

명세서

발명의 명칭: 피부 방어력 증진용 조성물

기술분야

- [1] 본 발명은 피부 방어력 증진용 조성물에 관한 것이다.

배경기술

- [2] 지금까지 피부 여드름이나 트러블을 예방하고 개선하고자 하는 경우, 스스로 항균력을 가지는 티트리 오일, 살리실산, 트리클로산, 과일산 등을 사용해 왔다. 그러나 이러한 물질들은 항균력을 나타내는 만큼 피부에도 자극을 줄 우려가 있어 실제 효능을 나타낼 수 있는 농도로 사용하기가 어렵고 제도적으로도 그 사용 농도가 제한되어 있어 실질적인 효과를 얻기가 쉽지 않다. 따라서 피부에 자극을 주지 않으면서도 우수한 피부 항균 및 항염 효과를 나타내는 물질의 개발이 필요하다.

발명의 상세한 설명

기술적 과제

- [3] 본 발명은 피부 방어력을 증진시킬 수 있는 조성물을 제공하고자 한다.

과제 해결 수단

- [4] 본 발명의 일측면은 프로토파낙사디올(*Protopanaxadiol*)계 화합물 및 비자(*Torreya nucifera*) 추출물 중 하나 이상을 유효 성분으로 포함하는 피부 방어력 증진용 조성물을 제공한다.
- [5] 본 발명의 다른 일측면은 프로토파낙사디올계 화합물과 비자 추출물 중 하나 이상; 및 에피갈로카테킨 갈레이트를 유효 성분으로 포함하는 피부 방어력 증진용 조성물을 제공한다.

발명의 효과

- [6] 본 발명에 따른 조성물은 프로토파낙사디올계 화합물 및 비자 추출물 중 하나 이상; 및 선택적으로 에피갈로카테킨 갈레이트를 포함함으로써, 피부의 항균 펩타이드 활성을 촉진하여 피부에 자극을 주지 않으면서도 피부 스스로의 방어력을 증진시켜 우수한 피부 항균 및 항염 활성을 나타낼 수 있다.

도면의 간단한 설명

- [7] 도 1은 화합물 K, 비자씨 오일, 에피갈로카테킨 갈레이트 및 이들과 혼합물과 티트리 오일이 각각 피부 항균 펩타이드 발현에 미치는 효과를 비교한 그래프이다.

발명의 실시를 위한 최선의 형태

- [8] 본 명세서에서 "피부"라 함은, 동물의 체표를 덮는 조직을 의미하는 것으로서, 얼굴 또는 바디 등의 체표를 덮는 조직뿐만 아니라, 두피와 모발을 포함하는 최광의의 개념이다. 본 명세서에서 "추출물"은 추출 방법, 추출 용매, 추출된

성분 또는 추출물의 형태를 불문하고, 천연물의 성분을 뽑아냄으로써 얻어진 물질을 모두 포함하는 광범위한 개념으로, 천연물에서 추출한 오일 성분을 예로 들 수 있다. 본 명세서에서, "피부 방어력"은 외부의 자극, 독소로부터 피부를 보호하는 능력으로, 상기 자극은 세균, 바이러스, 자외선, 건조함, 상처 등 피부에 유해한 자극을 모두 포함하는 광범위한 개념이다.

[9]

[10]

[11] 이하, 본 발명을 보다 상세하게 설명한다.

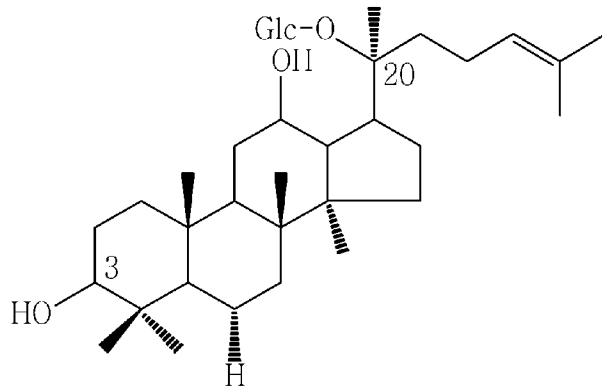
[12] 피부는 세균이 침입하면 스스로 항균 펩타이드를 분비함으로써 자체적으로 세균에 대항한다. 따라서 피부의 항균 펩타이드 활성을 촉진하는 물질은 피부에 자극을 주지 않으면서도 피부 자체의 방어력을 증진시켜 피부의 항균 및 항염 활성을 증진시킬 수 있을 것이다.

