DESCRIÇÃO

DA

PATENTE DE INVENÇÃO

N.º 100374

REQUERENTE: BEIERSDORF AKTIENGESELLSCHAFT, alemã, industrial e comercial, com sede em Unnastrasse 48, D-2000 Hamburg 20, Republica Federal Alemã

EPÍGRAFE: "EMULSÕES MULTIPLAS ESTÁVEIS"

INVENTORES: Gerd Dahms, Dr. Sven Gohla, Rainer Kropke e Jens Nielsen

Reivindicação do direito de prioridade ao abrigo do artigo 4.º da Convenção de Paris de 20 de Março de 1883.

República Federal Alemã em 13 de Abril de 1991 e 24 de Setembro de 1991 sob os números P 41 12 127.9 e P 41 31 678.9 respectivamente

Descrição referente à patente de invenção de BEIERSDORF AKTIEN-GESELLSCHAFT, alemã, industrial e comercial, com sede em Unnastrasse 48, D-2000 Hamburg 20, República Federal Alemã (inventores: Gerd Dahms, Dr. Sven Gohla, Rainer Kropke e Jens Nielsen, residentes na Republica Federal Alemã), para "EMULSÕES MULTIPLAS ESTÁVEIS"

D E S C R I Ç Ã O

A presente invenção refere-se a emulsões múltiplas estáveis, a processos para a sua preparação, bem como à sua utilização para fins cosméticos e medicinais.

Por cuidado cosmético da pele entende-se em primeiro lugar o fortalecimento ou o revestimento da função natural da pele como barreira contra agressões externas (p. ex. sujidade, agentes químicos, microorganismos) e contra a perda dos seus próprios constituintes (por exemplo água, gorduras naturais, electrólitos).

Se se perturbar esta função pode ocorrer um aumento da ressorpção de substâncias tóxicas ou alergénicas ou um ataque de microorganismos e, em consequência disso, reacções cutâneas tóxicas ou alérgicas.

Compete ainda ao cuidado da pele o reequilibrio das gorduras e água perdidas pela lavagem diária. Isto é particularmente importante quando a capacidade de regeneração natural não é suficiente. Além disso, os produtos para o cuidado da pele devem protegê-la das

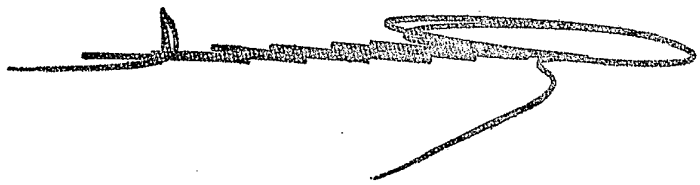
agressões exteriores, em especial do sol, e retardar o seu envelhecimento.

As composições medicamentosas para aplicação tópica contêm em geral um ou mais medicamentos em concentração eficaz. Para facilitar uma mais clara distinção entre aplicação cosmética e medicinal e dos respectivos produtos referem-se as disposições legais da República Federal Alemã (por exemplo decreto sobre cosmética, lei sobre alimentos e medicamentos).

É conhecido que as emulsões múltiplas, entre outras, se distinguem por uma fina textura de emulsão. Esta propriedade é particularmente apropriada como base para preparações tópicas tanto para cosmética como para medecina. Enquanto que os cosméticos apenas se aplicam exteriormente, na utilização clinica de emulsões são admissiveis todos os tipos de aplicação, como por exemplo formas orais de administração.

Numa emulsão simples existem gotas finamente dispersas de uma fase rodeadas por um envólcuro de emulsionantes de outra fase (gotas de água em emulsões w/o ou vesículas de lípido em emulsões o/w). Numa emulsão multipla (do 2º grau), pelo contrário, nessas gotas encontram-se emulsionadas gotas finamente dispersas da primeira fase. Nestas gotas, por sua vez, podem também existir ainda gotas finamente dispersas (emulsões múltiplas do 3º grau) e assim sucessivamente.

Deste modo, tal como existem no caso de emulsões simples emulsões w/o ou o/w (água em óleo ou óleo em água), podem existir emulsões múltiplas w/ow, o/w/o, o/w/o/w, w/o/wo e por aí em diante.



As emulsões multiplas em que as fases aquosas interna e externa ou as fases oleosas interna e externa se formam diferentemente (isto é, por exemplo emulsões w/o/w' e o/w/o') podem preparar-se por processos de gotejamento duplo. As emulsões em que as fases aquosas ou oleosas externas ou internas não se formam diferentemente podem preparar-se tanto por processo de gotejamento simples como por processos de gotejamento duplo.

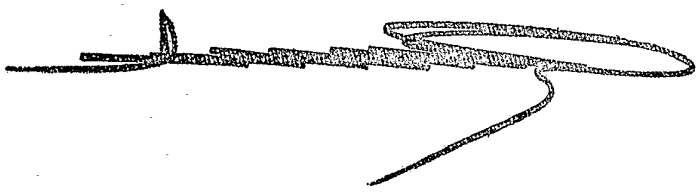
A emulsões múltiplas do 2º grau designam-se normalmente por "sistemas bimultiplos", as do 3º grau por "sistemas trimúltiplos, etc. (W.Seifriz, "Studies in Emulsions", J.Phys, Chem., 29 (1925), 783-749).

Os processos para a preparação de emulsões múltiplas são conhecidos do especialista. Existem por exemplo processos de gotejamento duplo nos quais se parte de uma emulsão simples (por exemplo uma emulsão w/o) e, por adição de uma segunda fase (neste caso, uma fase aquosa) com um emulsionante adequado (neste caso, um emulsionante o/w), se transforma numa emulsão múltipla (neste caso, uma emulsão w/ow).

Um segundo processo consiste em transformar misturas de emulsionantes com uma fase oleosa e uma fase aquosa, por um processo de gotejamento simples, numa emulsão múltipla w/o/w. Os emulsionantes dissolvem-se na fase oleosa e juntam-se à fase aquosa. É necessário para um tal processo os valores HLB (HLB = balanço hidrófilo-lipófilo) de cada um dos emulsionantes utilizados sejam claramente diferentes uns dos outros.

