



SCHWEIZERISCHE EIDGENOSSENSCHAFT
BUNDESAMT FÜR GEISTIGES EIGENTUM

⑪ CH 658 785 A5

⑤① Int. Cl. 4: A 61 K 7/48

// A 61 K 7/15

Erfindungspatent für die Schweiz und Liechtenstein

Schweizerisch-liechtensteinischer Patentschutzvertrag vom 22. Dezember 1978

⑫ **PATENTSCHRIFT** A5

⑳ Gesuchsnummer: 2907/84

㉔ Anmeldungsdatum: 15.06.1984

㉔ Patent erteilt: 15.12.1986

④⑤ Patentschrift
veröffentlicht: 15.12.1986

㉓ Inhaber:
Pentapharm AG, Basel

㉓ Erfinder:
Stocker, Kurt F., Aesch BL

⑤④ **Haemostyptisch wirksames Hautpflegemittel.**

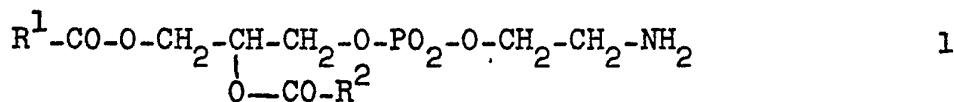
⑤⑦ Es wird ein Hautpflegemittel mit haemostyptischen Eigenschaften beschrieben, welches als topisch haemostyptisch wirksame Komponente mindestens ein Phospholipid enthält.

PATENTANSPRÜCHE

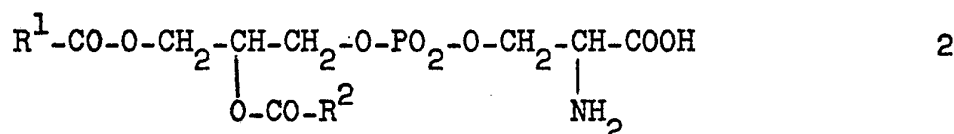
1. Hautpflegemittel mit haemostyptischen Eigenschaften, dadurch gekennzeichnet, dass es als topisch haemostyptisch wirksame Komponente mindestens ein Phospholipid und ein

hautverträgliches Trägermaterial für die genannte Wirkkomponente enthält.

2. Hautpflegemittel gemäss Patentanspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass es als haemostyptisch wirksame Komponente mindestens ein Phospholipid der Formel



und/oder der Formel

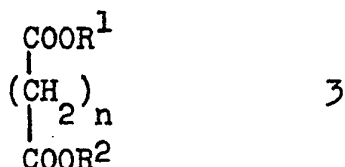


enthält, in welchen Formeln R^1 und R^2 gesättigte oder einfach oder mehrfach ungesättigte Alkylreste mit Kettenlängen von C_{11} bis C_{21} bezeichnen.

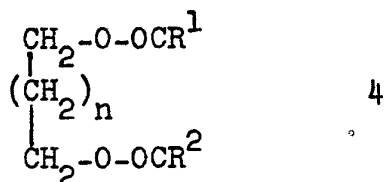
3. Hautpflegemittel gemäss Patentanspruch 2, dadurch gekennzeichnet, dass es als haemostyptisch wirksame Komponente einen durch Extraktion von Soyabohnen, Erdnüssen, Eigelb oder Hirn, Rückenmark, Lunge oder Leber von Schlachttieren gewonnenen, mindestens ein Phospholipid der im Patentanspruch 2 angegebenen Formeln 1 und/oder 2 enthaltenden Lipidextrakt enthält.

4. Hautpflegemittel gemäss einem der Patentansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, dass es einen Lösungsvermittler für die haemostyptisch wirksame Komponente enthält.