[13] 본 발명의 일측면은 프로토파낙사디올계 화합물 및 비자 추출물 중 하나 이상을 유효 성분으로 포함하는 피부 방어력 증진용 조성물을 제공한다. 프로토파낙사디올계 화합물 또는 비자 추출물은 피부의 항균 펩타이드 발현을 촉진하여 피부 방어력을 증진시킬 수 있다. 따라서, 프로토파낙사디올계 화합물 및 비자 추출물 중 하나 이상을 포함하는 조성물은 피부 방어력, 구체적으로 피부 항균 및 항염 활성을 증진시킬 수 있으며, 나아가 여드름을 비롯한 피부 트러블을 개선할 수 있다. 본 발명의 일측면에서, 항균 펩타이드는 외부의 자극을 받을 때 발현이 유도되어 침입한 병원균을 억제하는 역할을 하는 펩타이드로, hBD1, hBD2, LL37 또는 Rnase7 등을 대표적인 예로 들 수 있으나 이에 제한되는 것은 아니다.

[14] 본 발명의 일측면에서, 프로토파낙사디올(Protopanaxadiol)계 화합물은 인삼 사포닌인 진세노사이드(ginsenoside)의 일종이다. 본 발명의 다른 일측면에서, 프로토파낙사디올계 화합물은 인삼, 구체적으로 홍삼을 효소 처리하여 수득할 수 있다. 본 발명의 또 다른 일측면에서, 프로토파낙사디올계 화합물은 화합물 K(compound K)를 포함한다. 화합물 K는 진세노사이드 M1이라고도 불리우는 20-O-(베타-D-글루코피라노실)-20(S)-프로토파낙사디올(20-O-(beta-D-glucopyranosyl)-20(S)-protopanaxadiol)의 화학식을 가지는 화합물로 아래와 같은 화학식으로 나타내어질 수 있다.

[15] [화학식 1]

[16]



- [17] 본 발명의 일측면에 따른 조성물은 조성물 전체 중량을 기준으로 0.001 중량% 내지 10 중량%, 구체적으로 0.01 중량% 내지 5 중량%, 더 구체적으로 0.1 중량% 내지 3 중량%의 프로토파낙사디올계 화합물을 포함할 수 있다. 상기 범위로 포함하는 경우 본 발명의 의도한 효과를 나타내기에 적절할 뿐만 아니라, 조성물의 안정성 및 안전성을 모두 만족할 수 있으며, 비용 대비 효과의 측면에서도 상기 범위로 포함하는 것이 적절할 수 있다. 구체적으로 조성물이 프로토파낙사디올계 화합물을 0.001 중량% 미만으로 포함하는 경우 피부 방어력 증진 효과가 미미할 수 있으며, 10 중량%를 초과하여 포함하는 경우 프로토파낙사디올계 화합물의 용매에 대한 용해도가 낮아져 조성물의 안정성이 저하될 수 있다.
- [18] 본 발명의 일측면에서, 비자 추출물은 비자 나무(*Torreya nucifera*)의 열매인 비자의 추출물, 구체적으로 비자씨의 추출물을 포함한다. 본 발명의 다른 일측면에서, 비자 추출물은 비자를 압착하거나 유기 용매로 추출하여 얻은 유지 성분인 비자 오일, 구체적으로 비자씨 오일을 포함한다. 상기에서 유기 용매는 알코올, 헥산, 아세톤, 에틸아세테이트, 디에틸에테르, 에틸메틸케톤 및 클로로포름으로 이루어진 군에서 선택된 하나 이상을 포함하나, 이에 제한되는 것은 아니다.
- [19] 본 발명의 일측면에서, 조성물은 조성물 전체 중량을 기준으로 0.001 중량% 내지 99 중량%, 구체적으로 0.1 중량% 내지 80 중량%, 더 구체적으로 10 내지 50 중량%의 비자 추출물을 포함할 수 있다. 상기 범위로 포함하는 경우 본 발명의 의도한 효과를 나타내기에 적절할 뿐만 아니라, 조성물의 안정성 및 안전성을 모두 만족할 수 있으며, 비용 대비 효과의 측면에서도 상기 범위로 포함하는 것이 적절할 수 있다. 구체적으로 조성물이 비자 추출물을 0.001 중량% 미만으로 포함하는 경우 피부 방어력 증진 효과가 미미할 수 있다.
- [20] 본 발명의 일측면에 따른 피부 방어력 증진용 조성물은 에피갈로카테킨 갈레이트(Epigallocatechin Gallate)를 더 포함할 수 있다. 본 발명에 따른 피부 방어력 증진용 조성물은 에피갈로카테킨 갈레이트를 더 포함함으로써, 보다 높은 피부 항균 및 항염 활성 효과를 가져 더욱 우수한 피부 방어력 증진 효과를

