



(19)
Bundesrepublik Deutschland
Deutsches Patent- und Markenamt

(10) **DE 10 2005 017 147 A1** 2006.10.26

(12)

Offenlegungsschrift

(21) Aktenzeichen: **10 2005 017 147.8**

(22) Anmeldetag: **13.04.2005**

(43) Offenlegungstag: **26.10.2006**

(51) Int Cl.⁸: **A61K 8/97** (2006.01)

A61Q 17/00 (2006.01)

A61Q 19/00 (2006.01)

(71) Anmelder:

Apfelbaum, Udo, Berneck, CH

(72) Erfinder:

gleich Anmelder

(74) Vertreter:

Pfortner, P., Dr., Rechtsanw., 80469 München

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

(54) Bezeichnung: **Topische Zubereitung in zwei Komponenten gegen die Faltenbildung der Haut**

(57) Zusammenfassung: Der Gegenstand der Erfindung ist eine Kombination zweier aufeinander abgestimmter topischer Zubereitungen, die zeitlich versetzt angewendet werden. Die Kombination ist dadurch gekennzeichnet, dass in der zeitlich nachfolgend angewandten Zubereitung solche Wirkstoffe enthalten sind, die die Aufnahmefähigkeit der Haut für andere Substanzen herabsetzen können und so eine Wirkung dieser Substanzen in der Haut verhindern.

Beschreibung

[0001] Zur Bereitstellung eines Mittels zur Verminderung von Faltenbildung der Haut, das äußerlich, örtlich und einfach für den Benutzer anwendbar ist, wird erfindungsgemäß eine Kombination aus zwei aufeinander abgestimmter topischer Zubereitungen vorgeschlagen.

Stand der Technik

[0002] Es ist eine Vielzahl an kosmetischen Produkten auf dem Markt erhältlich, welche die Alterung der Haut und die Faltenbildung verlangsamen sollen. Solche Produkte basieren entweder auf Mittel zur Aufrechterhaltung der Hautfeuchtigkeit, zur Förderung der Zellerneuerung oder zur Anregung der Synthese von Kollagen, aus dem das Hautgewebe aufgebaut ist. Diese Wirkstoffe können ihre Wirksamkeit dann optimal erreichen, wenn die Penetration der Wirkstoffe in möglichst tiefe Hautschichten gewährleistet ist. Als Beispiele wären hier Panthenol, Vitamin A und Vitamin E zu nennen.

[0003] Eine andere Gruppe von Wirkstoffen erreicht Ihre Wirksamkeit durch den Verbleib der Wirkstoffe in Form eines Filmes an der Hautoberfläche bzw. durch das unmittelbare Einwirken auf die oberflächliche Hautschicht. Als Beispiele sind hier Hyaluronsäure, Proteinhydrolysate oder Silikonöle sowie Tannine zu nennen. Tannine bewirken topisch angewendet eine Senkung der Permeabilität der Hautkapillaren. Durch diese adstringierende Wirkung ziehen sich die Hautkapillaren zusammen, so dass es zu einer Steigerung der Spannkraft der Haut und damit zu einer positiven Wirkung auf Hautfältchen kommt. Die daraus resultierende verminderte Durchblutung (Gerbung) der Haut vermindert dann aber die Aufnahme von Wirkstoffe über die Haut. Die vorliegende Anmeldung offenbart eine Lösung für die dieses bedeutende praktische Problem.

[0004] Gegenstand der vorliegenden Anmeldung ist die Aufteilung der Wirkstoffe in zwei kosmetische Zubereitungen und deren aufeinander abgestimmte Verwendung. Nach Kenntnis der Anmelderin wurde die getrennte Verwendung von Stoffen, die die Aufnahmefähigkeit der Haut herabsetzten, insbesondere Tanninen, nachfolgend zu einer Anwendung einer Zubereitung mit Substanzen, deren Wirkung sich in den unteren Hautschichten entfaltet, bisher nicht beschrieben.

