

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200810156911.8

[51] Int. Cl.

A61K 8/97 (2006.01)

A61K 8/60 (2006.01)

A61Q 19/02 (2006.01)

[43] 公开日 2009年2月4日

[11] 公开号 CN 101357114A

[22] 申请日 2008.9.19

[21] 申请号 200810156911.8

[71] 申请人 江苏隆力奇生物科技股份有限公司

地址 215555 江苏省常熟市隆力奇生物工业园

[72] 发明人 徐之伟 张目 朱少娟 严泽民  
段明星

[74] 专利代理机构 南京苏高专利商标事务所  
代理人 陈建中

权利要求书1页 说明书6页

[54] 发明名称

美白抗氧化化妆组合物

[57] 摘要

本发明提供的美白抗氧化化妆组合物，其特征为，含有虎杖苷。虎杖苷可以抑制酪氨酸酶活性、黑素生成，还具有清除自由基、提高 SOD 活性等功能，表现出良好的美白和抗氧化功能。本发明提供的美白抗氧化化妆组合物具有美白皮肤、抗皱祛皱、祛斑、保湿等功效。

---

1、一种美白抗氧化化妆组合物，其特征为，含有虎杖苷。

2、根据权利要求1所述的美白抗氧化化妆组合物，其特征为，上述虎杖苷重量占该组合物总重量的0.001-10%。

3、根据权利要求2所述的美白抗氧化化妆组合物，其特征为，上述虎杖苷重量占该组合物总重量的0.05-1%。

4、根据权利要求3所述的美白抗氧化化妆组合物，其特征为，还含有地榆萃取液，该地榆萃取液重量占该组合物总重量的0.01-10%。

5、根据权利要求4所述的美白抗氧化化妆组合物，其特征为，上述地榆萃取液重量占该组合物总重量的0.05-5%。

## 美白抗氧化化妆组合物

### 技术领域

本发明涉及化妆品成分的组合物，特别是美白抗氧化化妆组合物。

### 背景技术

皮肤是保护人体内部器官的重要组织，主要由表皮层、真皮层和皮下组织构成。真皮层为皮肤提供了强度和弹性。随着时间的推移，皮肤逐渐衰老，出现皱纹、皮肤松弛等现象。通常认为，自由基是造成衰老的主要原因，因此清除或防止氧自由基是祛皱抗衰老化妆品的研究重点。皮肤的颜色主要取决于皮肤里所含黑色素的多少。黑色素合成过程如下：细胞内的酪氨酸在酪氨酸酶的作用下生成多巴醌，多巴醌变成多巴色素之后进一步氧化成二羟基吲哚，最后生成黑色素。在这一过程中，酪氨酸酶起着关键作用，该酶活性大小决定着黑色素形成的数量。当前的美白产品大多数以抑制酪氨酸酶为主。

虎杖苷 (polydatin, PD) 为蓼科蓼属多年生草本植物虎杖的干燥根和茎中提取的一种单体，也称白藜芦醇苷。其化学结构为 3, 4', 5-三羟基二苯乙烯-3-β-D-葡萄糖苷。近几十年来的研究表明，虎杖苷具有改善微循环、降血脂、抗肿瘤等生理活性，但迄今未公开过虎杖苷用于皮肤护理用途或美容用途。

本申请的发明人在研究中草药美白过程中，发现虎杖提取物具有良好的美白效果。更进一步的研究发现，虎杖提取物中的主要有效成分为虎杖苷。虎杖苷可以明显抑制酪氨酸酶活性和黑色素的生成，并对提取物进行反复选择和组合，同时，虎杖苷可以提高细胞SOD活性，清除各种自由基，具有明显的抗氧化效果。基于虎杖苷的这些功效，本发明人开发了一种含有虎杖苷的化妆组合物，它具有优异的美白和抗氧化效果；同时，该组合物为植物天然成分，无毒副作用，皮肤刺激性小，性质稳定，能促进皮肤的新陈代谢，改善皮肤的营养与健康。