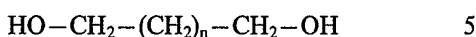
5. Hautpflegemittel gemäss Patentanspruch 4, dadurch gekennzeichnet, dass der Lösungsvermittler ein Ester der Formel



in welcher n eine ganze Zahl von 1 bis 4 und R^1 und R^2 Alkylreste mit je 1 bis 9 Kohlenstoffatomen bezeichnen und die Summe der Kohlenstoffatome von R^1 und R^2 vorzugsweise 2 bis 10 beträgt, ein Ester der Formel



in welcher n die Zahl 0, 1, 2 oder 3 und R^1 und R^2 Alkylreste mit je 1 bis 9 Kohlenstoffatomen bezeichnen und die Summe der Kohlenstoffatome von R^1 und R^2 vorzugsweise 2 bis 10 beträgt, Triacetyl glycerin, ein Dialkylester der Apfelsäure, Weinsäure oder Oxalessigsäure, in welchem die Summe der Kohlenstoffatome der beiden Alkylreste vorzugsweise 2 bis 10 beträgt, ein Di- oder Trialkylester der Zitronensäure, in welchem die Summe der Kohlenstoffatome der Alkylreste vorzugsweise 3 bis 12 beträgt, oder ein zweiwertiger aliphatischer Alkohol der Formel



in welcher n die Zahl 0, 1, 2 oder 3 bezeichnet, ist.

6. Hautpflegemittel gemäss einem der Patentansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass es ein wässrig-alkoholisches Rasierwasser ist.

7. Rasierwasser gemäss Patentanspruch 6, dadurch gekennzeichnet, dass es 1–20 mg, vorzugsweise 3–5 mg Phospholipid oder eine äquivalente Menge eines phospholipidhaltigen pflanzlichen oder tierischen Gewebeextraktes pro 100 g enthält.

8. Rasierwasser gemäss den Patentansprüchen 6 und 7, dadurch gekennzeichnet, dass es 1–20 mg, vorzugsweise 3–5 mg, von aus Rinderhirn gewonnenem Kephalin pro 100 g enthält.

9. Rasierwasser gemäss den Patentansprüchen 6 bis 8, dadurch gekennzeichnet, dass es als Lösungsvermittler Propylenglykol und Adipinsäuredibutylester enthält.

10. Rasierwasser gemäss den Patentansprüchen 6 bis 9, dadurch gekennzeichnet, dass es 35 bis 90 Vol. % eines Alkohols, vorzugsweise Äthanol oder Isopropanol, enthält.

11. Rasierwasser gemäss den Patentansprüchen 6 bis 10, dadurch gekennzeichnet, dass es ein pH von 6 bis 9, vorzugsweise 7 bis 8, aufweist.

Die vorliegende Erfindung betrifft ein Hautpflegemittel, insbesondere ein Rasierwasser mit haemostyptischen Eigenschaften.

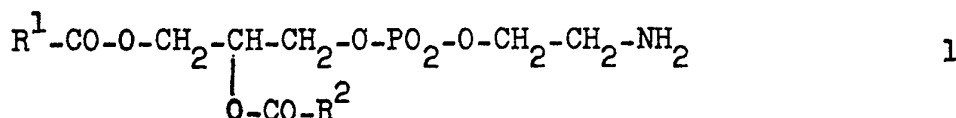
Die Rasur führt nicht selten zu Verletzungen der Haut, bisweilen sogar zu blutenden Hautwunden. Um eine Infektion solcher Wunden zu bekämpfen, werden nach der Rasur sogenannte Rasierwässer appliziert. Rasierwässer sind parfümierte, bakterizid wirkende Alkohol-Wasser-Gemische, die meistens noch einen oder mehrere Zusatzstoffe mit feuchthaltender und/oder rückfettender Wirkung enthalten. Häufig werden zusätzlich bakterizid wirkende Stoffe oder adstringierende, epithelisierende oder entzündungshemmende Wirkstoffe zugesetzt.

Die meisten im Handel vertriebenen Rasierwässer wirken sich nachteilig auf die Blutstillung aus, indem sie den pH-Wert in einen für die Blutgerinnung ungünstigen Bereich verschieben und/oder die Plättchenaggregation hemmen und/oder gerinnungsaktive Phospholipidmicellen zerstören und/oder enzymatische Gerinnungsfaktoren hemmen.