Aufgabenstellung

[0005] Die mit der Erfindung erzielten Vorteil liegt darin, dass durch die Aufteilung der Wirkstoffe in die verschiedenen Komponenten verhindert wird, dass einzelne Bestandteile einer Zubereitung die Wirksamkeit andere Bestandteile verringert.

[0006] Die Zusammensetzungen der topischen Zubereitungen können in allen bekannten galenischen Formen vorliegen, beispielsweise in Form einer Emulsion und insbesondere als Öl-in-Wasser-Emulsion oder Wasser-in-Öl-Emulsion oder in Form einer multiplen Emulsion.

[0007] Sie können außerdem als wässrige Lösungen, die gegebenenfalls in ein Gel übergeführt werden, oder in Form von Lotionen, beispielsweise zweiphasigen Lotionen, Cremes, Milch oder sogar als Schäume vorliegen.

[0008] Die erfindungsgemäß verwendeten Zusammensetzungen können eine Ölphase auf der Basis eines tierischen Öls, eines pflanzlichen Öls, eines Mineralöls, eines Siliconöls, eines fluorierten Öls und/oder eines synthetischen Öls enthalten.

[0009] Die Ölphase kann außerdem Fettalkohole oder Fettsäuren sowie grenzflächenaktive Stoffe enthalten.

[0010] Es können insbesondere die Kohlenwasserstofföle wie Paraffinöl oder Vaselineöl; Perhydrosequalen; Süßmandelöl, Calophyllumöl, Palmöl, Ricinusöl, Avocadoöl, Jojobaöl, Olivenöl und Getreidekeimöl; Alkohole wie Oleylalkohol, Linoleylalkohol, Linolenylalkohol, Isostearylalkohol oder Octyldodecanol angegeben werden. Es sind ferner die Siliconöle zu nennen, beispielsweise PDMS, die gegebenenfalls phenylgruppenhaltig sind, wie die Phenyltrimethicone.

[0011] Die Ölphase kann außerdem ein Öl zum Abschminken enthalten, beispielsweise einen Ester von Fettsäuren, insbesondere die Ester, die aus einem geradkettigen oder verzweigten Alkohol mit 1 bis 17 Kohlenstoffatomen und einer geradkettigen oder verzweigten Fettsäure mit 3 bis 18 Kohlenstoffatomen gebildet werden.

[0012] Ein solcher Ester kann insbesondere unter Dioctyladipat, 2-Ethylhexylpalmitat, Diisopropyladipat, 2-Ethylhexylhexanoat, Ethyllaurat, Methylmyristat, Octyldodecyloctanoat, Isodecylneopentanoat, Ethylmyristat, Myristylpropionat, 2-Ethylhexyl-2-ethylhexanoat, 2-Ethylhexyloctanoat, 2-Ethylhexylcaprat/caprylat, Methylpalmitat, Butylmyristat, Isobutylmyristat, Ethylpalmitat, Isohexyllaurat, Hexyllaurat und Isopropylisostearat ausgewählt werden.

[0013] Die Ölphase kann im Falle einer Emulsion in einer Menge von 5 bis 95 Gew.% enthalten sein. Die erfindungsgemäß verwendete Zusammensetzung kann außerdem enthalten:

- einen Stoff, mit dem die Fettphase suspendiert werden kann, beispielsweise ein Copolymer von C10-30 Alkylacrylaten und Acrylsäure oder Methacrylsäure oder deren Estern (Pemulen TR1, Pemulen TR2, Carbopol 1342 von GOODRICH), oder ein AcrylamidfMethylpropan-sulfonsäure-Copolymer (Sepigel von SEPIC); und/oder
- einen Stoff, mit dem die Fettphase dispergiert werden kann, beispielsweise ein Emulgatorsystem oder Vesikelsystem auf der Basis von Vesikeln, die gegebenenfalls eine Größe im Nanometerbereich besitzen und die aus ionischen Lipiden (Liposomen) oder nichtionischen Lipiden bestehen, und insbesondere die dem Fachmann wohlbekannten Emulgatorsysteme, die aus Glycerylstearat/PEG-100-Stearat (CTFA), Cetylalkohol und Stearylalkohol bestehen.