A definição do valor HLB, para ésteres de ácidos gordos e polióis, é dada por

$$HLB = 20 \times (1 - S/A)$$



Para um grupo de emulsionantes cuja componente hidrofílica seja constituida apenas por unudades de óxido de etileno, emprega-se a fórmula

$$HLB = E/5$$

Nas fórmulas anteriores, os significados são os seguintes:

S = número de saponificação do éster

A = número de ácido do ácido formado

E = quantidade de massa de óxido de etileno (em percentagem) na molécula total.

Literatura: "Kosmetic-Entwicklung, Herstellung und Anwendung Kosmetischer Mittel"; W. Umbach (Hrsg.), Georg Thieme Verlag 1988.

Os emulsionantes hidrófilos (com um elevado valor de HLB) são em geral emulsionantes o/w. Portanto, os emulsionantes hidrófobos ou lipófilos (com baixos valores de HLB) são em geral emulsionantes w/o.

A patente US-A-4, 931,210 descreve um processo para a preparação de emulsões w/o/w, no qual se utilizam como emulsionantes polirricinoleatos de poliglicerina.

Embora as emulsões múltiplas sejam já conhecidas e existam processos simples para a sua preparação, não se encontram até hoje sistemas que fossem estáveis microscopicamente. Isto quer dizer que as emulsões multiplas de acordo com o estado da técnica se transformam com o tempo em emulsões simples, ou seja, no que respeita à

multiplicidade, apresentam uma baixa estabilidade no armazenamento. Isto é particularmente inconveniente porque estes produtos de transformação tem uma distribuição de tamanho de gota muito heterogénea.

Na melhor das hipótese, tais produtos de transformação são feios ou, do ponto de vista cosméticos, deselegantes. Muitas vezes, contudo, à falta de homogeneidade na distribuição de tamanhos das gotas está associada uma falta de estabilidade macroscópica, isto é a estabilidade à decomposição em fases separadas.

Também sob este ponto de vista as emulsões multiplas usuais deixam muito a desejar.

Nesta patente, por isso, pelo termo "estabilidade" deve entender-se tanto estabilidade microscópica como macroscópica, salvo indicação em contrário.

O objectivo da presente invenção foi por isso de encontrar emulsões multiplas que não tivessem as desvantagens das preparações de acordo com o estado da técnica.

Foi ainda um objectivo da invenção o de desenvolver um processo que possibilitasse preparar de um modo simples as emulsões desejadas com as propriedades vantajosas pretendidas.

Descobriu-se surpreendentemente, resolvendo-se assim o problema, que se obtêm emulsões múltiplas estáveis quando se utiliza uma mistura de emulsionantes constituida por:

- um primeiro emulsionante hidrofóbo (emulsionante A) ou mais emulsionantes deste tipo em mistura, com as seguintes propriedades:

- deve ser muito soluvel na fase oleosa da emulsão à temperatura de preparação da emulsão,

- não deve ser isotropicamente solúvel em água abaixo de cerca de 50°C,

- deve ser isotropicamente solúvel em água no intervalo de temperaturas entre cerca de 50°C e a temperatura de preparação de emulsão,

- deve funcionar como emulsionante primário w/o no intervalo de temperaturas entre cerca de 50°C e a temperatura de preparação da emulsão;

- e um segundo emulsionante hidrófilo (emulsionante B) ou mais emulsionantes deste tipo em mistura, com as seguintes propriedades:

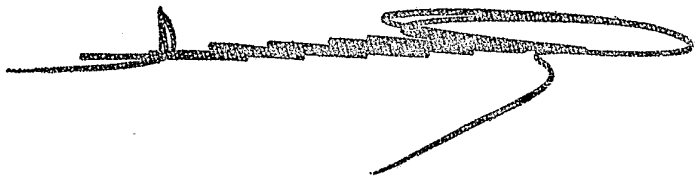
- deve ser isotropicamente solúvel em água,

- deve apresentar uma solubilidade razoavelmente estável no intervalo de temperaturas entre cerca de 50°C e a temperatura de preparação da emulsão.

Em particular, com uma mistura de emulsionantes do tipo referido, podem preparar-se emulsões w/o/w muito vantajosas.

É conveniente escolher os emulsionantes de modo que o emulsionante hodrófilo solvate o emulsionante hidrófobo no ponto de inversão de fase, actuando portanto como solvente da fase oleosa possibilitando a formação de uma emulsão multipla in-situ apenas num processo de um só passo.

É ainda vantajoso que o emulsionante A e o emulsionante B formem uma fase cristalina líquida comum que constituirá a camada fronteira das gotículas da emulsão.



São particularmente vantajosas a misturas de emulsionantes nas quais o ou os emulsionantes hidrófobos A, à temperatura de preparação, tipicamente a cerca de 70°C, são solúveis num óleo não polar, acima de 0,01% em peso, de preferência acima de 5,0% em peso, quando se usa um óleo não polar, ou nas quais o ou os emulsionantes A são solúveis num óleo polar, acima de 0,02% em peso, de prepferencia acima de 20,0% em peso, quando se utiliza um óleo polar.

Em casos particulares as concentrações ideias do emulsionante A num óleo não polar podem desviar-se 5% em peso, quando a concentração critica de formação de micelas (CMC) nesse óleo se desvia claramente do valor de 5% em peso tomado como correcto. Em óleos polares não se observa uma concentração crítica de formação de micelas.

Os óleos não polares são por exemplo óleos minerais, isto é aqueles que se caracterizam por um baixo teor em componentes com grupos moleculares polares.

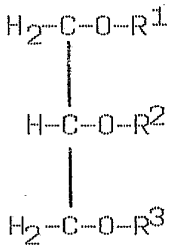
Os óleos polares são por exemplo óleos vegetais (por exemplo óleo de gérmen de milho e de trigo) ou os respectivos equivalentes sintéticos e semi-sintéticos e óleos semelhantes, isto é aqueles que se caracterizam por um maior tero em componentes com grupos moleculares polares, por exemplo grupos éster ou éter.

Nesta patente faz-se a distinção entre solubilidade isotrópica e solubilidade anisotrópica, uma vez que é dificil classificar os tensivactivos com as definições usuais de solubilidade. Um material é isotropicamente solúvel num outro material, quando o primeiro se forma no segundo uma verdadeira solução, sem formação de micelas ou formação de outros agregados identificáveis por processos visuais microscópicos. Um material é anisotropicamente solúvel num

outro material quando o primeiro é solúvel no segundo, através de formação de micelas ou formação de outros agregados identificáveis por processos visuais microscópicos, por exemplo de forma coloidal.

