

LEBENSMITTELCHEMISCHE GESELLSCHAFT

- Fachgruppe in der GESELLSCHAFT DEUTSCHER CHEMIKER -
Arbeitsgruppe Kosmetische Mittel

Datenblätter zur Bewertung der Wirksamkeit von Wirkstoffen in kosmetischen Mitteln

Vitamin C

1. Begriffsbestimmung

Vitamin C ist der Trivialname für Ascorbinsäure ((R)-5-[(S)-1,2-Dihydroxyethyl]-3,4-dihydroxy-5H-furan-2-on) und deren Derivate, die qualitativ die biologische Wirkung von L-Ascorbinsäure entfalten [1].

2. Häufig eingesetzte Wirkstoff-Formen

Als kosmetische Wirkstoffe werden sowohl Ascorbinsäure als auch die stabileren Ascorbinsäureester eingesetzt.

Trivialname	INCI – Bezeichnung	CAS-Nummer
Ascorbinsäure	Ascorbic Acid	50-81-7
Natriumascorbylphosphat	Sodium Ascorbyl Phosphate	66170-10-3
Magnesiumascorbylphosphat	Magnesium Ascorbyl Phosphate	114040-31-2
Ascorbylglucosid	Ascorbyl Glucoside	129499-78-1
Ascorbylpalmitat	Ascorbyl Palmitate	137-66-6
Ascorbyldipalmitat	Ascorbyl Dipalmitate	28474-90-0
Ascorbyltetraisopalmitat	Ascorbyl Tetraisopalmitate	183476-82-6

3. Anwendung als Antioxidans

Ascorbylpalmitat und Ascorbyldipalmitat werden in kosmetischen Produkten überwiegend als Antioxidans zur Erhöhung der Stabilität der Formulierung und somit zum Produktschutz eingesetzt; die Einsatzkonzentrationen liegen zwischen 0,01 und 0,2 % [2].

4. Eigenschaften als kosmetischer Wirkstoff

4.1 Hautpenetration und Freisetzung

Durch ihre hohe chemische und metabolische Aktivität reagiert Ascorbinsäure bereits in der äußersten Hautschicht und erreicht daher tiefere Schichten nur in geringen Mengen. Die Freisetzung von Ascorbinsäure aus einer O/W – Emulsion erfolgt deutlich schneller als aus einer W/O – Emulsion [4].

Die Ester Natrium- und Magnesiumascorbylphosphat sowie Ascorbylglucosid penetrieren durch die Hornschicht und werden teilweise enzymatisch zu Ascorbinsäure gespalten [3], [19].

Die percutane Absorption der Ascorbylphosphate erfolgt im Vergleich zu Ascorbyl-glucosid schneller; Ascorbylglucosid wird jedoch kontinuierlicher aufgenommen [18].

Die Ascorbylpalmitat-Derivate penetrieren aufgrund ihres lipophilen Charakters gegenüber den hydrophilen Ascorbylphosphatsalzen wesentlich leichter [20]; in der Haut wird ebenfalls die physiologisch wirksame Ascorbinsäure freigesetzt.

4.2 Stabilität

Ascorbinsäure reagiert in wässriger Lösung empfindlich gegen Sauerstoff und Oxidationsmittel. Der Abbau von Ascorbinsäure kann zur Braunfärbung von Emulsionen führen [15], [16].

Um ascorbinsäurehaltige, wässrige Zubereitungen zu stabilisieren, sollte die Verpackung luftdicht sein, die Wasseraktivität der Formulierung gesenkt, der pH-Wert kontrolliert und effektive Chelatbildner zugesetzt werden [4], [5], [16].

Natrium- und Magnesiumascorbylphosphat sind stabil in wässrigen Formulierungen mit pH größer 7 [7], [8], [9].

Vitamin C-Derivate in Form von Phosphat- oder Glucosidestern zeigen eine deutlich höhere Stabilität im Vergleich zur Ascorbinsäure; haben jedoch eine geringere Bioverfügbarkeit [5].