[0014] Die erfindungsgemäß verwendeten Zusammensetzungen können außerdem ein Mittel enthalten, mit dem die Viskosität der Zusammensetzung modifiziert wird und mit dem eine Textur erhalten wird, die mehr oder weniger einem Gel entspricht, wie beispielsweise:

- Cellulosederivate (Carboxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose);
- natürliche Gummen, wie Xanthangummi, Guargummi, Johannisbrotkernmehl, Skleroglucane, Chitin- oder Chitosanderivate, Carrageenane;
- Polycarboxyvinyllderivate vom Carbomer-Typ (von GOODRICH unter den Bezeichnungen Carbopol 940, 951, 980 oder von 3V SIGMA unter den Bezeichnungen Synthalen K oder Synthalen L im Handel erhältlich).

[0015] Die erfindungsgemäß verwendeten Zusammensetzungen können in bekannter Weise auch auf dem betreffenden Gebiet üblicherweise verwendete Zusatzstoffe enthalten, beispielsweise Konservierungsmittel, Antioxidantien, Parfums, Füllstoffe, wie z. B. Kaolin oder Stärke, sogar Mikrohohlkugeln, Pigmente, UV-Filter, Maskierungsmittel, etherische Öle, Farbmittel, hydrophile Wirkstoffe oder lipophile Wirkstoffe, beispielsweise Hydratisierungsmittel, insbesondere Glycerin, Butylenglykol, entzündungshemmende Wirkstoffe wie Allantoin, Bisabolol, Radikalfänger für freie Radikale, wie Vitamin E oder seine Derivate, beruhigende Mittel, wie Kornblumenwasser, Irisextrakt, Depigmentierungsmittel, biologische Wirkstoffe, beispielsweise Harnstoff, Aminosäuren, Vitamine und ihre Derivate, Proteine, Salicylsäure und ihre Derivate, α -Hydroxysäuren, Pyrrolidoncarbonsäure und ihre Salze, Ceramide.

[0016] Der Fachmann wird selbstverständlich die gegebenenfalls vorliegende(n) Verbindung(en) und/oder ihre Mengenanteile so auswählen, dass die vorteilhaften Eigenschaften der erfindungsgemäßen Zusammensetzung durch den beabsichtigten Zusatz nicht oder nicht wesentlich beeinträchtigt werden. Insbesondere werden die Wirkstoffe nach ihrem Funktionsprinzip dergestalt auf die beiden Komponenten der Erfindung verteilt, dass die Applikation von Wirkstoffen mit Wirkung in tieferen Hautschichten vor der Applikation der Zutaten mit einer Erhöhung der Barrierefunktion der Haut erfolgt.

[0017] Die verwendeten Zusammensetzungen weisen vorteilhaft einen pH-Wert auf, der für die Haut nicht nachteilig ist und der im Allgemeinen bei 5 bis 8 und vorzugsweise im Bereich von 5,5 bis 7,5 liegt.

[0018] Die erfindungsgemäß verwendeten Zusammensetzungen können natürlich Zusammensetzungen sein, die für eine kosmetische oder pharmazeutische Verwendung und insbesondere eine dermatologische Verwendung vorgesehen sind.

[0019] Für die zu erst anzuwendende Komponenten mit den Wirkstoffen, die in tieferen Hautschichten wirken, wurde eine Zusammensetzung aus Sojabohnenextrakt, Extrakt aus *Pyrus malus* (Wildapfel) und weißer Tee Extrakt gewählt. Die Eigenschaften dieser vorbekannten Zutaten sein im Folgenden kurz beschrieben: Der Sojabohnenextrakt ist maßgeblich für die Reduktion der Falten verantwortlich. Dabei aktiviert der Sojabohnenextrakt die metabolische Aktivität der Fibroblasten und fördert die Bildung der für die Elastizität der Haut verantwortlichen Strukturproteine Collagen I und Collagen III. In Folge steigt die Widerstandskraft, Elastizität und Dichte der Haut.