Osemulsionantes hidrófobos A podem pertencer ao grupo constituido por:

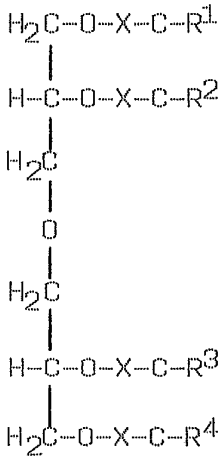
Éster de glicerina, como por exemplo



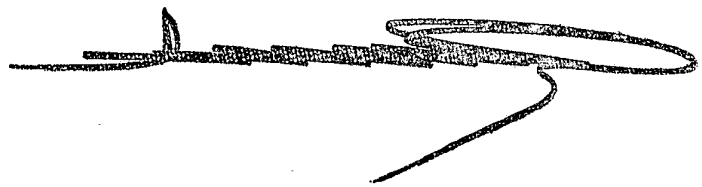
e éteres de poliglicerina,

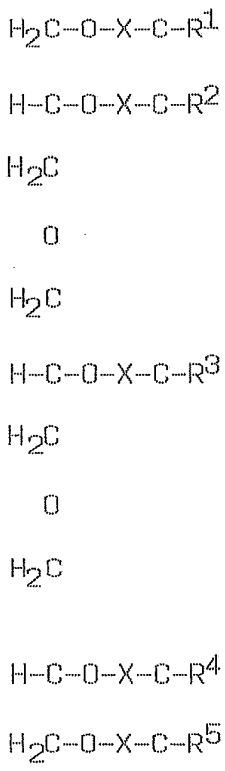
em que R^{1-5} representam H ou um grupo orgânico saturado ou insaturado,

ésteres de poliglicerina, como por exemplo



(éster diglicérico)





em que R^{1-5}, como é conhecido, representam independentemente uns dos outros H, ou um grupo saturado ou insaturado e X representa uma ligação simples ou um grupo carbonilo, bem como metilglucósidos, ésteres de sacarose, alquilpoliglicósidos, ésteres de sorbitano, ésteres de sorbitol e ésteres isosorbídicos. Veja-se a propósito das classes de emulsionantes acima mencionadas a obra "Lexikon der Hilfsstoffe fur pharmazie, Kosmetik und angrenzende Gebiete" (H.P. Fiedler, Editio Cantor Aulendorf, 3ª edição, 1989), as respectivas palavras chave bem como, conforme o caso, as referências paralelas e cruzadas. O significado das palavras chaves desta obra está abrangido nesta patente.

É conveniente escolher representantes das classes de emulsionantes acima mencionadas que contenham principalmente grupos de ácido gordo saturados quando se trata de ésteres, ou que sejam derivados de alccois gordos saturados quando se trata de ésteres; isto significa que, por exemplo, para os éteres de glicerina e ésteres de

poliglicerina acima apresentados como exemplo, quando R^{1-5} não representam hidrogénio, devem representar grupos de hidrocarbonetos saturados. O mesmo se aplica às outras classes de emulsionantes mencionadas.

É particularmente conveniente utilizar emulsionantes hidrófobos que existam no estado sólido à temperatura ambiente.

Os emulsionantes hidrófilos pertencem, de preferência, ao grupo constituido por:

oleato de sorbitano, monoestearato de sorbitano, esteareto-2, monoestearato de glicerina, oleato de glicerina, 4-isoestearato de poliglicerina, óleo de ricino PEG-7-hidrogenado, monoestearato de sorbitano PEG-40, laureto-4.

O ou os emulsionates B podem também escolher-se de entre estas substâncias, devendo apenas ter-se em conta que o ou os emulsionantes B devem possuir as propriedades de solubilidade acima exigidas.

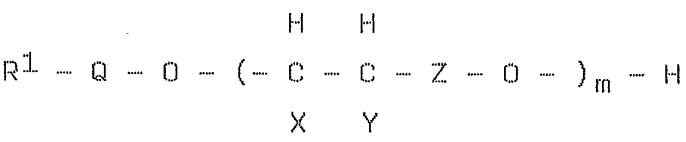
Os emulsionantes hidrófilos B escolhem-se, de prepferencia, de entre o grupo constituido por:

Oleto-20, estearato PEG-40, cocoato de sacarose, trilaureto-4-fosfato, gluceto-20, éter metílico de glucose PPG-20, 3-estearato de poliglicerina, polissorbato-120, laurato de sacarose, cetareto-20.

Uma forma de concretização vantajosa da presente invenção pela qual se obtêm emulsões múltiplas estáveis de acordo com a invenção, consiste em utilizar uma mistura de emulsionantes em que o emulsionante hidrófobo A e o emulsionante hidrófilo B são produtos etoxilados. De acordo

com a invenção uma tal mistura de emulsionantes é constituida por

a) pelo menos um emulsionante de fórmula geral



(emulsionante A)

em que

R^1 = alquilo C_{10-30}

Q = metilo ou carbonilo

X = H ou metilo

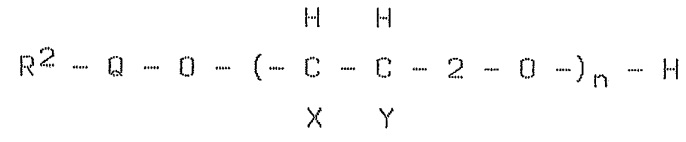
Y = H ou metilo

2 = metileno ou uma ligação simples

m = um número inteiro de 1 a 40,

e

b) pelo menos um emulsionante de fórmula geral



(emulsionante B)

em que

R^2 = alquilo C_{10-30}

Q = metileno ou carbonilo

X = H ou metilo

Y = H ou metilo

Z = metileno ou uma ligação simples

n = um número inteiro de 10 a 400,

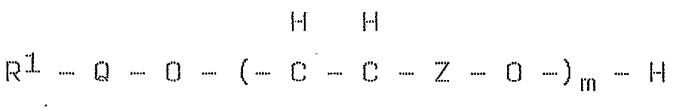
com a condição de que o quociente n/m deve ser pelo menos

de 1,5,

bem como

c) conforme o caso, outros emulsionantes.