가질 수 있다.

- [21] 본 명세서에서, 에피갈로카테킨 갈레이트(Epigallocatechin Gallate)는 폴리페놀의 일종으로 주로 녹차에 함유되어 있는 카테킨이며, (-)-에피갈로카테킨-3-갈레이트의 화학식으로 나타낼 수 있다. 본 발명의 일측면에서, 에피갈로카테킨 갈레이트는 녹차를 추출하여 수득할 수 있다.
- [22] 본 발명의 일측면에 따른 조성물은 조성물 전체 중량을 기준으로 0.00001 중량% 내지 10 중량%, 구체적으로 0.0001 중량% 내지 5 중량%, 더 구체적으로 0.001 중량% 내지 1 중량%의 에피갈로카테킨 갈레이트를 포함할 수 있다. 상기 범위로 포함하는 경우 본 발명의 의도한 효과를 나타내기에 적절할 뿐만 아니라, 조성물의 안정성 및 안전성을 모두 만족할 수 있으며, 비용 대비 효과의 측면에서도 상기 범위로 포함하는 것이 적절할 수 있다. 구체적으로, 조성물이 에피갈로카테킨 갈레이트를 0.00001 중량% 미만으로 포함하는 경우 피부 방어력 증진 효과가 미미할 수 있으며, 10 중량%를 초과하여 포함하는 경우 산화가 일어나기 쉬워 제형의 안정성을 확보하기 어려울 수 있다.
- [23]
- [24] 본 발명의 일측면은 프로토파낙사디올계 화합물 및 비자 추출물 중 하나 이상; 및 선택적으로 에피갈로카테킨 갈레이트를 유효 성분으로 포함하는 화장료 조성물을 제공한다. 상기 화장료 조성물은 피부 방어력 증진 효과를 나타낼 수 있으며, 구체적으로 우수한 항균 및 항염 활성을 나타낼 수 있고, 나아가 피부 여드름을 비롯한 피부 트러블을 개선 또는 예방할 수 있다.
- [25] 본 발명에 따른 화장료 조성물은 국소 적용에 적합한 모든 제형으로 제공될 수 있다. 예를 들면, 용액, 수상에 유상을 분산시켜 얻은 에멀전, 유상에 수상을 분산시켜 얻은 에멀전, 현탁액, 고체, 젤, 분말, 페이스트, 포말(foam) 또는 에어로졸 조성물의 제형으로 제공될 수 있다. 이러한 제형의 조성물은 당해 분야의 통상적인 방법에 따라 제조될 수 있다.
- [26] 본 발명에 따른 화장료 조성물은 보습제, 에몰리언트제, 계면 활성제, 자외선 흡수제, 방부제, 살균제, 산화 방지제, pH 조정제, 유기 및 무기 안료, 향료, 냉감제 또는 제한(制汗)제를 더 포함할 수 있다. 상기 성분의 배합량은 본 발명의 목적 및 효과를 손상시키지 않는 범위 내에서 당업자가 용이하게 선정 가능하며, 그 배합량은 조성물 전체 중량을 기준으로 0.01 내지 5 중량%, 구체적으로 0.01 내지 3 중량%일 수 있다.
- [27]
- [28] 본 발명의 일측면은 프로토파낙사디올계 화합물 및 비자 추출물 중 하나 이상; 및 선택적으로 에피갈로카테킨 갈레이트를 유효 성분으로 포함하는 약학 조성물을 제공한다. 상기 약학 조성물은 피부 방어력 증진 효과를 나타낼 수 있으며, 구체적으로 우수한 항균 및 항염 활성을 나타낼 수 있고, 나아가 피부 여드름을 비롯한 피부 트러블을 치료 또는 개선할 수 있다.
- [29] 본 발명의 일측면에 따른 약학 조성물은 경구, 비경구, 직장, 국소, 경피, 정맥