### 发明内容

本发明提供的美白抗氧化化妆组合物，以重量百分比计，虎杖苷的用量可为0.001-10%，优选含量为0.05-1%。

本发明提供的美白抗氧化化妆组合物还含有地榆萃取液，该萃取液可以通过常规方法获得。例如可以将上述植物的根茎等与提取溶剂一起浸泡或者加热回流后，过滤、浓缩获

得。也可以进行进一步分离提纯处理。例如将上述溶剂提取得到的提取液原样或浓缩后的提取液通过树脂除去杂质。地榆萃取液中含有丰富的多酚类化合物。植物多酚具有良好的收敛作用，可使松弛的皮肤绷紧而减少皱纹；同时，植物多酚还是一种具有保湿、抗衰老作用的天然产物。本发明提供的美白抗氧化化妆组合物，以重量百分比计，地榆萃取液的用量为0.001-10%，优选含量为0.05-5%。

在本发明提供的美白抗氧化化妆组合物中，除上述必需成分以外，可以根据需要适当地配合通常在化妆品中使用的成分，例如，其他的美白剂、保湿剂、抗氧化剂、表面活性剂、醇类、水等基质成分。

本发明提供的美白抗氧化化妆组合物可以通过溶液、乳液、悬浮液等制备。可以是爽肤水、洁肤水、精华液、防晒霜或面膜等，但并不限于上述剂型和使用形态。

有益效果：虎杖苷可以抑制酪氨酸酶活性、黑素生成，还具有清除自由基、提高SOD活性等功能，表现出良好的美白和抗氧化功能。本发明提供的美白抗氧化化妆组合物具有美白皮肤、抗皱祛皱、祛斑、保湿等功效。

### 具体实施方式

下面举出实施例对本发明进行更详细的说明，但本发明的技术范围不受这些实施例限定，配比量是重量百分比。

实验方法和评价方法：

#### 1) 自由基清除作用的测定：

取待测液 2 mL 及浓度为 100  $\mu\text{mol/L}$  的 DPPH 溶液 2 mL 先后加入同一具塞试管中，摇匀；室温下静置 30 分钟，于 517nm 波长下测定样品吸光度。

抑制率： $k\% = [1 - (A_i - A_j) / A_c] \times 100\%$

$A_i$ ：2ml DPPH 溶液 + 2 ml 待测液的吸光度

$A_j$ ：2ml 待测液 + 2ml 溶剂的吸光度

$A_c$ ：2ml DPPH 溶液 + 2ml 溶剂的吸光度

#### 2) 超氧化物歧化酶 (Superoxide Dismutase, SOD) 检测：

SOD 对机体的氧化与抗氧化平衡起着至关重要的作用。SOD 能清除超氧阴离子自由基，保护细胞免受损伤。试剂盒采用黄嘌呤氧化酶法(羟胺法)测定 SOD 活力。通过黄嘌呤及黄嘌呤氧化酶反应系统产生超氧阴离子自由基，后者氧化羟胺形成亚硝酸盐，在显色剂的作

用下呈现紫红色，用可见光分光光度计测其吸光度。当被测样品中含 SOD 时，则对超氧阴离子自由基有专一性的抑制作用，使形成的亚硝酸盐减少，比色时测定管的吸光度值低于对照管的吸光度值，通过公式计算可求出被测样品中的 SOD 活力。

将 B16 黑色素细胞以  $1 \times 10^5$  个 / mL 的密度接种于 6 孔板。每孔 3ml，孵育 24 h 后，弃上清液，添加待测药物，药物作用 3d 后，弃上清液，PBS 洗涤，每孔加入 0.5 mL 胰酶消化细胞 3 min，每孔加 2ml 维持液终止消化。吹打混匀后，细胞悬液离心弃上清液，加 PBS 冰浴中超声破碎。反复冻融 3 次，按试剂盒操作说明检测 SOD 活性。

### 3) 抑制小鼠黑色素细胞中酪氨酸酶活力试验：

将 B16 黑色素细胞接种于 96 孔板中，每孔 100  $\mu$ l，置培养箱中培养 24 h 后，添加药物。药物作用 3 d 后，弃去上清液，用 pH 6.8 PBS 冲洗两遍，每孔加 90  $\mu$ l 含 1% (体积分数) Triton X-100 的 PBS。冰浴中超声破碎，每孔加 10  $\mu$ l 10 mmol / L 的 L-dopa，37 $^{\circ}$ C 孵育 60 min，于 475 nm 处比色，空白孔调零，测各孔吸光度值。