Podem escolher-se com vantagem, Ø ou A de entre o grupo dos éteres de alcool gordo de polioxietileno, tendo então de preferência estes emulsionantes a fórmula geral



(emulsionante A)

em que

R^1 = alquilo C_{10-30}

Q = metileno

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

m = um número inteiro de 1 a 20

Preferem-se em especial os emulsionantes A, em que

R^1 = alquilo C_{15-25}

Q = metileno

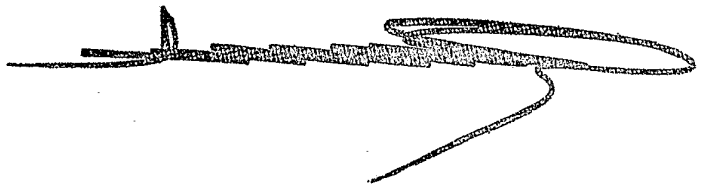
X = H

Y = H

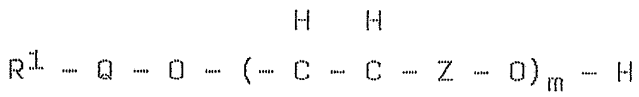
Z = uma ligação simples

m = um número inteiro de 1 a 10.

Podem também escolher-se, com vantagem, o ou os emulsionantes A de entre o grupo dos ésteres de ácido



gordo de polioxietileno, tendo então de preferência estes emusionantes a fórmula geral



(Emulsionante A)

em que

R^1 = alquilo C_{10-30}

Q = carbonilo

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

m = um número inteiro de 1 a 20.

Prefere-se em especial os emulsionantes A, em que

R^1 = alquilo C_{15-25}

Q = carbonilo

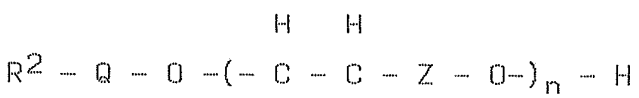
X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

m = um número inteiro de 1 a 10.

De preferência, o ou os emulsionantes B escolhem-se de entre o grupo dos ésteres de alcool gordo de polioxietileno, tendo então de preferência estes emulsionantes a fórmula geral



(emulsionante B)

em que

R^2 = alquilo C_{10-30}

Q = metilo

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

n = um numero inteiro de 10 a 400.

Prefere-se em especial os emulsionantes B, em que

R^2 = alquilo C_{15}-C_{25}

Q = metileno

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

n = um número inteiro de 10 a 400

Podem escolher-se também, com vantagem, o ou os emulsionantes B de entre o grupo dos ésteres de ácido gordo de polioxi-etileno, tendo então de preferência estes emulsionantes a fórmula geral

$$R^2 - Q - O - (- \underset{X}{\overset{H}{C}} - \underset{Y}{\overset{H}{C}} - Z - O-)_n - H$$

(Emulsionante B)

R^2 = alquilo C_{10}-C_{30}

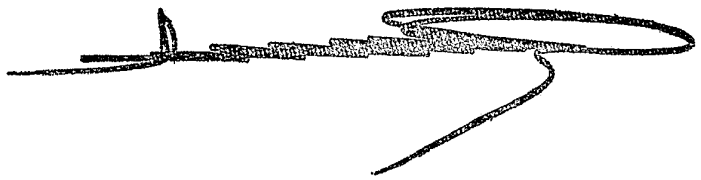
Q = carbonilo

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

n = um número inteiro de 10 a 400



Preferem-se em especial os emulsionantes B, em que

R^2 = alquilo C_{15}-C_{25}

Q = carbonilo

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

n = um número inteiro de 10 a 400

Por vezes, é também contudo vantajoso misturar os emulsionantes A acima descritos, que não sejam produtos etoxilados, com emulsionantes B que sejam produtos etoxilados, desde que obedeçam às propriedades fisicas exigidas aos emulsionantes.

É ainda por vezes vantajoso misturar os emulsionantes B acima descritos, que não sejam produtos etoxilados, com emulsionantes A que sejam produtos etoxilados, desde que obedeçam às propriedades físicas exigidas aos emulsionantes.

Composições adequadas de acordo com a presente invenção são as emulsões múltiplas nas quais os emulsionantes A e/ou os emulsionantes B são do tipo estеareto. Os emulsionantes estеareto encontram-se por exemplo no mercado sob a designação comercial de Brij^R (Atlas-Chemie).

Como particularmente adequado revelou-se o sistema emulsionante estеareto-2 (emulsionante A) e estеareto-21 (emulsionante B).

O estеareto-2 é o alcool POE-(2)-estearílico, isto é um alcool estearilico etoxilado com duas unidades de óxido de etileno.

O estеareto-21 é o alcool POE-(21)-estearílico, isto é, um alcool estearílico etoxilado com 21 unidades de óxido de etileno.

Estão assim no âmbito da invenção as emulsões múltiplas com um teor determinado dos emulsionantes acima referidos e detalhadamente descritos nas reivindicações, bem como os componentes cosméticos ou medicinais e ainda, conforme o caso, outros emulsionantes e/ou aditivos e/ou adjuvantes.

De preferência, a concentração soma do emulsionante A e do emulsionante B situa-se entre 0,5 e 15,0% em relação ao total da preparação cosmética ou medicinal.

As razões molares dos emulsionantes A:B podem ser de 10:1 a 1:10, de preferência de 5:1 a 1:1, em especial de 2:1 a 1:2, em particular de 3:2 a 2:3 e muito preferêncialmente de 1,2:1 a 1:1,2.

Salvo indicação em contrário, sempre que nesta patente se referem composições percentuais, subentende-se que as percentagens são ponderais.

É conveniente utilizar uma mistura de estеareto-2: estеareto-21 na razão de 5:1 a 1:5. A quantidade total adequada deste sistema emulsionante, em relação ao total da composição, é, nesta forma de concretização, de 1 a 10%.

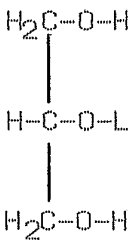
São particularmente vantajosas as formulações que para além dos componentes de acordo com a invenção têm ainda um determinado teor em glicéridos do ácido linoleico (nome trivial para os ésteres de glicerina e ácido linoleico).

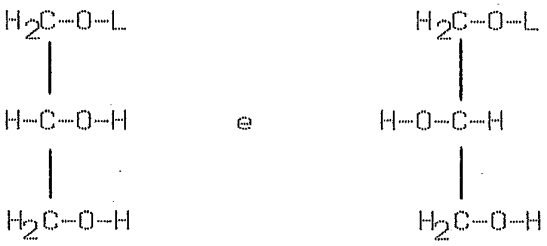
É também conveniente utilizar óleos vegetais com um elevado teor em glicéridos do ácido linoleico.

