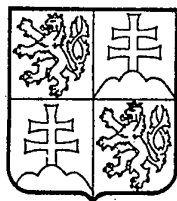


ČESKÁ A SLOVENSKÁ
FEDERATIVNÍ
REPUBLIKA
(19)



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

274 298

(11)

(13) B2

(51) Int. Cl.⁵
A 61 K 7/42

(21) PV 1901-88.H
(22) Přihlášeno 23 03 88

(40) Zveřejněno 12 09 90
(45) Vydáno 08 07 92

(72) Autor vynálezu JUHOS TIBOR ing., PÁL VERONIKA,
WLADIMIR ÉVA ing., KRISTÓF ILONA,
EMRI ZSUZSANNA dr., PAPP GABRIELLA,
VARGA GSABA, DEBRECEN (HU)

(73) Majitel patentu BIOGAL GYÓGYSZERGYÁR DEBRECEN (HU)

(54) Kosmetický přípravek

(57) Vynález se týká kosmetického prostředku pro ochranu proti účinkům ultrafialového záření s obsahem kosmetických nosičů, plnidel a pomocných látek, popřípadě 2-ethylhexylesteru kyseliny p-dimethylaminobenzoové. Jako účinnou složku obsahuje vodně alkoholický extrakt z květů černého bezu (*Sambucus nigra*).

Vynález se týká kosmetických preparátů pro ochranu proti světlu a péči o kůži obličej a těla a způsobu výroby těchto preparátů.

Kosmetika obsahující přírodní a syntetické účinné látky, které jsou k dostání v obchodě ve velkém výběru, slouží v první řadě k tomu, aby regenerovaly hladkost a jemnost kůže a kůži vrátily její původní přirozený stav. Podstatně méně je kosmetických preparátů, které kromě účinku, týkajícího se péče vykazující i vlastnosti ochrany proti světlu.

Změny kůže vyvolané světlem jsou velmi rozdílné. Symptomy sahají od z kosmetického hlediska nepříjemných pigmentových skvrn (jaterní skvrny, pihy) přes více méně těžké procesy zánětu normální nebo jen na sluneční svit citlivé kůže až k potížím lidí trpících potížemi fotodermatózy. Kauzální terapie těchto nemocí neexistuje. V první řadě je zde snaha chránit kůži před světlem, což v nejčastějších případech znamená zevní ošetřování.

Jak pigmentové skvrny, tak i patologické procesy jsou vyvolávány v první řadě paprsky patřícími do β -oblasti ultrafialového světla (vlnové délky 290 až 310 nm) a z části zářením α -oblasti (vlnové délky 315 až 400 nm). Za nejnebezpečnější platí oblast 280 až 320 nm (New. Scien., 31,228, 1969). S ohledem na to je nutné, aby absorpční schopnost skutečně dobré látky sloužící k ochraně před světlem musí pokrývat široký rozsah vlnových délek.

Co se týká velkého počtu sloučenin vyplývá, že tyto jsou schopné absorbovat světlo z největší části v β -oblasti UV-záření (Derm. Wochen. 52,313, 1966). Mnohem méně je látek, které jsou účinné i v α -oblasti.

Látky absorbující v β -oblasti UV-záření, které pohloují paprsky vyvolávající pigmentaci, jsou v první řadě kosmetické světelné filtry, zatím co látky účinné v α -oblasti vykazují i terapeutický účinek.

Při vlastních pokusech se hledaly přírodně se vyskytující účinné látky rostlinného původu, které jsou snadno přístupné a levné, přispívající k pěstování kůže a vykazují vhodné světlo absorbující vlastnosti.

Nyní bylo zjištěno, že se pro uvedený účel hodí velmi dobře extrakt bezových květů. Černý bez (Sambucus nigra) patřící zimolezovitých (Caprifoliaceae) je známá léčivá rostlina, jejíž bobule a květy se již dlouho používají pro přípravu léčivých čajů (Rápöti-Romvári: Gyógito növények) = léčivé rostliny (Medicine Verlag Budapest 1969, s. 77). Pro své příjemně vonící, dobře chutnající aromatické látky se hodí i pro výrobu a aromatizování poživatin, občerstvujících nápojů a vína (DE-PS 2 031 145).

Malé, žlutobílé, příjemně vonící květy černého bezu jsou mimořádně bohaté na biologicky účinné látky, etherické oleje a aromatické látky (Planta medica 31, 365 až 370, 1983).

Květy černého bezu obsahují - vedle etherických olejů propůjčujících jim příjemnou vůni, jako například linalool, geraniol, eugenol, ester kyseliny pelargonové atd., - i četné biologicky důležité sloučeniny, které s ohledem na jejich příznivý účinek na kůži se hodí pro výrobu kosmetických preparátů.