내, 근육 내, 복강 내, 피하 등으로 투여될 수 있다.

[30] 경구 투여를 위한 제형은 정제(錠劑), 환제(丸劑), 연질 및 경질 캡셀제, 과립제(顆粒劑), 산제, 세립제, 액제, 유탁제(乳濁濟) 또는 펠렛제일 수 있으나, 이에 제한되는 것은 아니다. 이들 제형은 유효 성분 이외에 희석제(예: 락토오스, 텍스트로오스, 수크로오스, 만니톨, 솔비톨, 셀룰로오스 또는 글리신), 활택제(예: 실리카, 탈크, 스테아르산 또는 폴리에틸렌 글리콜), 또는 결합제(예: 마그네슘 알루미늄 실리케이트, 전분 페이스트, 젤라틴, 트라가칸스, 메틸셀룰로오스, 나트륨 카르복시메틸셀룰로오스 또는 폴리비닐피롤리돈)를 함유할 수 있다. 경우에 따라 붕해제, 흡수제, 착색제, 향미제, 또는 감미제 등의 약제학적 첨가제를 함유할 수 있다. 상기 정제는 통상적인 혼합, 과립화 또는 코팅 방법에 의해 제조될 수 있다.

[31] 비경구 투여를 위한 제제는 주사제, 점적제, 로션, 연고, 겔, 크림, 현탁제, 유제, 좌제(坐劑), 패취 또는 분무제일 수 있으나, 이에 제한되는 것은 아니다.

[32] 본 발명의 일측면에 따른 약학 조성물의 유효 성분은 투여 받을 대상의 연령, 성별, 체중, 병리 상태 및 그 심각도, 투여 경로 또는 처방자의 판단에 따라 달라질 것이다. 이러한 인자에 기초한 적용량 결정은 당업자의 수준 내에 있으며, 이의 1일 투여 용량은 예를 들어 0.1mg/kg/일 내지 100mg/kg/일, 보다 구체적으로는 5 mg/kg/일 내지 50 mg/kg/일이 될 수 있으나, 이에 제한되는 것은 아니다.

[33]

[34] 이하, 실시예 및 실험예를 들어 본 발명의 구성 및 효과를 보다 구체적으로 설명한다. 그러나 아래 실시예 및 실험예는 본 발명에 대한 이해를 돕기 위해 예시의 목적으로만 제공된 것일 뿐 본 발명의 범주 및 범위가 그에 의해 제한되는 것은 아니다.

[35]

[36] [실시예]

[37] 화합물 K는 홍삼을 효소로 가수 분해하여 수득하였다. 비자씨 오일은 비자의 씨를 압착하거나 유기 용매로 추출하여 수득하였다.

