

Dermales Trägersystem der Zukunft

Peptide steuern Wirksamkeit auf den Punkt

S. Christian, V. Krug, A. Hidalgo

Abstract

Moderne Wirkkosmetik ist von steigenden Ansprüchen an ihre Leistung geprägt. Der Wirksamkeit von kosmetischen Wirkstoffen kommt damit eine Schlüsselrolle bei der Entwicklung neuer Technologien zu. Dabei spielen beispielsweise die Penetration und die Freisetzung der Wirkstoffe in der Haut eine wichtige Rolle. Diese Herausforderungen können mit Hilfe von dermalen Trägersystemen, in denen die Wirkstoffe i.d.R. verkapselt vorliegen, bereits erfolgreich gemeistert werden. Die X50 Capsules™ gehen noch einen Schritt weiter. Durch spezifische Steuerungspeptide an der Kapseloberfläche ist es möglich, den jeweiligen Wirkstoff selektiv zu bestimmten Zellen in der Haut und damit direkt zu seinem entsprechenden Wirkort zu transportieren. Die Freisetzung des Wirkstoffs erfolgt im Inneren der Zelle, sodass sein volles Potential gezielt dort entfaltet wird, wo es gebraucht wird. Die biokompatible und biologisch abbaubare Kapsel verhindert außerdem Wechselwirkungen zwischen Wirkstoff und Produktformulierung und schützt den Wirkstoff auf seinem Weg von der Hautoberfläche bis zu seinem bestimmten Wirkort in der Zelle vor funktionalem Abbau. Durch diesen selektiven und wirkeffizienten Ansatz können zudem unspezifische Zellreaktionen als Nebeneffekte verhindert und Einsatzkonzentrationen kosteneffektiv gesenkt werden. Verschiedene *in-vitro*- und *in-vivo*-Studien bestätigen die Wirksamkeit dieses zukunftsweisenden Trägersystems, das die Effizienz kosmetischer Wirkstoffe einzigartig revolutionieren kann.

Einleitung

Wirkung und Wirksamkeit – ein kleiner aber entscheidender Unterschied

Wirkstoffe bilden eine unverzichtbare Säule für moderne Wirkkosmetik. Sie können helfen, Falten zu mindern, Konturen zu straffen, die Haut zu durchfeuchten oder sie durch einen ebenmäßigen Teint strahlen zu lassen. Ihre Vielfalt und ihr Potential sind enorm und so werden sie nicht selten auch zu Leitngrediencien und Botschaftern ganzer Produktlinien. Mit stetig steigenden Ansprüchen an die Leistungen und Wirksamkeit von kosmetischen Produkten ist es nicht verwunderlich, dass Wirkstoffe kontinuierlich und aufwendig weiterentwickelt werden. Auf ihrem Weg von der Quelle aus dem Labor oder der Natur bis ins fertige Produkt steckt in ihnen ein umfassendes wissenschaftlich-technisches Knowhow, sie werden intensiv in Wirksamkeitsstudien untersucht und prozesstechnisch optimiert, um ihr volles Potential herauszuarbeiten. Im Zentrum der Wirksamkeit eines kosmetischen Wirkstoffs steht jedoch ein ganz überschaubarer Zusammenhang: Damit ein Wirkstoff in der Haut wirksam sein kann, ist es wichtig, dass er zu seinem bestimmten Wirkort gelangt. So vermeintlich einfach dies auf den ersten Blick erscheint, ist es in der Umsetzung jedoch nicht. Dabei sind sowohl die Penetration des Wirkstoffs als auch seine Bioverfügbarkeit in der Haut entscheidende