Kromě jiných je nutné se zmínit o:
cholinu a rutinu, dvou sloučeninách charakteru vitamínů,
cholesterinu, stigmasterinu a sitosterinu, přirozených složek kůže, které nachází i v průmyslu kosmetiky užiti jako přirozené emulgátory,
polysacharidech s účinkem zabraňujícím zánětům,
methylalicylátu, který také působí protizánětlivě,
emulsinu, enzymu,

sambunigrinu, glykosidu, který hraje důležitou roli při regeneraci kůže (epidermis).

Květy černého bezu obsahují kromě toho i sloučeniny s antiseptickým účinkem, například karvakrol a thymol. Thymol je o řád účinnější proti bakteriím vyvolávajícím hnisavý proces než fenol a vykazuje nadto účinek usmrcující houby a zabranující žluknutí tuků. Dalšími složkami květů černého bezu o kterých je žádoucí se z kosmetického hlediska zmínit je tanin, katechin a jiné třísloviny, které působí na kůži adstringentně, dále estery vyšších karboxylových kyselin a pryskyřice, které tvoří na kůži přirozený ochranný film.

Jak ukázala vlastní měření, extrakt květů černého bezu absorbuje světlo v oblasti vlnových délek 200 až 360 nm. Tento interval je dostatečně široký k tomu, aby kosmetický preparát, obsahující tento extrakt byl účinný nejen v oblasti β UV-záření, nýbrž i částečně v α -oblasti.

Ochranný účinek extraktu květů černého bezu proti světlu lze v první řadě odvozovat od světlo absorbujících vlastností v tomto obsažených derivátů kumarinu, methylsalicylátu a quercetinu.

7-alkoholkumariny, jejichž absorpční maximum se pohybuje okolo 370 nm, jsou nejdéle známé látky rostlinného původu absorbující světlo. Také ochranný účinek methylsalicylátu vůči světlu je již dlouho znám (US-PS 2 435 055). Quercetin má kromě účinku absorbujícího světlo ještě antioxidační účinek, což má význam vzhledem ke stabilizaci preparátu.

Vynálezem je tedy kosmetický prostředek pro ochranu proti účinkům ultrafialového záření s obsahem kosmetických nosičů, plnidel a pomocných látek, popřípadě 2-ethylhexylesteru kyseliny p-dimethylaminobenzoové, jehož podstata spočívá v tom, že obsahuje jako účinnou složku vodně alkoholický extrakt z květů černého bezu (*Sambucus nigra*).

Květy černého bezu se extrahují vodou nebo vodným roztokem alkoholu a získaný extrakt se homogenizuje s nosiči a plnidly nezávadnými pro kůži a popřípadě s 2 až 10 % hmot. 2-ethylhexylesteru kyseliny p-dimethylaminobenzoové.

Extrakce květů černého bezu se provádí máčením při 15 až 50 °C. Dále je výhodné používat extrakční činidlo (vodu nebo vodný alkohol) vztaženo na květy černého bezu v 3 až 10násobném množství. Jako extrakční činidlo je výhodný max. obj. 40 %, s výhodou 10 až 20% alkohol, zejména ethylalkohol. Konečně může být výhodné, provádět extrakci v přítomnosti, vztaženo na hmotnost extrakčního činidla, 5 až 10 % hmot. cukru, zejména sorbitu.

Vynález bude dále blíže vysvětlen. Nasbírané a popřípadě usušené květy černého bezu se extrahují za šetrných podmínek, například tím, že se květy nechají máčet při 40 až 50 °C po dobu 24 hodin nebo při 20 až 25 °C 48 hodin v extrakčním činidle nebo se várka 6 až 8 hodin míchá.

S výhodou se extrakční činidlo používá, vztaženo na hmotnost květů, 3 až 10násobné množství (počítáno na sušené květy). Přísada 5 až 10 % hmot. cukru, zejména sorbitu, zlepšuje účinnost extrakce. Po extrakci se rostlinné části odstraní filtrací. Extrakt se může ihned používat nebo se může uskladnit při 5 až 10 °C. Při této teplotě je extrakt prakticky trvanlivý bez omezení.

Pro výrobu kosmetického preparátu se extrakt homogenizuje například se 4 až 5násobným množstvím plniv a nosičů, zředovadel atd. Množství a druh plniv a nosičů závisí na obsahu alkoholu v extraktu a na druhu preparátu, který se vyrábí (krém na obličej, opalovací mléko, hydratační prostředek).

Světloabsorbující účinek extraktu květů černého bezu lze výhodně ovlivnit přísadou 2-ethylhexylesteru kyseliny p-dimethylaminobenzoové, a proto se preparát může doplnit 2 až 20 % hmot. této sloučeniny. Okamžité množství závisí na typu kůže (nor-

mální, citlivá atd.) a typu kosmetiky (krém na obličej, prostředek pro pěstování těla, opalovací mléko).

