



SCHWEIZERISCHE EIDGENOSSENSCHAFT
BUNDESAMT FÜR GEISTIGES EIGENTUM

Int. Cl.³: A 61 K

7/00

Erfindungspatent für die Schweiz und Liechtenstein
Schweizerisch-liechtensteinischer Patentschutzvertrag vom 22. Dezember 1978



PATENTSCHRIFT A5

(11)

633 708

(21) Gesuchsnummer: 8963/80

(73) Inhaber:
Codiva AG, Zug

(22) Anmeldungsdatum: 04.12.1980

(72) Erfinder:
Dr. Paul Dubs, Zug

(24) Patent erteilt: 31.12.1982

(45) Patentschrift
veröffentlicht: 31.12.1982

(74) Vertreter:
Brühwiler & Co., Zürich

(54) Kosmetische Zubereitung.

(57) Die kosmetischen Zubereitungen enthalten als hautpflegende Komponente Nerolidol, seine Ester und/oder Aether.

Nerolidol zeigt in den kosmetischen Zubereitungen neben der hautpflegenden auch eine Emulgier-Wirkung sowie eine Strukturverbesserung von Crèmes.

PATENTANSPRÜCHE

1. Kosmetische Zubereitung, dadurch gekennzeichnet, dass sie Nerolidol, dessen Ester und/oder Äther als hautpflegende Komponente enthält.

2. Kosmetische Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass sie 0,01 bis 20 Gew.-% Nerolidol, dessen Ester und/oder Äther enthält.

3. Kosmetische Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass sie 0,5 bis 1,0 Gew.-% Nerolidol, dessen Ester und/oder Äther enthält.

4. Kosmetische Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass sie Collagen enthält.

5. Kosmetische Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass sie Natural Moisture Faktor enthält.

6. Kosmetische Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass sie Collagen und Natural Moisture Faktor enthält.

7. Kosmetische Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass sie Panthenol enthält.

8. Kosmetische Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass sie Collagen und Panthenol enthält.

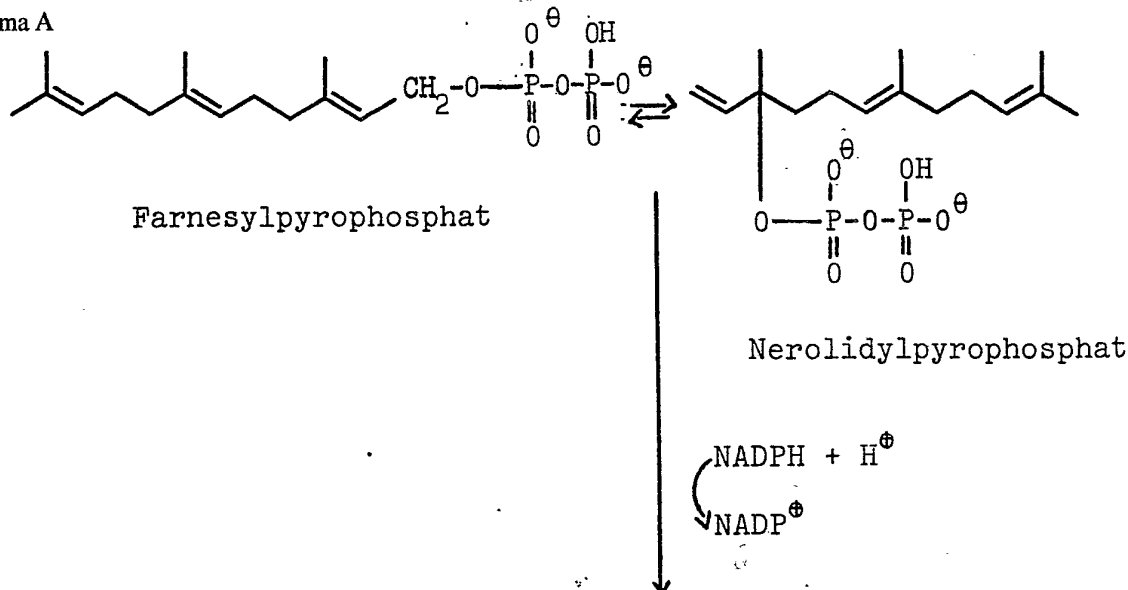
9. Kosmetische Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass sie in Form eines Pflegeproduktes vorliegt.