[38] 에피갈로카테킨 갈레이트(EGCG)는 다음과 같은 방법으로 수득하였다. 먼저 녹차잎(3% 이하의 건조 수분 함량)을 10배의 정제수로 30~70°C에서 1시간~24시간 동안 열수 환류 추출한 후, 1차 여과하여 잔사를 제거하고 남은 여액을 다시 2차 여과하여 수용성 성분을 분리하였다. 분리한 수용성 성분 중 에피갈로카테킨 갈레이트만을 선별적으로 침전시켜 결정화 반응을 통해 농축시키고 침전되지 않은 여액은 여과로 제거하였다. 침전물을 다시 분해하여 크로마토그래피로 정제하고 용매는 증발시켜 최종적으로 고순도의 에피갈로카테킨 갈레이트를 수득하였다.

[39]

[40] [실험예] 피부 항균 펩타이드 발현 촉진 효과 평가

- [41] 화합물 K, 비자씨 오일, 에피갈로카테킨 갈레이트(EGCG), 화합물 K와 비자씨 오일, 화합물 K, 비자씨 오일과 EGCG, 및 티트리 오일을 각각 각질형성세포주(HaCaT)(Dr. N.E. Fusenig, 독일 암 연구소(Deutsches Krebsforschungszentrum), 하이델베르크, 독일로부터 입수)에 처리하고 24시간 뒤 대표적인 피부 항균 펩타이드인 hBD1, hBD2, LL37 및 Rnase7 유전자 발현 변화를 실시간 PCR로 측정하였다. 무처리군을 기준으로 각 처리군의 유전자 발현 변화 값을 도 1(평균) 및 표 1(평균±표준편차)에 나타내었다.

- [42] 표 1

[Table 1]

	hBD1	hBD2	LL37	Rnase7
무처리군	1	1	1	1
화합물 K	1.200431± 0.117122	1.2501451± 0.060240	1.4266929± 0.478567	1.2435783± 0.065722
비자씨 오일	1.136352± 0.067012	1.119184±0.07 4302	1.209884± 0.175301	1.133979± 0.090271
EGCG	1.124634±0.36 5302	1.120488±0.03 2836	1.91±1.0000078 83	1.158407±0.164 803
화합물 K+비자씨 오일	1.209359±0.09 15457	1.320578±0.16 5871	1.491648±0.365 904	1.310674±0.164 829
화합물 K+비자씨 오일+EGCG	1.277801±0.20 0185	1.351209±0.09 5638	1.59781±0.3608 25	1.899171±0.095 602
티트리 오일	0.762495± 0.153398	0.993401± 0.022563	0.847556± 0.073745	0.919438± 0.127590

- [43] 상기 결과에서 볼 수 있듯이, 화합물 K, 비자씨 오일, 에피갈로카테킨 갈레이트(EGCG), 화합물 K와 비자씨 오일, 화합물 K, 비자씨 오일과 EGCG는 피부 항균 펩타이드 hBD1, hBD2, LL37, Rnase7 유전자 모두의 발현을 증가시키는 반면, 천연에서 유래한 물질 중 항균 화장품에 빈번하게 사용되는 원료인 티트리 오일은 네 가지 유전자의 발현을 모두 억제하였다. 즉, 티트리 오일은 피부 자체의 방어력을 증진시킬 수 없음에 반해, 화합물 K, 비자씨 오일, 에피갈로카테킨 갈레이트(EGCG) 및 이들의 혼합물은 피부 항균 펩타이드를 활성화시켜 피부의 방어력 자체를 증진시킬 수 있음을 알 수 있다.

- [44]

- [45] 본 발명의 일측면에 따른 조성물의 제형예를 아래에서 설명하나, 다른 여러 가지 제형으로도 응용 가능하며, 이는 본 발명을 한정하고자 함이 아닌 단지 구체적으로 설명하고자 함이다.

[46]

[47] [제형에 1] 로션

[48] 아래 표에 기재된 조성으로 통상의 방법에 따라 로션을 제조한다.