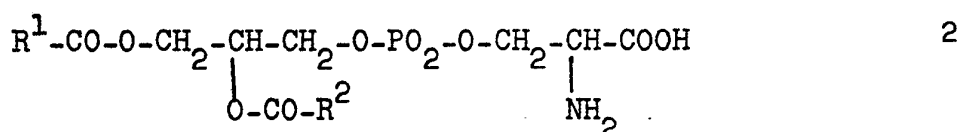
Es wurde nun gefunden, dass Phospholipide enthaltende Lipidfraktionen aus pflanzlichem oder tierischem Gewebe als Zusätze zu Hautpflegemitteln auf die menschliche Haut eine günstige rückfettende Wirkung ausüben und insbesondere bei Verwendung in wässrig-alkoholischen Rasierwäs-

sen das übliche Spannungsgefühl auf der Haut vermindern und nicht nur keine hemmende Wirkung, sondern überraschenderweise eine fördernde Wirkung auf die Blutgerinnung ausüben.

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von Phospholipiden als topisch haemostyptisch wirkende Zusätze zu Hautpflegemitteln, z. B. Hautcrèmen, Rasierwässern, Hautlotionen, usw. Die Erfindung betrifft ebenfalls Hautpflegemittel, die als topisch haemostyptisch wirksame Komponente ein oder mehrere Phospholipide und ein hautverträgliches Trägermaterial für die Wirkkomponente enthalten.



und um Phosphatidylserine (Synonym: Serinkephaline) der Formel 2



handelt. In den Formeln 1 und 2 bezeichnen R^1 und R^2 gesättigte oder einfach oder mehrfach ungesättigte Alkylreste mit Kettenlängen von C_{11} bis C_{21} .

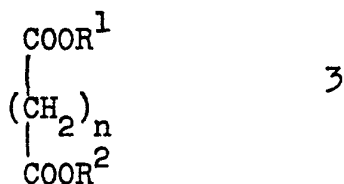
Die Phosphatidyläthanolamine sind in Wasser unlöslich, jedoch mehr oder weniger gut emulgierbar. Die Phosphatidylserine sind schlecht emulgierbar, bilden jedoch mit Alkalien gut emulgierbare Salze. Je nach Fettsäurezusammensetzung sind Phosphatidyläthanolamine mehr oder weniger löslich in Äthylalkohol, Phosphatidylserine sind hingegen unlöslich in Alkohol.

Bedingt durch die begrenzte Löslichkeit der Kephaleine ergeben sich bei der Formulierung von Rasierwässern Unverträglichkeiten mit anderen Zusatzstoffen, und eine Beimengung von Lösungsvermittlern erweist sich je nach Formel und je nach Reinheit und Fettsäurezusammensetzung des Kephalinpräparates als erforderlich.

Bei der Wahl geeigneter Lösungsvermittler wurde jedoch beobachtet, dass viele der erprobten Substanzen die blutgerinnungsfördernde Wirkung von kephalinhaltigen Lipidfraktionen zerstören.

Es wurde jedoch gefunden, dass Ester von mehrwertigen gesättigten aliphatischen Carbonsäuren und aliphatischen Alkoholen, ferner Ester von gesättigten aliphatischen Monocarbonsäuren und mehrwertigen gesättigten aliphatischen Alkoholen sowie zweiwertige aliphatische Alkohole gute lösungsvermittelnde Eigenschaften insbesondere für Kephalin aufweisen, ohne dabei dessen gerinnungsfördernde Aktivität zu beeinträchtigen.

Als Ester von mehrwertigen gesättigten aliphatischen Carbonsäuren eignen sich Verbindungen der allgemeinen Formel 3,



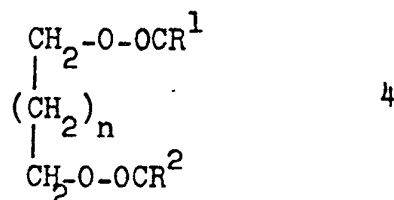
in welcher n eine ganze Zahl von 1 bis 4 und R^1 und R^2 Alkylreste mit je 1 bis 9 Kohlenstoffatomen bezeichnen. Vorzugsweise beträgt die Summe der Kohlenstoffatome von R^1 und R^2 2 bis 10.