Vynález je dále blíže vysvětlen následujícími příklady.

Příklad 1

300 g sušených květů černého bezu se namáčí v deionizované vodě, která obsahuje 50 g sorbitu, při 20 až 25 °C 48 hodin. Potom se květy odstraní filtračí a roztok se použije jako účinná látka.

Příklad 2

300 g sušených květů černého bezu se míchá při 40 až 45 °C 6 hodin ve 3 litrech deionizované vody, která obsahuje 50 g sorbitu. Várka se ochladí na 20 až 25 °C a filtrát se použije jako účinná látka.

Příklad 3

300 g sušených květů černého bezu se namáčí při 40 až 45 °C po dobu 24 hodin v 1 litru deionizované vody, která obsahuje 100 g fruktózy. Várka se ochladí na 20 až 25 °C, zfiltruje a filtrát se použije jako účinná látka.

Příklad 4

300 g sušených květů černého bezu se míchá 6 hodin při 15 až 20 °C ve směsi sestávající ze 1 350 ml vody a 150 ml ethylalkoholu, která obsahuje 75 g sorbitu. Várka se zfiltruje a filtrát se použije jako účinná látka.

Příklad 5

300 g sušených květů černého bezu se namáčí 48 hodin při 15 až 20 °C ve směsi, sestávající ze 650 ml vody a 350 ml ethylalkoholu, která obsahuje 80 g sorbitu. Po zfiltrování se filtrát použije jako účinná látka.

Příklad 6

Krém na obličej

Složení: extrakt květů černého bezu	61 g
hydromyristenol	10 g
glykolstearát (Emulsan MD)	10 g
cetearyloktanoát	3 g
sorbitanseskvioleát	5 g
směs triglycerinesteru kyseliny kapronové a kaprylové	5 g

Uvedené složky se s výjimkou účinné látky (extraktu květů černého bezu) naváží do nerezové nádoby a míchají na vodní lázni při 65 až 70 °C tak dlouho, až vznikne homogenní tavenina. Tavenina se pozvolna ochladí na 45 až 50 °C, potom se přidá odpovídající množství extraktu květů černého bezu (podle jednoho z příkladů 1 až 3).

Za dalšího míchání se směs ochladí na 25 °C a potom se homogenizuje s roztokem 0,015 g propyl-p-oxybenzoátu a 0,035 g methyl-p-oxybenzoátu v 0,95 g ethanolu. Na konec se přidá 5 g polyoxyethylen-(100)-stearátu, jakož i vonné látky.

Příklad 7

Krém na obličej II

Složení: extrakt květů z černého bezu	59 g
hydromirestenol	10 g
glykolstearát (Emulsen MD)	10 g
cetearyloktanoát	3 g
sorbitanseskvioléat	5 g
směs triglycerinesteru kyseliny kapronové a kaprylové	5 g

Uvedené složky se smíchají způsobem popsáním v příkladu 6, avšak jako účinná látka se použije extrakt květů černého bezu podle příkladu 4 nebo 5. K preparátu se přidají 2 g 2-ethylhexylesteru kyseliny p-dimethylaminobenzoové.

Příklad 8

Lotion pro péči o tělo

Složení: extrakt květů černého bezu	95 g
polyethylenglykolový derivát hydrogenovaného ricinového oleje	6 g
mikrokrystalický vosk	2 g
hydrogenovaný polyisobuten	15 g
směs triglycerinesteru kyseliny kapronové a kaprylové	5 g

Uvedené složky se s výjimkou extraktu květů černého bezu navážejí do nerezové nádoby a navzájem smísí na vodní lázni při 65 až 70 °C. Tavenina se pozvolna ochladí na 45 až 50 °C, potom se přidá odpovídající množství extraktu vyrobeného podle příkladu 3. Po přidávku 5 g 2-ethylhexylesteru kyseliny p-dimethylaminobenzoové se směs ochladí za stálého míchání na 25 °C. Nakonec se přidá 3 g propylenglykolu, 0,5 g heptahydrátu síranu hořečnatého a aromatické látky a směs se homogenizuje.

Příklad 9

Mléko na opalování

Složení: extrakt květů z černého bezu	90 g
směs sterolů, alifatických alkoholů a uhlovodíků (protegyn)	24 g
směs triglycerinu kyseliny kapronové a kaprylové	5 g

Složky se navzájem spolu smísí. Při 40 až 45 ° se zhomogenizuje odpovídající množství extraktu (podle jednoho z příkladů 1 až 5), jakož 10 g 2-ethylhexylesteru kyseliny p-dimethylaminobenzoové. Směs se ochladí na 20 až 25 °C a homogenizuje s aromatickými látkami.

Popsané kosmetické preparáty byly podrobeny testům. Při tom byly zjištěny následující výsledky.