[49] 표 2

[Table 2]

성분	함량 (중량%)
화합물 K	1.0
비자씨 오일	5.0
L-아스코르빈산-2-인산마그네슘염	1.0
수용성 콜라겐 (1% 수용액)	1.0
시트르산나트륨	0.1
시트르산	0.05
1,3-부틸렌글리콜	3.0
정제수	잔량

[50]

[51] [제형에 2] 크림

[52] 아래 표에 기재된 조성으로 통상의 방법에 따라 크림을 제조한다.

[53] 표 3

[Table 3]

성분	함량(중량%)
프로토파낙사디올계 화합물	2.0
폴리에틸렌글리콜 모노스테아레이트	2.0
모노스테아르산 글리세린	5.0
세틸알코올	4.0
스쿠알렌	3.0
트리2-에틸헥산글리세릴	6.0
스핑고당지질	1.0
1,3-부틸렌글리콜	7.0
정제수	잔량

[54]

[55] [제형에 3] 팩

[56] 아래 표에 기재된 조성으로 통상의 방법에 따라 팩을 제조한다.

[57] 표 4

[Table 4]

성분	함량(중량%)
비자 추출물	20.0
폴리비닐알코올	13.0
L-아스코르빈산-2-인산마그네슘염	1.0
라우로일히드록시프롤린	1.0
수용성 콜라겐 (1% 수용액)	2.0
1,3-부틸렌글리콜	3.0
에탄올	5.0
정제수	잔량

[58] [제형예 4] 연질 캡셀제

[59] 프로토파낙사디올계 화합물 50 mg, 비자 추출물 200 mg, 에피갈로카테킨 갈레이트 10 mg, 대두 추출물 50 mg, 대두유 180 mg, 팜유 2 mg, 팜경화유 8 mg, 황납 4 mg 및 레시틴 6 mg을 혼합하고, 통상의 방법에 따라 연질 캡셀을 제조한다.

[60]

[61] [제형예 5] 정제

[62] 화합물 K 10 mg, 비자씨 오일 200 mg, 에피갈로카테킨 갈레이트 10 mg, 대두 추출물 50 mg, 포도당 100 mg, 전분 96 mg 및 마그네슘 스테아레이트 4 mg을 혼합하고 30% 에탄올을 40 mg 첨가하여 과립을 형성한 후, 건조하고 타정기를 이용하여 정제로 타정한다.

청구범위

- [청구항 1] 프로토파낙사디올(Protopanaxadiol)계 화합물 및 비자(*Torreya nucifera*) 추출물 중 하나 이상을 유효 성분으로 포함하는 피부 방어력 증진용 조성물.
- [청구항 2] 제 1 항에 있어서,
프로토파낙사디올계 화합물은 화합물 K(20-O-(베타-D-글루코피라노실)-20(S)-프로토파낙사디올)를 포함하는 조성물.
- [청구항 3] 제 1 항에 있어서,
비자 추출물은 비자씨 오일을 포함하는 조성물.
- [청구항 4] 제 1 항에 있어서,
조성물은 조성물 전체 중량을 기준으로 0.001 중량% 내지 10 중량%의 프로토파낙사디올계 화합물을 포함하는 조성물.
- [청구항 5] 제 1 항에 있어서,
조성물은 조성물 전체 중량을 기준으로 0.001 중량% 내지 99 중량%의 비자 추출물을 포함하는 조성물.
- [청구항 6] 제 1 항에 있어서,
조성물은 에피갈로카테킨 갈레이트(Epigallocatechin Gallate)를 더 포함하는 피부 방어력 증진용 조성물.
- [청구항 7] 제 6 항에 있어서,
조성물은 조성물 전체 중량을 기준으로 0.00001 중량% 내지 10 중량%의 에피갈로카테킨 갈레이트를 포함하는 피부 방어력 증진용 조성물.
- [청구항 8] 제 1 항에 있어서,
조성물은 피부의 항균 및 항염 활성을 증진하는 조성물.
- [청구항 9] 제 1 항에 있어서,
조성물은 피부의 항균 펩타이드 발현을 촉진하는 조성물.
- [청구항 10] 제 1 항 내지 제 9 항 중 어느 한 항에 있어서,
조성물은 화장품 조성물인 조성물.