Ascorbylpalmitat weist gegenüber den Ascorbylphosphatsalzen eine wesentlich geringere Stabilität auf; diese kann durch Optimierung der Formulierung erhöht werden [20]. Das gleichfalls öllösliche Ascorbyltetraisopalmitat zeigt gegenüber Ascorbylpalmitat und -dipalmitat in Formulierungen mit einem pH-Wert bis 6,0 eine gute Stabilität.

4.3 Beschriebene kosmetische Wirkungen

- **Faltenreduzierung und Erhöhung der Hautreliefdichte** [4], [5], [14], [18]
und Verbesserung chronisch lichtgeschädigter Haut
 - aufgrund der Stimulierung der Collagensynthese [5], [10], [11], [12], [13], [19]
 - Verstärkung der Dermis-Epidermis-Verbindung (Papillen-Index) [4]
- **Schutz vor lichtbedingter und oxidativer Hautalterung** [4], [5], [14], [18]
 - aufgrund antioxidativer Wirkung :
 - Inhibierung der Lipidperoxidation [3], [5], [7]
 - Unterdrückung von reaktiven Sauerstoffspezies (ROS) [7]

- **Aufhellende, bleichende Wirkung** bei normaler Haut und Pigmentflecken
 - aufgrund der Inhibierung der Tyrosinase-Aktivität [7], [15], [17],[18]
- **Antibakterielle Wirkung**
 - Inhibierung von schweißzersetzenden Bakterien [6]
 - Inhibierung von akneverursachenden Bakterien [7]

5. In der Literatur beschriebene Einsatz- und Wirkkonzentrationen

5.1 Einsatzempfehlungen:

Folgende Einsatzkonzentrationen werden empfohlen bzw. beschrieben:

für Natrium- und Magnesiumascorbylphosphat [8; Firmenschriften]

Vitamin – Formulierungen für die tägliche Hautpflege:	0,2 – 2 %
Sonnenschutzmittel:	0,2 – 1 %
Hautbleichungsmittel:	3 - 5 %

für Ascorbylpalmitat [2]

Hautbleichungsmittel:	bis 4 %
-----------------------	---------

für Ascorbyltetraisopalmitat [Firmenschrift]

Vitamin – Formulierungen für die tägliche Hautpflege:	1,0 %
Anti-Aging-Formulierung:	1,0 %

5.2 Wirkkonzentrationen:

Belegbare Wirkung	Substanz	Wirkkonzentration
Anti-Age-Effekte/ Hautregeneration: Faltenreduzierung von (licht)gealterter Haut Erhöhung der Hautreliefdicke Verstärkung der Dermis-Epidermis-Verbindung (Papillen-Index)	Ascorbinsäure	5 % [14] [5] 3 % [4] 10 % [14]
	Ascorbinsäure Ascorbinsäure	5 % [14] 3 % [4]
Schutz vor UV-induzierten Hautschäden	Ascorbinsäure	3 % [4]
	Natriumascorbylphosphat + 2,5 % Vitamin E-Acetat	2 % [7]
	Natriumascorbylphosphat Ascorbylglucosid	0,5 – 1 % [3] 2 % [18]
Hautbleichende Wirkung	Magnesiumascorbyl-phosphat	3 % [17] [21]
	Natriumascorbylphosphat + 1 % Vitamin E-acetat	3 % [7]
	Ascorbinsäure + 8,8% L(+) Milchsäure	1 % [15]
Antibakterielle Wirkung: reduziert Schweißgeruch verbessert Hautbild bei Hautunreinheiten und Akne	Natriumascorbylphosphat	0,2 % [6]
	Natriumascorbylphosphat	5 % [7]

Hinweis: Die allgemeinen Hinweise und Empfehlungen dieser Datenblattreihe sind ebenso zu berücksichtigen wie die derzeit gültigen Rechtsnormen.