Em particular, o efeito dos óleos vegetais ou dos glicéridos do ácido linoleico é surpreendentemente o de influenciar vantajosamente a estrutura microscópica das emulsões multiplas de acordo com a invenção, levando a uma diminuição do tamanho das gotículas da amulsão múltipla e a uma maior multiplicidade do sistema.

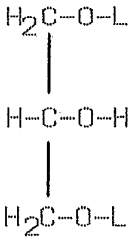
Por glicéridos do ácido linileico, que seguidamente se representam pelas suas projecções de Fischer, entendem-se:

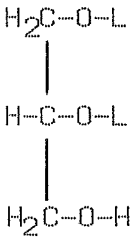
os mono-ésteres de glicerina e ácido linoleico (o mono-éster 1 de glicerina e ácido linoleico tem dois isómeros ópticos):



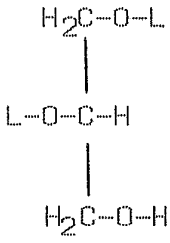


Os di-ésteres de glicerina e ácido linoleico (o do-éster 1,2 de glicerina e ácido linoleico tem dois isómeros ópticos):

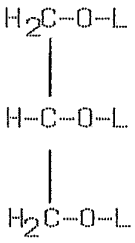




e



e os tri-ésteres de glicerina e ácido linoleico:



em que L representa o grupo cis-cis-9,12-octadecadienoilo.

Não tem qualquer importância o facto de nos óleos utilizados os glicéridos do ácido linoleico existirem em qualquer estaqueometria e isometria como substância isomeria como substâncias isoladas ou em qualquer mistura destas entre si.

Os vegetais podem escolher-se, de preferência, de entre o grupo constituido por: óleo de gérmen

de trigo, óleo de grainha de uva, óleo de coco, e outros óleos que contenham pelo menos 5% em peso de glicéridos do ácido linoleico.

Enquanto que o diametro das gotículas das emulsões múltiplas sem adição destes óleos é tipicamente de 20 µm, este valor pode descer até 5-10 µm com a adição de um desses óleos.

Ao mesmo tempo, os óleos vegetais ou os glicéridos do ácido linoleico aumentam o rendimento em gotículas das emulsões múltiplas.

De acordo com a invenção, as emulsões múltiplas podem conter de 0,5 a 50% em peso de óleos vegetais, sendo convenientes teores de 1,0 a 10,0% em peso destes óleos.

As formulações de acordo com a invenção podem apresentar ainda um teor em ácido esteárico e/ou hidroxiestearato de hidroxioctanosilo, caso se deseje. Surpreendentemente, uma adição destas substâncias aumenta a estabilidade térmica das emulsões multiplas de acordo com a invenção. Utilizam-se de preferência teores de 0,1 a 10% em peso de ácido esteárico e/oude hidroxiestearato de hidroxioctanosilo nas formulações de acordo com a invenção. São particularmente vantajosas razões ponderais de ácido esteárico e/ou hidroxiestearato de hidroxioctanosilo de 10:1 a 1:10.

É particularmente conveniente utilizar simultaneamente óleos vegetais e ácido esteárico e/ou hidroxiestearato de hidroxioctanosilo nas formulações de acordo com a invenção.



As emulsões múltiplas de acordo com a invenção podem preparar-se por processos em si conhecidos, tanto processos de gotejamento simples ou de gotejamento duplo, a partir das matérias primas. Verificou-se contudo, e aí reside uma das formas de concretização mais convenientes da presente invenção, que se obtêm particularmente emulsões multiplas de estrutura fina e muito estáveis quando não se adiciona, como usualmente, a quantidade total dos emulsionantes à fase oleosa juntando-se em seguida à fase aquosa. Em vez disso coloca-se o ou os emulsionantes hidrófilos (emulsionante B) na fase aquosa e o ou os emulsionantes hidrófobos (emulsionante B) na fase oleosa. Reunem-se então as duas fases, de preferência a uma temperatura à qual a fase oleosa ainda é claramente líquida. Este processo é um processo de gotejamento simples.

É também um objectivo da invenção um processo para a preparação de emulsões multiplas estáveis, caracterizado por se adicionar o emulsionante hidrófilo à fase aquosa e o emulsionante hidrofobo à fase oleosa e se misturarem depois as duas fases entre si, de preferência a uma temperatura à qual a fase oleosa se encontra claramente no estado líquido.

Aditivos e adjuvantes convenientes são por exemplo agentes que conferem consistência, agentes excipientes, perfumes, corantes, emulsionantes, outros ingredientes activos como vitaminas ou proteínas, agentes protectores da luz, estabilizadores, antioxidantes, conservantes, repelentes de insectos, alcool, água, sais, substâncias activas proteoliticas ou queratoliticas, etc.

Podem aplicar-se com vantagem as emulsões múltiplas de acordo com a invençãi em produtos de tratamento cosmético como por exemplo cremes de rosto, mãos ou corpo ou loções para os mesmos fins, formulações anti-solares, cremes

hidratantes, cremes de massagem, produtos de protecção para unhas e semelhantes.

Os exemplos seguintes destinam-se a ilustrar em pormenor a presente invenção sem contudo a limitarem. Além disso é evidente para o especialista que a invenção pode variar-se nas suas formas de execução sem contudo sair dos seus fundamentos.

