seguida as composições da invenção na área molhada do braço e esfregando as composições sobre a pele. As composições foram aplicadas em quantidades em geral eficientes para fornecer um filme contínuo sobre a área de pele, isto é, cerca de 4 gramas para o braço masculino inteiro ou cerca de 3 gramas para o braço feminino inteiro, tipicamente 0,5 g/15 cm² no mesmo braço.

O Exemplo 1 exibiu somente uma quantidade mínima aceitável de branqueamento quando aplicado à pele e teve estabilidade na fase estável durante 3 meses a 40°C. O Exemplo 5 não mostrou branqueamento discernível sobre a pele e mostrou-se estável durante 3 meses a 40°C. Os Exemplos 2 e 4 mostraram um branqueamento mínimo sobre a pele, mas aceitável, e foram estáveis durante 2 semanas a 40°C. O Exemplo 3 não mostrou branqueamento discernível sobre a pele.

Os resultados anteriores sugerem que as composições, de acordo com a invenção, são surpreendentemente capazes de fornecer de pouco a nenhum branqueamento quando aplicadas à pele molhada. Os resultados anteriores também sugerem que graus variáveis de estabilidade podem ser

alcançáveis, dependendo da formulação particular, como por exemplo, (a) incluindo um agente gelificante de óleo (como o COMPRITOL), ou (b) adicionando 5% (como uma porcentagem da composição inteira) da água após a emulsificação, mas antes da adição do particulado mineral. Para altos níveis de particulado mineral revestido pelo menos parcialmente com amido, a estabilidade é alcançada pela inclusão de um agente gelificante de óleo, incluindo níveis mais altos de água, e/ou seguindo a etapa do processo de reter pelo menos 5% de água até após a emulsificação, mas antes da adição do particulado mineral. Uma vez que se obtenha o benefício da descrição apresentada na presente invenção, o versado na técnica reconhecerá prontamente vários fatores e etapas para ajustar a estabilidade dessas composições.

Exemplo 2: FPS

Os Exemplos 1 e 5 foram testados quanto ao fator de proteção solar (FPS) com o uso de um método de teste de FPS estático in-vivo convencional, de acordo com a monografia final intitulada "Sunscreen Drug Products for Over-The-Counter Human Use" concedida à Food and Drug Administration, em 21 de maio de 1999, Registro Federal de Volume 64, Número 98, páginas 27666 a 27693. Consulte p2-3. O teste incluiu a medida do FPS sobre a pele seca antes e depois da submersão da pele em água durante um total de 80 minutos. O Exemplo 1 exibiu valores de FPS sobre a pele seca de 92,5 antes da submersão e 91,85 após a submersão. O Exemplo 5 exibiu valores de FPS sobre a pele seca de 55,2 antes da submersão e 55,0 após a submersão.

A mesma composição foi testada com o uso do mesmo método, com a exceção de que as composições foram aplicadas à pele molhada após submersão. As composições exibiram um FPS de 86,66 e 47,8 respectivamente, quando aplicadas à pele molhada após a imersão em água. Os resultados mostraram que, surpreendentemente, as composições da invenção perderam apenas uma pequena fração de seus valores de FPS quando aplicadas à pele molhada em comparação com a aplicação à pele seca.

REIVINDICAÇÕES

1. Composição, compreendendo:

uma fase aquosa contínua,

5 nua,

cerca de 10 por cento ou mais em peso de um filtro UV orgânico,

um silicone líquido C₂-C₈, insolúvel em água,

um éster de ácido graxo ramificado de um ácido carboxílico poliprótico; e

10 cerca de 2 por cento ou mais em peso de um particulado mineral que compreende um revestimento de amido aplicado à superfície do mesmo.

2. Composição, de acordo com a reivindicação 1, na qual o dito mineral particulado compreende sílica.

15 3. Composição, de acordo com a reivindicação 1, na qual o dito particulado mineral compreende de cerca de 80 por cento a cerca de 98 por cento em peso do dito mineral e de cerca de 2 por cento a cerca de 20 em peso do dito revestimento de amido.

20 4. Composição, de acordo com a reivindicação 1, compreendendo de cerca de 4 por cento a cerca de 10 por cento em peso do particulado mineral.

5. Composição, de acordo com a reivindicação 1, na qual o dito éster de ácido graxo ramificado de um ácido carboxílico poliprótico compreende um poliéster de citrato de octildodecila.

25 6. Composição, de acordo com a reivindicação 1, na qual o dito silicone líquido C₂-C₈ insolúvel em água compreende etil meticona.

7. Composição, de acordo com a reivindicação 1, na qual o particulado mineral tem uma capacidade de absorção de óleo mineral de cerca de 20 ml/100 g ou maior.

30 8. Composição, de acordo com a reivindicação 1, na qual o dito filtro UV orgânico é selecionado do grupo que consiste em octocrileno, um benzotriazol, anisotriazina, um éster de ácido salicílico, um éster de ácido cinâmico e um derivado de um benzoilmetano.

9. Composição, de acordo com a reivindicação 4, na qual o dito particulado mineral compreende uma sílica que tem um amido de arroz aplicado ao revestimento da mesma, e sendo que a dita composição compreende adicionalmente um agente gelificante.

5 10. Composição, de acordo com a reivindicação 9, que tem uma estabilidade de 3 meses a 40°C.

 11. Composição, de acordo com a reivindicação 1, que tem uma estabilidade de 2 semanas a 40°C.

RESUMO

Patente de Invenção: "**COMPOSIÇÕES DE FILTRO SOLAR**".

A presente invenção refere-se a c'omposições de filtro solar con-
tendo uma fase oleosa descontínua em uma fase aquosa contínua, pelo
5 menos 10% em peso de um filtro UV orgânico, um silicone líquido C₂-C₈,
insolúvel em água, um éster de ácido graxo ramificado de um ácido
carboxílico poliprótico; e pelo menos 2% em peso de um particulado mineral
que tem um revestimento de amido aplicado à superfície do mesmo.