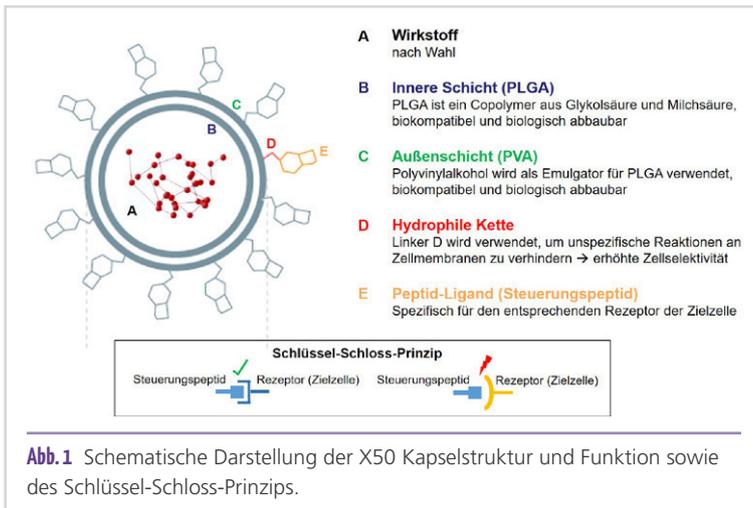
Faktoren, die über die entsprechende Wirksamkeit bestimmen. Dermale Trägersysteme, in denen der jeweilige Wirkstoff meist verkapselt vorliegt, bieten bereits eine sehr gute Grundlage, um diese Anforderungen zu erfüllen.

Wirkstoffverfügbarkeit selektiv bis auf Zellebene

Um den Wirkstoff zielgenau an seinen spezifischen Wirkort in den entsprechenden Zellen zu transportieren, wurden die INFINITEC X50 Capsules™ entwickelt (INCI: differiert in Abhängigkeit von zugehöriger Zielzelle und enthaltenem Wirkstoff, siehe **Tab. 1**).

Kosmetische Anwendung	X50 Kapsel mit Wirkstoff	+ Steuerungspeptid + Aktivität	Zielzelle/Rezeptor	INCI (Konservierungsmittelfreies Pulver)
Anti Falten	Kollagen-booster	+ Peptid A + Pro-Kollagen Typ I Synthese	Fibroblast/FGF	LACTIC ACID/GLYCOLIC ACID COPOLYMER, POLYVINYL ALCOHOL, HEPTAPEPTIDE-15 PALMITATE, COPPER HEPTAPEPTIDE-14 PANTOTHENATE
Anti Falten	Hyaluron-säure-booster	+ Peptid A + Elastinsynthese		LACTIC ACID/GLYCOLIC ACID COPOLYMER, PALMITOYL TETRAPEPTIDE-50, POLYVINYL ALCOHOL, HEPTAPEPTIDE-15 PALMITATE
Strahlkraft (Glow)	ATP-booster	+ Peptid A + Pro-Kollagen Typ I Synthese		LACTIC ACID/GLYCOLIC ACID COPOLYMER, CHLORELLA VULGARIS (ALGAE) EXTRACT, POLYVINYL ALCOHOL, HEPTAPEPTIDE-15 PALMITATE
Anti Cellulite, Reshaping	lipogenet. adipoener Inhibitor	+ Peptid B + Lipolyse	Adipozyt/MC4	LACTIC ACID/GLYCOLIC ACID COPOLYMER, POLYVINYL ALCOHOL, COCCOLOBA UNIFERA FRUIT EXTRACT, ACETYL CYCLOHEXAPEPTIDE-34
Anti Mimikfalten (Botox-like)	SNARE-Inhibitor	+ Peptid C + Ca ²⁺ -Blocking	Hautneuron/Delta-Opioid	LACTIC ACID/GLYCOLIC ACID COPOLYMER, PALMITOYL HEXAPEPTIDE-52, POLYVINYL ALCOHOL, PALMITOYL HEPTAPEPTIDE-18
Whitening, Anti Altersflecken	Melanin-Inhibitor	+ Peptid D + Minderung UV-induzierter Pigmentation	Melanozyt/MC1	LACTIC ACID/GLYCOLIC ACID COPOLYMER, PALMITOYL SH-OCTAPEPTIDE-24 AMIDE, POLYVINYL ALCOHOL, PALMITOYL SH-TRIPPEPTIDE-5 NORISOLEUCYL SH-NONAPEPTIDE-1
Stärkung Hautbarriere	ECM-Protein-booster	+ Peptid E	Keratinozyt/β1-Integrin	LACTIC ACID/GLYCOLIC ACID COPOLYMER, POLYVINYL ALCOHOL, PALMITOYL HEPTAPEPTIDE-27, PALMITOYL OLIGOPEPTIDE-78, PALMITOYL OCTAPEPTIDE-24

Tab. 1 Übersicht der INFINITEC X50 Capsules™ mit verschiedenen Wirkstoffen, Zellspezifität und kosmetischer Anwendung.