[0020] Die Zubereitung aus der Sojabohne ist ein Extrakt biochemischer Wirkprinzipien, gewonnen aus Sojabohnen, der den Abbau der extrazellulären Matrix verhindert und die Synthese von Proteoglycanen und Elastinen (Eiweiß-Zuckermakromoleküle, die als Struktur gebende Komponente zwischen den Fibroblasten als Gelstruktur die eingelagerten Kollagenfasern stabilisiert und damit die Elastizität der Haut fördert) fördert.

[0021] Beim Weißtee Extrakt handelt es sich um die mit gespanntem Kohlendioxid schonend extrahierten Wirkstoffen aus Teeblättern. Die Besonderheit des Weißteeextraktes besteht darin, dass nur die jüngsten Blättern aus der Sprossregion von Teesträuchern eingesetzt werden. Dieser Extrakt zeichnet sich durch einen extrem hohen Gehalt an wertvollen Polyphenolen aus, die ihrerseits die Entschlackung fördern, aus (Ablagerungen zwischen den Kollagenfasern, die den Stoffwechsel der Fibroblasten beeinflussen und die Kontraktibilität der Kollagenfasern behindern, sowie Entschlackung tieferer Hautregionen). Zudem werden die Zellen der Haut vor freien Radikalen und oxydativen Noxen geschützt, was zur Vitalisierung der Haut beiträgt.

[0022] Additiv zum Weißteeextrakt wirkt ein weiterer Extrakt, gewonnen aus den Schalen von Wildäpfeln mit den Wirkprinzipien der Chalcone und Flavonen. Diese Substanzen verhindern die Oxydation der Proteine, schützen die DNA vor oxydativem Abbau und reduzieren damit die Gefahren der Mutation. Die Zellmembranen werden ebenfalls vor oxydativen Gefahren geschützt.

[0023] Zum Verständnis des Wirkprinzips: Die äußere Erscheinung der Haut hängt von der Organisation und Struktur der unterschiedlichen Hautschichten ab. Durch Hautalterung wird diese dünner, trockener, weicher und ist weniger elastisch.

[0024] Diese Änderungen sind zurückzuführen auf eine Veränderung der makromolekularen Struktur der Dermis (Epidermis = oberste Hautschicht, Dermis = lebende Schicht mit Fibroblasten, die an Kollagenfasern gebunden sind und in einem „Gel“ aus Proteoglykanen und Elastin eingebettet sind), verbunden mit Schlackenbildung in tieferen Hautschichten und einer Reduktion von Kollagen und Proteoglykanen. Sojaextrakt verhindert den Abbau der extrazellulären Matrix und begünstigt die Synthese von Proteoglykanen. Die Bildung der beiden wichtigen Strukturproteine Kollagen I und III wird gefördert.

[0025] Weißtee fördert die Entschlackung und ist als wirksamer Radikalfänger aktiv. Der Wildapfelextrakt unterstützt die antioxidative Wirkung.

[0026] Die Anmelderin hat in überraschender Weise festgestellt, dass durch eine Kombination von Sojaextrakt, Weißteeextrakt und Wildapfelextrakt in topischen Zubereitungen ein überraschender Synergieeffekt der bekannten Wirkungen auftrat.

[0027] Nach Kenntnis der Anmelderin wurde die gemeinsame Verwendung von Sojaextrakt, Weißteeextrakt und Wildapfelextrakt im Stand der Technik bisher noch nicht beschrieben.

[0028] Der Anteil an Sojaextrakt in der topischen Zubereitung liegt zwischen 0,001% bis 5%, bevorzugt zwischen 0,01 und 2%, am bevorzugtesten zwischen 0,05% und 0,9%; der Anteil an Weißteeextrakt liegt zwischen 0,05% bis 10%, bevorzugt zwischen 0,5% und 5%, am bevorzugtesten zwischen 0,1 % und 2%; der Anteil an Wildapfelextrakt zwischen 0,001 % bis 5%, bevorzugt zwischen 0,01 und 2%, am bevorzugtesten zwischen 0,05% und 0,9%. Gewichtsprozentangaben beziehen sich auf das Gesamtgewicht des fertigen Mittels.