Die Erfindung betrifft eine kosmetische Zubereitung, welche Nerolidol, d.h. 3,7,11-Trimethyl-1,6,10-dodecatrien-3-ol, dessen Ester und/oder Äther als hautpflegende Komponente enthält.

Es ist bereits bekannt, in kosmetischen Zubereitungen als hautpflegende Komponente Squalen, Lanosterin, Cholesterin, wie auch Derivate von Cholsäuren, einzusetzen [G.A. Nowak, «Die kosmetischen Präparate» (2. Auflage), Verlag für chem. Industrie (H. Ziolkowsky KG, Augsburg) S. 23 und 189; Karlheinz Schrader, «Grundlagen und Rezepturen der Kosmetika» (Dr. Alfred Hüthig Verlag, Heidelberg) S. 49, 102 und 146; Dr. R.A. Eckstein, «Biokosmetik: Aus Forschung und Praxis» (1976, Linde Eckstein KG, Nürnberg) S. 380]. Leider sind die genannten Produkte Squalen, Lanosterin und Cholesterin zum Teil schwer zugänglich, zum Teil kostspielig, wobei die Zugänglichkeit zum Teil auch noch von ökonomischen und politischen Faktoren abhängt. Beispielsweise wird Squalen aus Haifischleberöl gewonnen, das immer schwieriger in der erforderlichen Qualität erhalten werden kann. Th. R. Davis, *Cosmetics and Toiletries* 91 (1976) 33 hat bereits versucht, dieses Naturprodukt durch synthetische Stoffe zu ersetzen.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, die obengenannten hautpflegenden Substanzen in kosmetischen Zubereitungen durch andere, leichter zugängliche und ökonomisch vorteilhaftere Substanzen zu ersetzen. Durch die Änderung der Rezeptur sollte jedoch weder Stabilität noch Konsistenz oder Aussehen der kosmetischen Zubereitungen nachteilig verändert werden.

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass Nerolidol, seine Ester und/oder Äther, die im folgenden als Derivatschema A



vate bezeichnet werden, als Bestandteil von kosmetischen Zubereitungen, bei ihrer Verwendung, auf der Haut eine pflegende Wirkung entfalten.

Neben der Pflegewirkung weist Nerolidol und seine Derivate bereits bei der Herstellung der kosmetischen Zubereitung durch seine Emulgierwirkung Vorteile auf. Weiterhin ist Nerolidol bzw. seine Ester und Äther, verglichen mit bisher verwendeten Naturstoffen, stabiler gegen Oxidation.

Die Erfindung betrifft deshalb kosmetische Zubereitungen, insbesondere Pflegeprodukte, welche Nerolidol, dessen Ester und/oder Äther als hautpflegende Komponente enthalten.

Nerolidol ist in vielen natürlich vorkommenden ätherischen Ölen, wie z. B. Jasminblütenöl, Verbenaöl, Orangenblütenöl, Neroliöl usw., enthalten [E. Gildemeister & Fr. Hoffmann, «Die ätherischen Öle», Bd. IIIb, (Berlin, 1962), S. 239], und wurde bereits als Riechstoff in verschiedenen Zubereitungen eingesetzt.

Weiterhin weist Nerolidol und die Nerolidol enthaltenden Zubereitungen und natürlichen Öle antimikrobielle Eigenschaften auf [J.A. Morris, A. Khettry & E. W. Seitz, *J. Am. Oil Chem. Soc.* 56(5), (1979) 595].