Lotion na opalování č. 1

Složení: emulzní základ	100 hmot. dílů
extrakt z květů z černého bezu	5 hmot. dílů

Kontrolní směs - lotion na opalování č. 2 měla stejné složení jako předchozí směs s tím rozdílem, že neobsahovala extrakt z květů černého bezu podle vynálezu.

Lotion na opalování č. 2 měla následující složení:

Složení: emulzní základ	100 hmot. dílů
-------------------------	----------------

Kontrolní směs pro lotion na opalování č. 3 měla stejné složení jako směs č. 1 s tím rozdílem, že kromě extraktu z květů černého bezu obsahovala ještě 5 hmot. dílů Arlatonu 507.

Směs pro lotion na opalování č. 3 měla následující složení:

Složení: emulzní základ	100 hmot. dílů
extrakt z květů černého bezu	5 hmot. dílů
Arlaton 507	5 hmot. dílů

Arlaton 507 je chemicky 2-ethylhexyl-p-dimethylaminobenzoan, což je v oleji rozpustná látka s ochrannými účinky proti působení světla, vyrobená ICI Americas Inc., které lze vhodně užívat do emulzí, vodně alkoholických roztoků a suchých systémů.

Směs pro lotion na opalování č. 4 měla stejné složení jako směs č. 2 s tím rozdílem, že kromě emulzního základu obsahovala ještě přídavek Arlatonu 507.

Směs pro lotion na opalování č. 4 měla následující složení:

Složení: emulzní základ	100 hmot. dílů
Arlaton 507	5 hmot. dílů

Během testů pacienti nedostávali jiné léky ani nebyli ošetřováni jiným způsobem.

Na přesně označené části kůže zadku každého pacienta byly aplikovány lotiony č. 1, 2, 3 a 4. Byly provedeny kožní testy, zkoušky ochranného působení proti účinkům světla a byl určován ochranný faktor proti působení světla.

Na zadku každého pacienta byla určována minimální erytemální dávka (MED) pomocí vysokotlaké křemíkové lampy (Medicor Q 243).

Každá lotion byla nanesena na jinou část kůže zadku pacienta a znovu byla měřena hodnota MED. Ochranný faktor (PF) proti působení světla byl vyjádřen jako poměr těchto dvou hodnot:

$$PF = \frac{\text{MED v přítomnosti lotion}}{\text{MED bez přítomnosti lotion}}$$

Zkoušky ochranného působení proti účinkům světla podle Epsteinovy metody byly prováděny nanesením každé lotion na přesně označená místa na kůži zadku. Po 24 hodinách byla tato místa u každého pacienta ozářena individuální suberytemickou světelnou dávkou. Test byl vyhodnocován 24, 48 a 72 hodin po ozáření.

Byly získány následující výsledky:

Kožní testy a zkoušky ochranného účinku proti působení světla byly u všech pacientů a pro každou lotion negativní.

Ochranné faktory měly následující hodnotu:

Lotion č.	PF
1	7,8 (6 až 11)

Lotion č.	FF
2	6,7 (6 až 12)
3	15,5 (9 až 17)
4	7,3 (6 až 11)

Ochranný faktor emulze, obsahující pouze extrakt z květů černého bezu přidáný k emulznímu základu byl tedy vyšší, než ochranný faktor u lotion obsahující známou přísadu s ochranným účinkem proti působení světla - Arlaton 507. Nejlepších výsledků bylo dosaženo, když se obě přísady s ochranným účinkem proti působení světla zkombinovaly.

Bylo prokázáno, že v případě, kdy se preparát používá delší dobu, působí tento příznivě na kůži a na regeneraci kůže a hojí malé zánětlivé procesy. Polysacharidy, přecházející ve vodě za botnání do roztoku, ovlivňují také vodní hospodářství kůže a zvyšují schopnost buněk přijímat vodu. Tím zvětší objem zrohovatělých buněk a zmizí vrásky.

Preparáty obsahující extrakt květů černého bezu podle vynálezu, sloužící v kosmetice, mají světloabsorbující účinek v rozsahu vlnových délek 200 až 360 nm a chrání tak kůži před UF-paprsky vyvolávajícími erythem (zarudnutí kůže) a odfiltrovávají také část paprsků vyvolávajících hnědnutí. Používání preparátů podle vynálezu od jara do pozdního podzimu zabráňuje tvorbě pih a jaterních skvrn.

P Ř E D M Ě T V Y N Á L E Z U

Kosmetický prostředek pro ochranu proti účinkům ultrafialového záření s obsahem kosmetických nosičů, plnidel a pomocných látek, popřípadě 2-ethylhexylesteru kyseliny p-dimethylaminobenzoové, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje vodně alkoholický extrakt z květů černého bezu (*Sambucus nigra*).