EXEMPLO 1

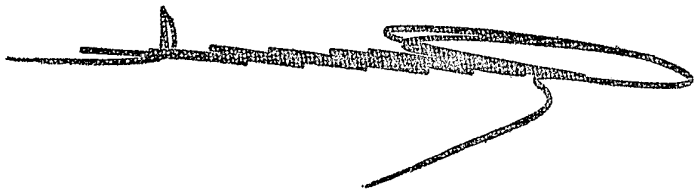
CREME DE MASSAGEM I

Estearato - 2	3,00%
Estearato - 21	3,00%
Petrolato DAB 9	4,20%
Óleo de parafina DAB 9	3,00%
Esqualato	3,00%
Palmitato de isopropilo	1,80%
Copolimero de acrilamina/ /acrilato de sódio	0,18%
Água VES	até 100,00%

EXEMPLO 2

CREME DE MASSAGEM 2

Estearato - 2	5,00%
Estearato - 21	3,00%
Petrolato DAB 9	1,50%
Óleo de parafina DAB 9	6,00%
Palmitato de isopropilo	3,00%
Benzolato de alcoois C_{12-15}	1,50%
Alcool cetearílico	1,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo	0,40%
$MgSO_4$	0,60%



Ciclometicona 2,50%
Conservante.....0,50%
Água VES até 100,00%

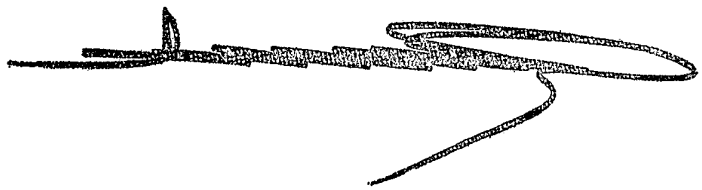
EXEMPLO 3
CREME DE MÃOS

Estearato - 2.....4,50%
Estearato - 21.....1,50%
Petrolato DAB 9.....4,20%
Óleo de parafina DAB 9.....3,00%
Esqualato.....3,00%
Palmitato de isopropilo.....1,80%
Copolimero de acrilamina/
/acrilato de sódio.....0,18%
Água VES.....até 100,00%

EXEMPLO 4
CREME SOLAR

Estearato - 2.....4,50%
Estearato - 21.....1,50%
Petrolato DAB 9.....4,20%
Óleo de parafina DAB 9.....3,00%
Esqualato.....3,00%
Palmitato de isopropilo.....1,80%
Copolimero de acrilamina/
/acrilato de sódio.....0,18%
Ensolex 6300 .....2,00%
Água VES.....até 100,00%

EXEMPLO 5
CREME HIDRATANTE I



Oleato de sorbitano.....5,00%
Oleto - 20 .....3,00%
Petrolato DAB 9 .....4,20%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo 2,50%
Alcool cetearílico 1,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo 0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Água VES .....até 100,00%

EXEMPLO 6

CREME HIDRATANTE II

Monoestearato de sorbitano 5,00%
Estearato PEG - 40 .....3,00%
Petrolato DAB 9 .....4,20%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo 2,50%
Alcool cetearílico 1,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo 0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Óleo vegetal 4,00%
Água VES .....até 100,00%

EXEMPLO 7

CREME HIDRATANTE III

Estearato - 2.....5,00%
Cocoata de sacarose 3,00%
Petrolato DAB 9 .....4,20%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo 2,50%

Álcool cetearílico 1,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo 0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Óleo de grainha de uva 4,50%
Água VES .....até 100,00%

EXEMPLO 8

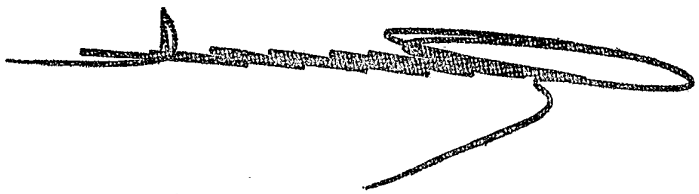
CREME HIDRATANTE IV

Monoestearato de glicerina.....5,00%
Cocoato de sacarose 3,00%
Petrolatto DAB 9 .....4,20%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo.....2,50%
Álcool cetearílico 1,00%
Hidroxi estearato de hidroxioctanosilo 0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Óleo de coco 6,00%
Águas VES .....até 100,00%

EXEMPLO 9

CREME HIDRATANTE V

Oleto de glicerilo 5,00%
4-fosfato de trilaureto 3,00%
Petrolato DAB 9 .....4,20%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo 2,50%
Álcool cetearílico 1,00%
Hidroxiesttearato de hidroxioctanosilo 0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%



Óleo de gérmen de trigo 7,00%
Água VES.....até 100,00%

EXEMPLO 10

CREME HIDRATANTE VI

4-isoestearato de poliglicerina 5,00%
Gluceto-20 .....3,00%
Petrolato DAB 9 .....4,20%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo 2,50%
Alcool cetearílico.....1,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo.....0,80%
$MgSO_4$.....0,60%
Ciclometicona 2,50%
Óleo de germen de trigo 4,50%
Ácido esteárico 3,00%
Água VES .....até 100,00%

EXEMPLO 11

CREME HIDRATANTE VII

Óleo de ricino PEG-7 hidrogenado 5,00%
Éter metilglucósido de PEG-20 .....3,00%
Petrolato DAB 9 .....4,20%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo 2,50%
Alcool cetearílico 1,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo.....0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Óleo de coco 5,30%
Ácido esteárico 3,00%
Água VES .....até 100,00%

EXEMPLO 12

CREME HIDRATANTE VIII

Monoestearato de sorbitano PEG-40 .....5,00%
3-estearato de poliglicerina 3,00%
Petrolato DAB 9 .....4,20%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo 2,50%
Alcool cetearílico.....1,00%
Hidroxiestearato de hidroxiioctanosilo.....0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Óleo de grainha de uva 4,80%
Ácido esteárico 3,80%
Água VES ..... até 100,00%

EXEMPLO 13

CREME PROTECTOR PARA AS MÃOS

Laureto-4.....5,00%
Polisorbato-120 .....3,00%
Estearato PEG-40 .....2,00%
Petrolato DAB 9 .....1,50%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo 3,00%
Benzoato de alcoois C_{12-15}.....1,50%
Alcool cetearílico 1,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo 0,40%
$MgSO_4$.....0,60%
Ciclometicona 2,50%
Água VES .....até 100,00%



EXEMPLO 14

LOÇÃO CORPORAL

Oleato de glicerilo 2,50%
Laurato de sacarose 1,00%
Estearato PEG-40 .....0,75%
Petrolato DAB 9 .....1,50%
Óleo de paarafina DAB 9 .....6,00%
Palmitato de isopropilo 3,00%
Benzoato de alcoois C_{12-15} 1,50%
Alcoool cetearílico 1,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosiilo 0,40%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Água VES .....até 100,00%

EXEMPLO 15

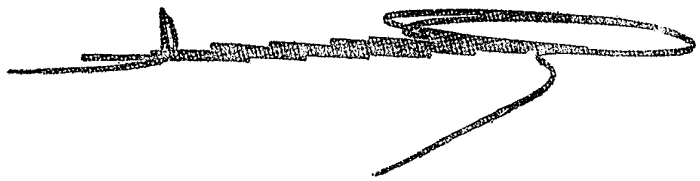
EMULSÃO PARA TRATAMENTO DAS MÃOS E DAS UNHAS