[0029] Für die zweite Komponente mit den Wirkstoffen, die eine Erhöhung der Barrierefunktion der Haut zur Folge haben, wurde eine Zusammensetzung gewählt, die Tannine, Arganienöl und Hirseextrakt enthält.

[0030] Tannine bewirken topisch angewendet eine Senkung der Permeabilität der Hautkapillaren. Durch diese adstringierende Wirkung ziehen sich die Hautkapillaren zusammen, so dass es zu einer Steigerung der Spannkraft der Haut und damit zu einer positiven Wirkung auf Hautfältchen kommt.

[0031] Arganienöl, gewonnen aus den Früchten des Baumes *Argania spinosa*, weist einen hohen Anteil an ungesättigten Fettsäuren auf und ist reich an Alpha-Tocopherol.

[0032] Extrakte aus der Hirse enthalten Kieselsäure, Vitamine und die Mineralstoffe Magnesium und Calcium und werden deshalb wegen ihrer positiven Wirkung auf das Hautgerüst in kosmetischen Mitteln verwendet.

[0033] Die Anmelderin hat in überraschender Weise festgestellt, dass durch eine Kombination von Tanninen, Arganienöl und Hirseextrakten in kosmetischen in topischen Zubereitungen ein überraschender Synergieeffekt

der bekannten Wirkungen auftrat.

[0034] Nach Kenntnis der Anmelderin wurde die gemeinsame Verwendung von Arganöl, Tanninen und Hirseextrakt im Stand der Technik bisher noch nicht beschrieben.

[0035] Der Anteil an Tannin in der topischen Zubereitung liegt zwischen 0,05% bis 10%, bevorzugt zwischen 0,1 und 2%, am bevorzugtesten zwischen 0,2% und 1,0%; der Anteil an Arganöl liegt zwischen 0,1% bis 15%, bevorzugt zwischen 0,5% und 5%, am bevorzugtesten zwischen 1,0% und 3,5%; der Anteil an Hirseextrakt zwischen 0,001 und 1%, bevorzugt zwischen 0,01% und 0,5%, am bevorzugtesten zwischen 0,02 und 0,08%. Gewichtsprozentangaben beziehen sich auf das Gesamtgewicht des fertigen Mittels.

Ausführungsbeispiel

[0036] Das nachfolgende Beispiel beschreibt eine bevorzugte Ausführungsform der gesamten Erfindung, bestehend aus zwei getrennten Zubereitungen, die in einem Abstand von 1 Minute bis 60 Minuten, bevorzugt zwischen 5 Minuten und 20 Minuten, am bevorzugtesten zwischen 9 Minuten und 15 Minuten nacheinander angewendet werden.

Beispiel 1

a) Komponenten mit intercutanen Wirkstoffen

	g in 100g
Glycerinfettsäureester	10,0
Alkylsilicone	11,0
Glycol	5,0
Emulgator O/W	1,5
Carbomer	1,2
Alkanolamin	0,5
Mentholester	0,2
Sojaextrakt	0,2
Wildapfelextrakt	0,35
Weißteeextrakt	0,1
Wasser	ad 100

b) Komponente Wirkstoffen, die die Barrierefunktion der Haut erhöhen

	g in 100g
Glycerinfettsäureester	10,0
Alkylsilicone	10,6
Glycol	5,0
Arganienöl	2,5
Emulgator O/W	2,0
Carbomer	0,5
Alkanolamin	0,3
Kalium Sorbat	0,2
Tannine	0,4
Hirseextrakt	0,04
Wasser	ad 100

[0037] Für erste Wirksamkeitsversuche wurde die Emulsion X Probanden zur täglichen Anwendung an der Augenpartie überlassen und nach 10 Tagen die Oberflächenstruktur und das Erscheinungsbild der Faltentiefe optisch ausgewertet.