6. Literatur

- [1] www.wissenschaft-online.de/abo/lexikon/ern/754
- [2] CIR: Final Report on Safty Assessment of Ascorbyl Palmitate, Ascorbyl Dipalmitate, Acorbyl Stearate, Erythorbic Acid and Sodium Erythorbate
International Journal of Toxicology **18** (1999) 3, 1-26
- [3] Streicher, H.; Trentmann, B. (BASF AG): A stable vitamin C derivate for sophisticated skin protection, penetrates into deeper skin layers, protects against free radical injury: Ascorbyl Phosphate. XXI. IFSCC International Congress 2000, Berlin
- [4] Raschke, T. et al: Topical Activity of Ascorbic Acid: From in vitro Optimization to in vivo Efficacy. Skin Pharmacology and Physiology **17** (2004), 200-206
- [5] Thormahlen, S.: Vitamins in Cosmetic Formulations – A new Generation of Products. XXI. IFSCC International Congress 2000, Berlin
- [6] Jermann, R.: Vitamin C in Skin Care Cosmetics. Cosma **7** (2004), 42ff.
- [7] Klock, J.: Sodium Ascorbyl Phosphate still has Unexploited Potential in Cosmetics. SFÖW-Journal **130** (2004) 7, 46-56
- [8] Trentmann, B. et al (BASF Aktiengesellschaft): A stable vitamin C derivate for sophisticated skin care formulations with proven effects against free radical injury and for efficient skin whitening. XX. IFSCC Congress 1998, Cannes
- [9] Maia Campos, P.M.B.G.; Mara Silva, G.: Ascorbic Acid and Its Derivatives in Cosmetic Formulations. Cosmetics and Toiletries **115** (2000) 6, 59-62
- [10] Geesin, J. C. et al: Ascorbic Acid specifically increases type I and type III procollagen messenger RNA levels in human skin fibroblasts. Journal Investigative Dermatology **90** (1988) 4, 420-424
- [11] Boyera, N. et al: Effect on vitamin C and its derivates on collagen synthesis and cross-linking by normal human fibroblasts. International Journal of Cosmetic Science **20** (1998), 151 – 158
- [12] Geesin, J.C. et al: Regulation of Collagen Synthesis in Human Dermal Fibroblasts by the Sodium and Magnesium Salts of Ascorbyl-2-Phosphate. Skin Pharmacology **6** (1993), 65-71
- [13] Nusgens, B.V. et al: Topically applied Vitamin C Enhances the mRNA Level of Collagens I and III, Their Processing Enzymes and Tissue Inhibitor of Matrix Metalloproteinase 1 in the Human Dermis. Journal of Investigative Dermatology **116** (2001) 6, 853-859
- [14] Humbert et al: Topical ascorbic acid on photoaged skin. Experimental Dermatology **12** (2003), 237–244
- [15] Smith, W. P.: The effects of topical L(+) lactic acid and ascorbic acid on skin whitening. International Journal of Cosmetic Science **21** (1999), 33 – 40
- [16] Lee, J. S. et al: The stabilization of L-ascorbic acid in aqueous solution and water-in-oil-in-water double emulsion by controlling pH and electrolyte concentration. Journal of Cosmetic Science **55** (2004), 1–12
- [17] Kawada, A. et al: A new approach to the evaluation of whitening effect of a cosmetic using computer analysis of video-captured image. Journal of Dermatology **29** (2002), 10–18
- [18] Kumano, Y. et al: In Vitro and in Vivo Prolonged Biologica Activities of Novel Vitamin C Derivate, 2-O- α -D-Glucopyranosyl-L-Ascorbic Acid (AA-2G), in Cosmetics Fields. J. Nutr. Sci. Vitaminol. **44** (1989), 345-359
- [19] Kumano, Y. et al: Enhancing effect of 2-O-alpha-D-Glucopyranosyl-L-ascorbic acid, a stable ascorbic acid derivate, on Collagen synthesis. Biol.Pharm.Bull. **21** (1998), 662-666
- [20] Spiclin, P. et al: Stability of ascorbyl palmitate in topical microemulsions. International Journal of Pharmaceutics **222** (2001), 271-279
- [21] Miyamoto, K. et al: Utilization of a high-resolution digital imaging system for the objective and quantitative assessment of hyperpigmented spots on the face. Skin Research and Technology **8** (2002), 73-77