Als phospholipidhaltige Lipidfraktionen können z. B. Lipidfraktionen verwendet werden, die aus Soyabohnen, Erdnüssen, Eigelb oder Hirn, Rückenmark, Lunge oder Leber von Schlachttieren, wie z. B. Rind, Schwein oder Schaf, durch Extraktion mit organischen Lösungsmitteln nach üblichen Methoden erhältlich sind. Es können auch synthetische, im Handel erhältliche Phospholipide verwendet werden.

Es wurde gefunden, dass es sich bei den blutgerinnungsfördernden Komponenten der genannten Lipidfraktionen um Phosphatide, insbesondere um Phosphatidyläthanolamine (Synonym: Colaminkephaline) der Formel 1

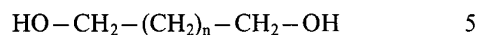
Es eignen sich ferner Dialkylester der Hydroxydicarbonsäuren Apfelsäure, Weinsäure und Oxalessigsäure, wobei die Summe der C-Atome der beiden Alkylreste vorzugsweise zwischen 2 und 10 liegen sollte. Ausserdem eignen sich Di- oder Trialkylester der Zitronensäure, in welchen die Summe der C-Atome der Alkylreste 3 bis 12 beträgt.

Als Ester von gesättigten aliphatischen Monocarbonsäuren und mehrwertigen gesättigten aliphatischen Alkoholen eignen sich Triacetylglycerin sowie Verbindungen der allgemeinen Formel 4



in welcher n die Zahlen 0, 1, 2 oder 3 und R^1 und R^2 Alkylreste mit je 1 bis 9 Kohlenstoffatomen bezeichnen. Vorzugsweise beträgt die Summe der Kohlenstoffatome von R^1 und R^2 2 bis 10.

Als zweiwertige aliphatische Alkohole eignen sich Verbindungen der Formel



in welcher n die Zahl 0, 1, 2 oder 3 bezeichnet.

Bei der Herstellung von Rasierwässern verwendet man die Phospholipidkomponente mit Vorteil in Konzentrationen von etwa 1 bis 20 mg, vorzugsweise 3 bis 5 mg, auf 100 g des fertigen Rasierwassers. Bei diesen Konzentrationen erzielt man eine optimale blutstillende Wirkung des Rasierwassers. Zur Erzielung einer optimalen blutstillenden Wirkung ist auch das pH des Rasierwassers wichtig. Das pH wird zweckmässigerweise auf etwa 6 bis 9, vorzugsweise 7 bis 8, eingestellt. Zur Einstellung des pH kann man beispielsweise NaOH oder Triäthanolamin verwenden.

Besonders gute Resultate werden bei Verwendung von aus Rinderhirn extrahiertem Kephalin als Phospholipidkomponente erhalten. Man kann jedoch auch aus anderen Quellen stammende Phospholipide verwenden.

Es ist vorteilhaft, als Trägermaterial für die Phospholipidkomponente einen wässrigen Alkohol, z. B. 35- bis 90%iges Äthanol oder Isopropanol, zu verwenden.

Beispiel 1

Einer Mischung von 2 g von aus Rinderhirn gewonnenem Kephalin und 200 ml dest. Wasser wurde unter stetem Rühren NaOH 1N zugesetzt, bis der pH-Wert auf 7,5 bis 8,0 eingestellt und eine homogene, opaleszierende Suspension

4

entstanden war. Das Volumen dieser wässrigen Suspension wurde mit dest. Wasser auf 250 ml ergänzt. Dann wurden 250 g Propylenglykol und hierauf 500 g Adipinsäuredibutylester zugesetzt. Diese Mischung wurde in einem Homogenisator zu einer stabilen Emulsion verarbeitet. 20 g dieser Emulsion wurden nach Zugabe einer geeigneten Menge Parfümöl mit 980 g wässrigem 60%igem Äthanol verdünnt. Man erhielt auf diese Weise ein Rasierwasser, welches auf die verletzte Gesichtshaut eine rasche blutstillende Wirkung ausübte.

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65