Diese Kapseln tragen an ihrer Oberfläche Steuerungsepeptide, die spezifisch und damit hochselektiv an Zellrezeptoren der bestimmten Zielzelle binden. Damit dies gelingen kann, werden die Steuerungsepeptide strukturell so aufgebaut, dass sie nur zu den Rezeptoren der für sie bestimmten Zielzelle passen (**Abb. 1**). Dieser Mechanismus entspricht dem sogenannten Schlüssel-Schloss-Prinzip, das 1894 vom deutschen Chemiker und Nobelpreisträger Emil Fischer zur Beschreibung der Substratspezifität von Enzymen begründet wurde [1]. Durch zahlreiche Forschungsarbeiten in verschiedenen naturwissenschaftlich-medizinischen Bereichen wurde diese seither vielfach zitierte, bildhafte Analogie als elementarer Baustein zur Erklärung grundlegender Lebensprozesse belegt [2]. Erst wenn der Schlüssel (Substrat) in das dafür vorgesehene Schloss (substratspezifisches Enzym) passt, kann eine biochemische Reaktion erfolgen. In dieser Form verhält es sich auch mit dem Mechanismus der X50 Kapseln. Somit kann der in den Kapseln enthaltene Wirkstoff, beispielsweise zur Anregung der Kollagensynthese, sein volles Potential genau dort entfalten, wo es gebraucht wird und wirkeffizient umgesetzt werden kann: in Fibroblasten als Zielzellen. Die kosmetische Wirksamkeit des entsprechenden Wirkstoffs kann damit wesentlich gesteigert werden.

Die X50 Kapselhülle wird aus zwei verschiedenen Schichten gebildet. Die innere Schicht besteht aus PLGA (Poly(Lactic-co-Glycolic Acid)), ein Copolymer aus Milchsäure und Glykolsäure. Die äußere Schicht ist aus PVA (Polyvinylalkohol) aufgebaut. Diese beiden Kapselmaterialien sind in hohem Maße biokompatibel und biologisch abbaubar. Sie werden daher in der Haut nicht als Fremdstoffe abgestoßen sondern in physiologisch bekannte Substrate abgebaut, die in verschiedenen körpereigenen Stoffwechselprozessen beteiligt sind (z.B. im Zitratzyklus). Somit

können sie der entsprechenden Zielzelle zudem als Nährsubstrat zur Verfügung stehen. Der durchschnittliche Partikeldurchmesser der X50 Kapseln beträgt 220 nm (Verteilung oberhalb der Deklarationsgrenze für Nanomaterialien).

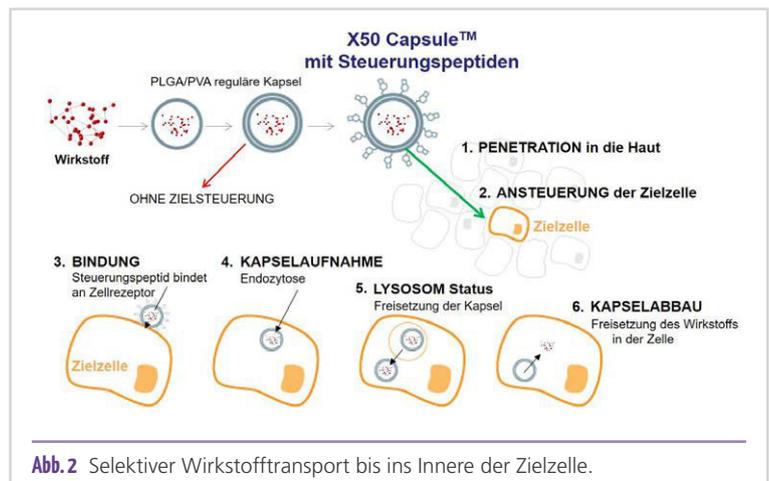
Durch die spezifische Bindung zwischen Steuerungsepeptid und Rezeptor der entsprechenden Zielzelle werden intrazelluläre Signalübertragungen aktiviert. Dabei können bereits wirkspezifische Mechanismen stimuliert werden, wie beispielsweise die Anregung der Kollagen- und Elastinsynthese (Fibroblasten). Somit ergeben sich synergistische Effekte zwischen den Steuerungsepeptiden und dem Wirkstoff im Inneren der Kapsel. Die Aufnahme der Kapsel in die Zelle wird ebenfalls durch die spezifische Rezeptorbindung initiiert. Nach Umschließen der Zellmembran