G. Popjak & J.W. Cornforth, *Advances in Enzymology* 22 (1960) 281 und L. Gosselin & J. Duvivier, *Bull. Soc. Chim. Biol.* 47, (1965) 359 haben experimentell gezeigt, dass die Phosphatform von Nerolidol mit enzymatischen Systemen aus Leberhomogenaten zu Squalen metabolisiert werden kann. Letzteres kann dann weiter in Steroide, wie Lanosterin, Cholesterin usw., übergeführt werden. Diese bekannten Reaktionen sind in Schema A und B nachfolgend dargestellt:

Beispiel 1 (Emulsion)

Beispiel 1a) (gemäß der Erfindung)

A)	Isopropylmyristinat	100 g
	Nerolidol	50 g
	Glycerinmonostearat	5 g
	«Amphisol»*	2 g
B)	Propylenglykol	50 g
	Wasser	670 g
	Total	877 g

* Amphisol = Diäthanolammoniumsalz eines partiellen Phosphorsäurealkylesters (ex Givaudan).

Durch sukzessives Zufügen des Emulgatorenpaars Glycerinmonostearat und «Amphisol» in einem Gewichtsverhältnis von 5 : 2 konnte gezeigt werden, dass, bereits nach Zugabe von 5 g Glycerinmonostearat und 2 g «Amphisol» zur obigen Grundmasse (bestehend aus Isopropylmyristinat und Nerolidol), sich diese emulgieren liess.

Sowohl die Fettphase A) wie die Wasserphase B) wurden auf 75 °C erwärmt. Danach wurde B) zu der mit einem Turbinenrührer gerührten Phase A) gegeben, und die Zubereitung wurde unter gutem Rühren auf Raumtemperatur abkühlen gelassen.

Beispiel 1b) (Vergleich)

A)	Isopropylmyristinat	150 g
	Glycerinmonostearat	12,5 g
	«Amphisol»	5 g
B)	Propylenglykol	50 g
	Wasser	670 g
	Total	887,5 g

Die Fettphase bestand nur aus Isopropylmyristinat. Nerolidol wurde in diesem Experiment völlig weggelassen; mengenmässig wurde es jedoch durch Zusatz eines entsprechenden Anteils an Isopropylmyristinat kompensiert.

Dabei zeigte sich, dass, bei ansteigender Zugabe beider Emulgatoren in dem in Beispiel 1a) erwähnten Verhältnis, eine Emulgierung erst nach Zusatz von 12,5 g Glycerinmonostearat und 5 g «Amphisol» erreicht werden konnte. Es brauchte also, verglichen mit Beispiel 1a), die 2,5fache Menge an Emulgatormischung bei gleichen Bedingungen, um eine Emulsion zu erhalten.

Beispiel 1c) (Vergleich)

A)	Isopropylmyristinat	100 g
	Squalan	50 g
	Glycerinmonostearat	12,5 g
	«Amphisol»	5 g
B)	Propylenglykol	50 g
	Wasser	670 g
	Total	887,5 g

Wurde das verzweigt-kettige Nerolidol des Beispiels 1a) durch eine äquivalente Menge des ebenfalls eine verzweigte Kohlenstoffkette aufweisenden Squalans ersetzt, erhielt man dadurch ein ebenfalls beträchtlich schwerer zu emulgierendes System als das unter Beispiel 1a) erwähnte. So liess sich mittels eines Vorgehens, das demjenigen der Beispiele 1a) und 1b) entsprach (Zugabe des Emulgatorenpaars in ansteigender Menge), zeigen, dass auch hier die ca. 2,5fache Emulgatorenmenge bezüglich des Beispiels 1a) eingesetzt werden musste, um eine entsprechende Emulgierung zu erreichen.

Beispiel 2

Der Effekt von Nerolidol auf Konsistenz, Oberflächenstruktur und Weichheit einer Crème wurde an Hand einer stearinsäurereichen O/W-Emulsion vom Tagescrème-Typ in den Beispielen 2a) und 2b) untersucht.