抑制率 =  $(1 - \text{药物组平均吸光度值} \div \text{对照组平均吸光度值}) \times 100\%$ 。

### 4) 抑制小鼠黑色素细胞中黑素合成试验

将来自小鼠的 B16 黑素瘤细胞以  $1 \times 10^5$  个 / mL 的密度接种于培养皿，在 37 $^{\circ}$ C、5%CO<sub>2</sub> 的条件下培养 2 天。弃上清液，添加药物，药物作用 3d 后，弃上清液，PBS 洗涤，每孔加入 0.5 mL 胰酶消化细胞 3 min，每孔加 2ml 维持液终止消化。吹打混匀后，每种浓度取出 0.5 mL 做细胞计数。其余细胞悬液以 2500 r / min 离心 5 min，弃上清液，于沉淀中加入 NaOH 溶液，加热使黑色素溶解，分光光度计检测 475nm 的吸光度。

黑色素合成抑制率 =  $[1 - (\text{药物孔吸光度值} \div \text{药物孔细胞密度}) \div (\text{对照孔吸光度值} \div \text{对照孔细胞密度})] \times 100\%$

### 最终实验结果：

	自由基清除作用	SOD 活性提高	酪氨酸酶活力抑制	黑素合成抑制
虎杖苷	76.4%	16.5%	46.7%	52.3%
熊果苷	53.8%	无作用	21.3%	30.5%

实验表明，虎杖苷能有效抑制酪氨酸酶活性、抑制黑素生成，同时具有清除自由基和增加 SOD 活力的功能，其效果明显优于常用的美白剂熊果苷。

**实施例 1：化妆水**

A 和 B 组分	占该化妆水的重量百分比
A: 聚氧乙烯 (15) 月桂醇醚	0.5
甘油	4.0
乙醇	5.0
丝肽	2.0
聚氧乙烯 (80) 脱水山梨醇单油酸酯	0.4
防腐剂、香精	适量
三乙醇胺	0.1
卡波	0.1
B: 虎杖苷	0.10
地榆萃取液	1.00

制备：搅拌下将 A 和 B 组分分别加入到去离子水中，搅匀即可

**实施例 2：精华露**

组分	占该精华露的重量百分比
1, 3-丁二醇	2.00
甘油	3.00
聚氧乙烯 (20) 油基醚	1.30
油酸乙酯	0.50
油醇	0.40
柠檬酸	0.35
磷酸二钠	0.65
对羟基苯甲酸甲酯	0.10
虎杖苷	0.10
地榆萃取液	1.00

制备：依次将上述组分加入去离子水中，混合均匀即可。

**实施例 3：润肤霜**

组分	占该润肤霜的重量百分比
A: 十六十八醇	7.5
单甘酯	2.5
白油	13.0
羊毛脂	0.50
B: 甘油	2.0
丙二醇	5.0
脂肪酸聚氧乙烯(7)醚	2.0
C: 防腐剂	适量
香精	0.3
D: 虎杖苷	0.10
地榆萃取液	1.00

制备: 1) 加热并搅拌 A 至 80C;

2) 将 B 混合好, 加热到 85C;

3) 将 C 和 D 加入去离子水中;

4) 将 A 加入到 B, 高速均质, 持续搅拌并降温, 至 50C 时加入去离子水中, 搅拌均匀即可。

#### 实施例 4: 美白面膜

组分	占该美白面膜的重量百分比
聚乙烯醇	12.0
醋酸乙烯酯乳液	14.0
丙二醇	5.0
聚氧乙烯(60)失水山梨醇单硬脂酸酯	0.5
硅酮油乳化液	1.5
乙醇	5.0
虎杖苷	0.10
地榆萃取液	1.00

---

制备：用乙醇将聚乙烯醇润湿，加入到混合了聚氧乙烯（60）失水山梨醇单硬脂酸酯和硅酮乳化液的无离子水中，加热到 70℃，同时进行搅拌，使之混合均匀，再将其它剩余的原料全部加入，搅匀即可。