Patentansprüche

1. Zwei topische Zubereitungen zur aufeinander folgenden, äußerlichen Anwendung auf der menschlichen Haut, **dadurch gekennzeichnet** dass in der zuerst angewendeten Zubereitung Substanzen enthalten sind, die eine Wirkung in tieferen Hautschichten hervorrufen und in einer weiteren, zeitlich später im Abstand von 1 Mi-

nute bis 60 Minuten, bevorzugt zwischen 5 Minuten und 20 Minuten, am bevorzugtesten zwischen 9 Minuten und 15 Minuten nacheinander applizierte Zubereitung Stoffe enthalten sind, die bei bestimmungsgemäßer Wirkung die Aufnahmefähigkeit der Haut herabsetzen.

2. Zubereitungen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet dass in der zuerst angewendeten Zubereitung Sojaextrakt zwischen 0,001% bis 5%, bevorzugt zwischen 0,01 und 2%, am bevorzugtesten zwischen 0,05% und 0,9% enthalten ist.

3. Zubereitungen nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet dass in der zuerst angewendeten Zubereitung zusätzlich Weißteeextrakt zwischen 0,05% bis 10%, bevorzugt zwischen 0,5% und 5%, am bevorzugtesten zwischen 0,1% und 2% enthalten ist.

4. Zubereitungen nach Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet dass in der zuerst angewendeten Zubereitung zusätzlich Wildapfelextrakt zwischen 0,001 % bis 5%, bevorzugt zwischen 0,01 und 2%, am bevorzugtesten zwischen 0,05% und 0,9% enthält.

5. Zubereitungen nach Anspruch 1, 2, 3 oder 4 dadurch gekennzeichnet dass in der zweiten, zeitlich später angewandten Zubereitung Tannine in einer Menge zwischen 0,05% bis 10%, bevorzugt zwischen 0,1 und 2%, am bevorzugtesten zwischen 0,2% und 1,0% enthalten sind.

6. Zubereitungen nach Anspruch 5, dadurch gekennzeichnet dass in der zweiten, zeitlich später angewandten Zubereitung zusätzlich Arganienöl in einer Menge zwischen 0,1% bis 15%, bevorzugt zwischen 0,5% und 5%, am bevorzugtesten zwischen 1,0% und 3,5%; enthalten sind.

7. Zubereitungen nach Anspruch 6, dadurch gekennzeichnet dass in der zweiten, zeitlich später angewandten Zubereitung zusätzlich Hirseextrakt zwischen 0,001 und 1 %, bevorzugt zwischen 0,01 % und 0,5%, am bevorzugtesten zwischen 0,02 und 0,08% enthalten ist.

8. Topische Zubereitung zur äußerlichen Anwendung auf der menschlichen Haut dadurch gekennzeichnet dass sie zwischen 0,05% bis 10% Tannin, zwischen 0,1% bis 15% Arganöl und zwischen 0,001 und 1% Hirseextrakt enthält.

9. Zubereitung nach Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet dass sie zwischen 0,1% bis 2% Tannin, zwischen 0,5% bis 5% Arganöl und zwischen 0,01 und 0,05% Hirseextrakt enthält.

10. Zubereitung nach Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet dass sie zwischen 0,1% bis 1,0% Tannin, zwischen 1,0% bis 3,5% Arganöl und zwischen 0,02 und 0,08% Hirseextrakt enthält.

11. Topische Zubereitung zur äußerlichen Anwendung auf der menschlichen Haut dadurch gekennzeichnet dass sie zwischen 0,05% bis 10% Tannin, zwischen 0,1% bis 15% Arganöl und zwischen 0,001 und 1 % Hirseextrakt enthält.

12. Zubereitung nach Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet dass sie zwischen 0,1% bis 2% Tannin, zwischen 0,5% bis 5% Arganöl und zwischen 0,01 und 0,05% Hirseextrakt enthält.

13. Zubereitung nach Anspruch 12, dadurch gekennzeichnet dass sie zwischen 0,1% bis 1,0% Tannin, zwischen 1,0% bis 3,5% Arganöl und zwischen 0,02 und 0,08% Hirseextrakt enthält.

Es folgt kein Blatt Zeichnungen