Beispiel 2a) (Tagescrème)

A)	Stearin	70 g
	Nerolidol	50 g
	Isopropylmyristinat	100 g
	Glycerinmonostearat	30 g
	«Amphisol»	10 g
	«Sterilip»*	5 g
	«Anoxol»**	5 g
	«Irgasan DP 300»***	3 g
B)	Propylenglykol	50 g
	Wasser	666,5 g
	«Sterilaqua»****	3 g
C)	Parfüm	7,5 g
	Total	1000,0 g

* «Sterilip» = Konservierungsmittel vom p-Hydroxybenzoesäureester-Typ der Codive AG, CH-6300 Zug

** «Anoxol» = Synergetisches Antioxidans der Codiva AG, CH-6300 Zug

*** «Irgasan DP 300» = Konservierungsmittel vom Typus eines polychlorierten Phenols der Ciba-Geigy AG, CH-4002 Basel

**** «Sterilaqua» = vom Imidazolidinylharnstoff-Typ der Codiva AG, CH-6300 Zug

Die Fettphase A) sowie die Wasserphase B) wurden auf 75 °C erhitzt; danach wurde die Wasserphase langsam zu der mit dem Turbinenrührer gerührten Fettphase zugegeben. Es wurde, unter weiterem Rühren, auf ca. 35 °C abgekühlt, und ebenfalls unter Rühren wurde die Parfümphase C) zugegeben. Nach Erreichen der Raumtemperatur wurde das Rühren eingestellt.

Beispiel 2b) (Vergleich)

A)	Stearin	70 g
	Isopropylmyristinat	100 g
	Glycerinmonostearat	30 g
	«Amphisol»	10 g
	«Sterilip»	5 g
	«Anoxol»	5 g
	«Irgasan DP 300»	3 g
B)	Propylenglykol	50 g
	Wasser	666,5 g
	«Sterilaqua»	3 g
C)	Parfüm	7,5 g
	Total	950,0 g

Nerolidol wurde vollständig weggelassen. Die übrigen Emulsionsbestandteile entsprechen jenen in Beispiel 2a) und wurden auch in denselben Mengen und unter den gleichen Bedingungen eingesetzt. Ein Vergleich der beiden Emulsionen zeigt sofort, dass diejenige von Beispiel 2a) durch den Zusatz von Nerolidol viel weicher, von glatterer Oberfläche und von ansprechenderer Struktur ist. Beim Auftragen auf die Haut erzeugt sie ein weiches, angenehmes Gefühl und zeigt ein ausgeprägteres Spreitvermögen. Zudem ist das bei stearinhaltigen Crèmes normalerweise anzutreffende Weissen auf der Haut durch den Nerolidol-Zusatz stark reduziert.

Beispiel 3 (Nährende Tagescrème)

Eine Tagescrème wurde wie in Beispiel 2b) hergestellt. Zur Fettphase A) wurden noch 10 g Nerolidol und zur Wasserphase B) 10 g Kollagen gegeben.

Beispiel 4 (Befeuchtende Tagescrème)

Eine Tagescrème gemäss Beispiel 2b) wurde hergestellt. Zur Fettphase A) wurden noch 10 g Nerolidol und zur Wasserphase B) 10 g NMF als Feuchtefaktor («Dermamoist-NMF» der Codiva AG, CH-6300 Zug) zugegeben.

Beispiel 5 (Tagescrème)

Eine Tagescrème gemäss Beispiel 2b) wurde hergestellt. Zur Fettphase A) wurden noch 10 g Nerolidol und zur Wasserphase B) 10 g Kollagen und 10 g NMF zugegeben.

Beispiel 6 (Tagescrème)

Eine Tagescrème gemäss Beispiel 2b) wurde hergestellt. Zur Fettphase A) wurden noch 10 g Nerolidol und zur Wasserphase B) 10 g Panthenol zugegeben.