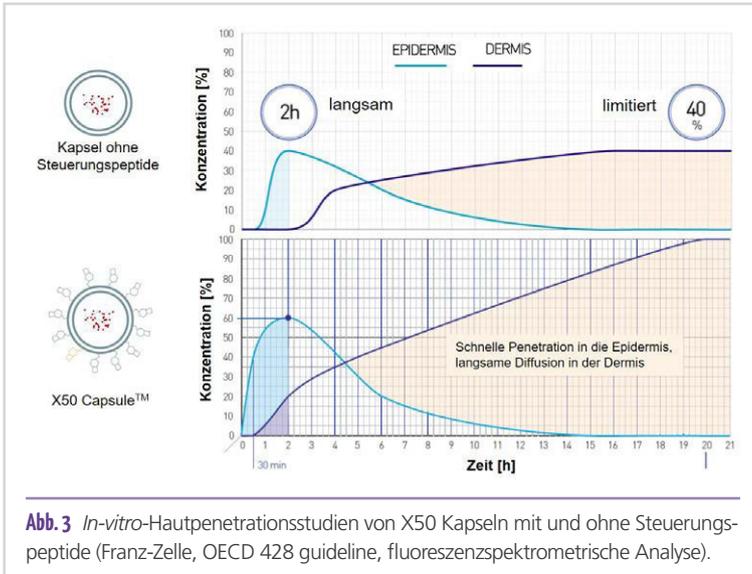
und Bildung eines Lysosoms wird die X50 Kapsel als Ganzes ins Zellinnere aufgenommen (Endozytose). Durch die biokompatiblen Eigenschaften des Kapselmaterials wird die Kapsel aus dem Lysosom freigesetzt. Anschließend erfolgt der enzymatische Abbau der Kapselhülle, durch den der Wirkstoff aus dem Kapselinneren nach und nach kontrolliert in der Zelle freigesetzt wird, sodass ein Langzeitwirkdepot entsteht. Dieser gesamte Prozess ist in **Abb. 2** gezeigt.

Methoden und Ergebnisse

Nachweisliche Wirksamkeitssteigerung durch verbesserte Penetration und spezifische Zellbindungen

Die Penetration eines Wirkstoffs nach topischer Applikation ist der erste entscheidende Schritt auf dem Weg zur Entfaltung der gewünschten Wirksamkeit. Dabei muss die Hautbarriere im *Stratum Corneum* überwunden werden, die die





Haut vor negativen Einflüssen aus der Umgebung, aber auch vor transepidermalem Wasserverlust schützt [3, 4]. In Hautpenetrationsstudien (*in-vitro*/Franz-Zelle, OECD 428 guideline, fluoreszenzspektrometrische Analyse) konnte gezeigt werden, dass die X50 Kapseln erheblich schneller penetrieren als entsprechende Kapseln ohne Steuerungspeptide (**Abb. 3**). Nach zwei Stunden sind 60 % der Kapseln mit Steuerungspeptiden in die Epidermis penetriert. Bei dementsprechenden Kapseln ohne Steuerungspeptide penetrieren im gleichen Zeitabschnitt lediglich etwa 40 %. Bereits 30 Minuten nach topischer Applikation beginnt bei den Kapseln mit Steuerungspeptiden die Diffusion in die Dermis, die nach 20 Stunden quantitativ abgeschlossen ist. Ohne Steuerungspeptide erfolgt die Diffusion in die Dermis deutlich zeitverzögert und nähert sich nach einigen Stunden einem nicht quantitativen Maximalwert an, der auch nach weiteren Stunden nicht gesteigert wird.