Laureto-4 .....5,00%
Ceteareto-20 .....3,00%
Petrolato DAB 9 .....4,20%
Óleo de parafina DAB 9 .....6,90%
Éter estearílico PPG-15 .....4,00%
Ciclometicona 2,50%
Conservante 0,50%
Água VES .....até 100,00%

EXEMPLO 16

LOÇÃO HIDRATANTE

Laureto-4 .....5,00%
Cetearato-20 .....3,00%
Petrolato DAB 9 .....2,20%



Esqualano 4,00%
Palmitato de isopropil.....2,50%
Cocoato de etil-hexilo 4,00%
Alcool cetearílico 1,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo 0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Conservante 0,50%
Água VES .....até 100,00%

EXEMPLO 17

CREME PARA OLHOS

Estearato-2 .....3,75%
Estearato-21 .....2,25%
Petrolato DAB 9 .....1,20%
Esqualano 4,00%
Cocoato de etil-hexilo 4,00%
Alcool cetearílico 0,50%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo 0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Conservante 0,50%
Água VES.....até 100,00%

EXEMPLO 18

LOÇÃO HIDRATANTE

Estearato-2 .....3,75%
Estearato-21 .....2,25%
Petrolato DAB 9 .....1,20%
Esqualano 4,00%
Cocoato de etil-hexilo 4,00%
Alcool cetearílico 0,50%

Manteiga de cacau 4,00%
Hidroxiestearato de hidroxioctanosilo 0,80%
$MgSO_4$ 0,60%
Ciclometicona 2,50%
Conservante 0,50%
Água VES.....até 100,00%

REIVINDICAÇÕES

- 1ª -

Emulsões múltiplas estáveis,contendo uma mistura de emulsionantes constituida por:

- um primeiro emulsionante hidrofóbo (emulsionante A) ou mais emulsionantes deste tipo em mistura, com as seguintes propriedades:

- deve ser muito soluvel na fase oleosa da emulsão à temperatura de preparação da emulsão,

- não deve ser isotropicamente solúvel em água abaixo de cerca de 50°C,

- deve ser isotropicamente solúvel em água no intervalo de temperaturas entre cerca de 50°C e a temperatura de preparação de emulsão,

- deve actuar, no intervalo de temperaturas entre cerca de 50°C e a temperatura de preparação da emulsão, como emulsionante primário W/O,

- e um segundo emulsionante hidrófilo (emulsionante B) ou mais emulsionantes deste tipo em mistura, com as seguintes propriedades:

- deve ser isotropicamente solúvel em água,

- deve apresentar uma solubilidade razoavelmente estável no intervalo de temperaturas entre cerca de 50°C e a temperatura de preparação da emulsão.

- 2ª -

Emulsões múltiplas estáveis, de acordo com a Reivindicação 1, nas quais o ou os emulsionantes A são solúveis num óleo não polar, acima de 0,01% em peso, de preferência acima de 5,0% em peso, quando se usa um óleo não polar, ou nas quais o ou os emulsionantes A são solúveis num óleo polar, acima de 0,02% em peso, de preferência acima de 20,0% em peso, quando se utiliza um óleo polar.

- 3ª -

Emulsões multiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, nas quais o ou os emulsionantes hidrofobos A pertecem ao grupo de substâncias constituido por:

éteres glicerinicos, éterespoliglicerinicos, metilglucósidos, ésteres de sacarose, alquilpoliglicósidos, ésteres de sorbitano, ésteres de sorbitos e ésteres isosorbidicos.

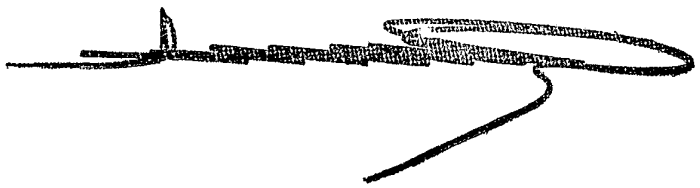
- 4ª -

Emulsões múltiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, nas quais o ou os emulsionantes hidrófilos B pertencem ao grupo de substâncias constituido por:

éteres glicerinicos, éteres poliglicerinicos, éteres poliglicerinicos, metilglucósidos, ésteres de sacarose, alquilpoliglicósidos, ésteres de sorbitano, ésteres de sorbitol e ésteres isosorbidicos.

- 5ª -

Emulsões múltiplas estáveis de acordo com a reivindicação 1, nas quais o ou os emulsionantes hidrofobos A pertencem ao grupo de substâncias constituido por:



oleato de sorbitano, monoestearato de sorbitano, estearet-2, monoestearato de glicerina, oleato de glicerilo, 4-isoestearato de poliglicerina, óleo de ricino PEG-7-hidrogenado, monoestearato de sorbitano PEG-40-sorbitano, laureto-4.

e os emulsionates hidrófilos B pertencem ao grupo de substâncias constituido por:

Oleto-20, estearato PEG-40, cocoato de sacarose, trilaureto-4-fosfato, gluceto-20, metilglucose-éster PPG-20, poliglicerina-3-estearato, polissorbato-120, laurato de sacarose, cetearet-20.

- 6ª -

Emulsões multiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, contendo

a) pelo menos um emulsionante hidrófobo, de fórmula geral

$$R^1 - Q - O - \left(- \underset{X}{\overset{H}{C}} - \underset{Y}{\overset{H}{C}} - Z - O - \right)_m - H$$

(emulsionante A)

em que

R^1 = alquilo C_{10}-C_{30}

Q = metilo ou carbonilo

X = H ou metilo

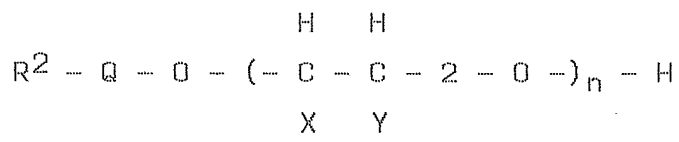
Y = H ou metilo

2 = metileno ou uma ligação simples

m = um número inteiro de 1 a 40,

e

b) pelo menos um emulsionante hidrofilo, de fórmula geral



(emulsionante B)

em que

R^2 = alquilo C_{10}–C_{30}

Q = metileno ou carbonilo

X = H ou metilo

Y = H ou metilo

Z = metileno ou uma ligação simples

n = um número inteiro de 10 a 400,

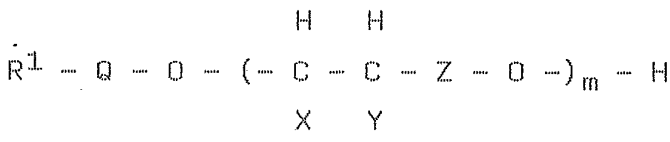
com a condição de que o quociente n/m ser pelo menos de 1,5, e ainda

c) eventualmente outros outros emulsionantes.