Beispiel 7 (Tagescrème)

Eine Tagescrème gemäss Beispiel 2b) wurde hergestellt. Zur Fettphase A) wurden noch 10 g Nerolidol und zur Wasserphase B) 10 g Panthenol und 10 g Kollagen zugegeben.

Beispiel 8 (Tagescrème)

Eine Tagescrème gemäss Beispiel 2b) wurde hergestellt. Zur Fettphase A) wurden noch 200 g Nerolidol zugegeben.

Beispiel 9 (Tagescrème)

Eine Tagescrème gemäss Beispiel 2b) wurde hergestellt. Zur Fettphase A) wurden noch 0,1 g Nerolidol zugegeben.

Beispiel 10 (Tagescrème)

Eine Tagescrème gemäss Beispiel 2b) wurde hergestellt. Zur Fettphase A) wurden noch 7 g Nerolidol zugegeben.

Beispiel 11 (Nachtcrème)

A)	«Protegin»*	180 g
	Lanolin	80 g
	Bienenwachs	35 g
	Mikrokristalliner Wachs	40 g
	Perhydrosqualen	80 g
	Nerolidol	10 g
	Paraffinöl	150 g
	Cetiol V	100 g
	«Sterilip»	5 g
	«Anoxol»	5 g
B)	Magnesiumsulfat	2 g
	«Sterilaqua»	3 g
	Wasser	302 g
C)	Parfüm	8 g
	Total	<u>1000 g</u>

* Von der Th. Goldschmidt AG, D-43 Essen

Das Vermischen erfolgte analog zu Beispiel 2a).

Beispiel 12 (Gesichtsöl)

A)	«PCL, liquid»*	100 g
	Olivenöl	300 g
	Nerolidol	10 g
5	«Miglyol 812»**	200 g
	«Cetiol V»****	300 g
	Avocadoöl	60 g
	Johanniskrautöl***	10 g
	Vitaminöl***	10 g
10	«Anoxol»	10 g
	Total	<u>1000 g</u>

* Von Dragoco Gerberding & Co. GmbH, D-3450 Holzminden

15 ** Von Dynamit Nobel, Werk Witten, D-581 Witten/Ruhr

*** Von HACOBA AG, CH-4002 Basel

**** Decyloleat der Firma Henkel KGaA, D-4000 Düsseldorf 1

20 Die Komponenten dieser Zubereitung wurden bei Raumtemperatur durch Rühren miteinander vermischt.

Beispiel 13 (Pflegender Lippenstift)

	Eosine	30 g
	Pigmente und Farblacke	60 g
25	Ricinusöl	140 g
	Oleylalkohol	160 g
	Carnaubawachs	90 g
	Lanolin anhydr.	120 g
30	Bienenwachs	140 g
	«Comperlan HS»*	40 g
	Ozokerit	70 g
	«PCL, solid»**	90 g
	Kolophonium	20 g
	«Anoxol»	10 g
35	Nerolidol	40 g
	Parfüm	10 g
	Total	<u>1020 g</u>

40 * Von Henkel KGaA, D-4000 Düsseldorf 1

** Von Dragoco Gerberding & Co. GmbH, D-3450 Holzminden

Herstellung: Pigmente und Farblacke wurden gründlich gemischt, durch ein feines Sieb gestrichen, mit einem Teil des Oleylalkohols benetzt und in einer Kolloidmühle vermahlen. Danach wurde die Farbmasse zu den übrigen Rohstoffen gegeben und mit diesen unter gutem Rühren geschmolzen. Die erhaltene Lippenstiftmasse wurde in die vorgewärmten Giessformen gegossen, die danach abgekühlt wurden. Nach Erreichen der Raumtemperatur wurden die Stifte den Formen entnommen, und durch Abflammen mit einem Bunsenbrenner wurde ihre Oberflächenbeschaffenheit verbessert.