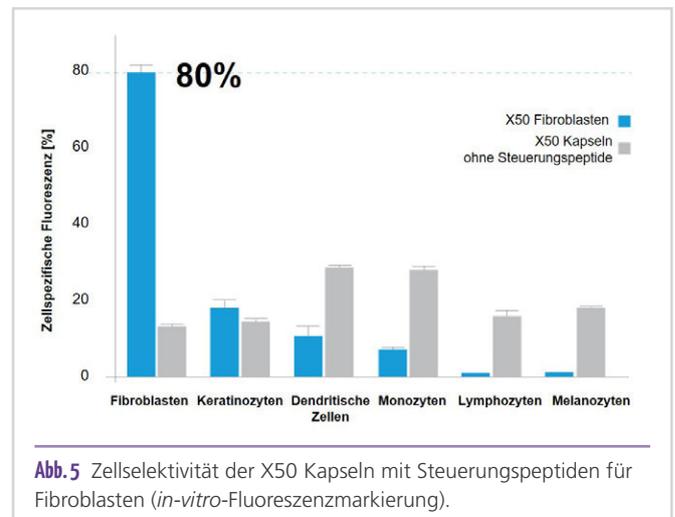
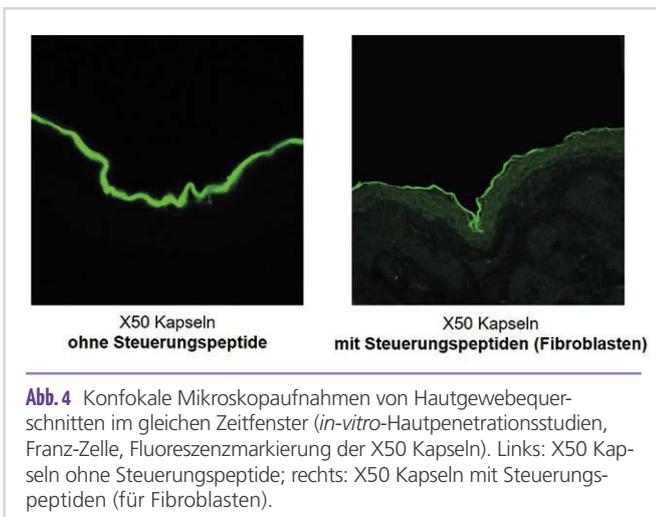
In konfokalen Mikroskopaufnahmen von Hautgewebeanschnitten aus der oben genannten Penetrationsstudie sind die unterschiedlichen Penetrations- und Diffusionseigenschaften der X50 Kapseln mit und ohne Steuerungspeptide deutlich zu sehen (**Abb. 4**).

Wie beschrieben, können die X50 Kapseln mit Hilfe der Steuerungspeptide in der Haut spezifisch an die Rezeptoren der entsprechenden Zielzelle binden. Dadurch kann eine hohe Zellspezifität erreicht werden, sodass der jeweilige Wirkstoff zielgenau an seinen Wirkort transportiert werden kann. Dies ist am Beispiel von X50 Kapseln mit Steuerungspeptiden gezeigt, die spezifisch an die Rezeptoren von Fibroblasten binden (**Abb. 5**). Die Bindung an andere Zelltypen erfolgt unselektiv in untergeordneter Häufigkeit. Im Vergleich dazu wurde ebenfalls die Bindung von X50 Kapseln ohne Steuerungspeptide

untersucht. Dabei ist deutlich zu sehen, dass diese in Bezug auf alle im Experiment betrachteten Zelltypen unselektiv binden und sich eine unspezifische Verteilung ergibt.

Die hohe Zellspezifität der X50 Kapseln mit Steuerungspeptiden ermöglicht nicht nur den zielgenauen Wirkstofftransport zur Wirksamkeitssteigerung, sondern verhindert dadurch auch unerwünschte Nebeneffekte, die durch unspezifische Zellreaktionen entstehen könnten. Damit weisen die X50 Kapseln mit Steuerungspeptiden ein hohes Sicherheitsprofil auf.