- 7ª -

Emulsões múltiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas por o ou os emulsionantes A pertencerem ao grupo constituido por:

éteres de alcoois gordos de polioxietileno, em especial os de fórmula geral



(emulsionante A)

em que

R^1 = alquilo C_{15}–C_{25}

Q = metileno

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

m = um número inteiro de 1 a 10

- 8ª -

Emulsões múltiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas por o ou os emulsionantes B pertencerem ao grupo constituido por:

éteres de alcoois gordos de polioxietileno, em especial os de fórmula geral

$$R^2 - Q - O - \left(- \underset{X}{\overset{H}{C}} - \underset{Y}{\overset{H}{C}} - Z - O-\right)_n - H$$

(Emulsionante B)

R^2 = alquilo C_{15}-C_{25}

Q = metileno

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

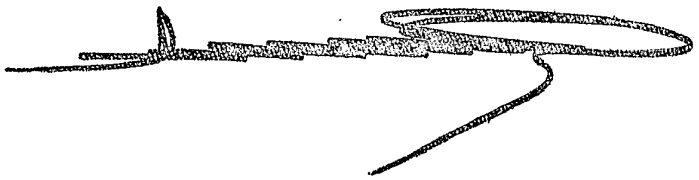
n = um número inteiro de 10 a 400

- 9ª -

Emulsões múltiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas por o ou os emulsionantes A pertencerem ao grupo dos ésteres de ácido gordo de polioxietileno, em especial os de fórmula geral

$$R^1 - Q - O - \left(- \underset{X}{\overset{H}{C}} - \underset{Y}{\overset{H}{C}} - Z - O-\right)_m - H$$

(Emulsionante A)



R^1 = alquilo C_{15}-C_{25}

Q = carbonilo

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

m = um número inteiro de 1 a 10

- 10ª -

Emulsões múltiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas por o ou os emulsionantes B pertencerem ao grupo dos ésteres de ácido gordo de polioxietileno, em especial os de fórmula geral

$$R^2 - Q - O - (- \underset{X}{\overset{H}{C}} - \underset{Y}{\overset{H}{C}} - Z - O -)_n - H$$

(emulsionante B)

em que

R^2 = alquilo C_{15}-C_{25}

Q = carbonilo

X = H

Y = H

Z = uma ligação simples

n = um numero inteiro de 10 a 400.

- 11ª -

Emulsões multiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas por a soma das concentrações dos emulsionantes A e B se situar entre 0,5 e 15,0% do total da composição cosmética ou medicamentosa e por as razões molares de emulsionantes A:emulsionante B serem de 10:1 a 1:10, em especial de 5:1 a 1:5, em particular de 2:1 a 1:2 e muito preferencialmente de 1,2:1 a 1:1,2.



- 12ª -

Emulsões multiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas por se empregar como emulsionante A estearato 2 e como emulsionante B estearato 21, sendo a razão emulsionante A: emulsionante B de 5:1 a 1:5 e a quatidade total do sistema emulsionante ser de 1 a 10% da composição total da preparação.

- 13ª -

Emulsões multiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas por um teor em óleos vegetais com elevada percentagem em glicéridos de ácido linoleico, em especial óleo de gérmen de trigo, óleo de grainhas de uva, óleos de côco e outros óleos, que tenha pelo menos 5% em peso de glicéridos de ácido linoleico, sendo as emulsões constituidas de preferência por 0,1 a 0,5% em peso dos referidos óleos ou misturas destes, em relação ao peso total da preparação.

- 14ª -

Emulsões múltiplas estáveis, de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas por um teor em ácido esteárico e/ou hidroxiestearato de hidroxioctacosanilo de 0,1 a 10% em peso, em especial com razões ponderais de ácido esteárico e/ou hidroxiestearato de hidroxioctacozanilo de 10:1 a 1:10.

- 15ª -

Processo para a preparação de emulsões múltiplas estáveis, de acordo com qualquer das reivindicações 1 a 14, caracterizado por se incorporar o ou os emulsionantes hidrófilos (emulsionante B) na fase aquosa e ou os emulsionantes hidrofovos (emulsionante A) na fase oleosa, e se reunirem e misturarem depois as duas fases.

A requerente reivindica as prioridades dos pedidos alemães apresentados em 13 de Abril de 1991 sob o número P 41 12 127.9 e em 24 de Setembro de 1991 sob o número P 41 31 678.9.

Lisboa, 10 de Abril de 1992
O AGENTE OFICIAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL



R E S U M O

"EMULSÕES MULTIPLAS ESTÁVEIS"

Emulsões múltiplas estáveis,contendo uma mistura de emulsionantes constituida por:

- um primeiro emulsionante hidrofóbo (emulsionante A) ou mais emulsionantes deste tipo em mistura, com as seguintes propriedades:

- deve ser muito soluvel na fase oleosa da emulsão à temperatura de preparação da emulsão,

- não deve ser isotropicamente solúvel em água abaixo de cerca de 50°C,

- deve ser isotropicamente solúvel em água no intervalo de temperaturas entre cerca de 50°C e a temperatura de preparação de emulsão,

- deve actuar, no intervalo de temperaturas entre cerca de 50°C e a temperatura de preparação da emulsão, como emulsionante primário W/O,

- e um segundo emulsionante hidrófilo (emulsionante B) ou mais emulsionantes deste tipo em mistura, com as seguintes propriedades:

- deve ser isotropicamente solúvel em água,

- deve apresentar uma solubilidade razoavelmente estável no intervalo de temperaturas entre cerca de 50°C e a temperatura de preparação da emulsão.

- As emulsões multiplas estáveis, de acordo com a presente invenção, têm aplicação em composições farmacêuticas para aplicação tópica ou em formulações cósméticas.