Die nachweislich verbesserte Penetration/Diffusion und die zellspezifische Bindung der X50 Kapseln mit Steuerungspeptiden im Vergleich zu den entsprechenden Kapseln ohne Steuerungspeptide sind grundlegende Voraussetzungen, um die Wirksamkeit der in den Kapseln transportierten Wirkstoffe steigern zu können. Die tatsächliche Wirksamkeitssteige-



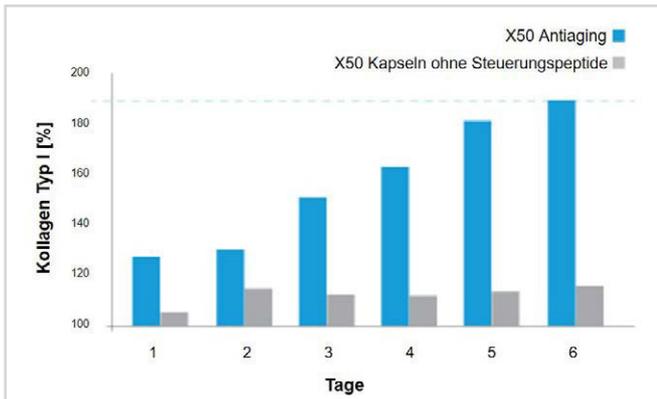


Abb. 6 Wirksamkeitssteigerung durch X50 Kapseln mit Steuerungspeptiden (Fibroblastenkulturen; quantitativer Nachweis der Synthese von Kollagen Typ I mittels ELISA).

Die Wirkung ist exemplarisch an der untersuchten Anregung der Kollagensynthese gezeigt (**Abb. 6**).

In dieser Studie wurden Fibroblastenkulturen mit X50 Kapseln behandelt, die als Wirkstoff ein Peptid enthalten, das die Synthese von Kollagen Typ I anregt (X50 Antiaging; INCI (Pulver): Lactic Acid/Glycolic Acid Copolymer, Polyvinyl Alcohol, Heptapeptide-15 Palmitate, Copper Heptapeptide-14 Pantothenate). Es wurden sowohl X50 Kapseln mit und ohne Steuerungspeptide untersucht und die Kollagensynthese mittels ELISA-Nachweisverfahren über einen Zeitraum von sechs

Tagen quantitativ bestimmt. Im Fall der X50 Kapseln mit Steuerungspeptiden wurde im Analysezeitraum eine stetig steigende Kollagenkonzentration ermittelt. Bei den Kapseln ohne Steuerungspeptide konnte die Anregung der Kollagensynthese auf niedrigem Niveau zwar nachgewiesen werden, allerdings erbrachte die Inkubation der Zellkulturen über den Analysezeitraum von sechs Tagen keine maßgebliche Steigerung der Synthese von Kollagen Typ I. Damit weisen die X50 Kapseln durch den Beitrag der Steuerungspeptide eine wesentliche Wirksamkeitssteigerung auf.

Aufgrund der nachweislich spezifischen Wirksamkeitssteigerung der X50 Kapseln mit Steuerungspeptiden kann die Einsatzkonzentration bei gleicher Wirksamkeit stark reduziert werden. Die empfohlene Einsatzkonzentration beträgt 0,001 % X50 Capsules™ (Pulver). Das entspricht 1 % von 1 g X50 Kapseln (Pulver) in 1 L Wasser. Durch diese sehr günstige Kombination von hoher Zellselektivität mit niedriger Einsatzkonzentration weisen die X50 Kapseln mit Steuerungspeptiden ein sehr gutes Sicherheitsprofil auf.

Die hocheffiziente Wirksamkeit der mit Wirkstoff beladenen X50 Kapseln (im Folgenden X50 Wirkstoffe genannt) wurde in verschiedenen *in-vivo*-Studien nachgewiesen. Die Studien wurden in Bezug auf die jeweilige wirkstoffspezifische Funktion konzipiert und stellten dabei beispielsweise die Reduktion faltenbestimmender Parameter, die Erhöhung der Strahlkraft der Haut oder die Minderung der Intensität von Altersflecken

Seit 1997

Fine Chemicals and More...



CBP INULIN

Ein Biopolymer, gewonnen aus den Wurzeln der Zichorie

- Prebiotika
- Feuchtigkeit
- Natürlicher Konditioner

Für Skin & Hair Care



in den Mittelpunkt der Untersuchungen. Eine dieser Studien ist hier exemplarisch dargestellt. Sie zeigt die Reduktion von Mimikfalten durch X50 Myocept (INCI (Pulver): Lactic Acid/Glycolic Acid Copolymer, Palmitoyl Hexapeptide-52, Polyvinyl Alcohol, Palmitoyl Heptapeptide-18), dessen Kapseln selektiv an die Rezeptoren von Hautneuronen binden.

Bei dem in diesen Kapseln enthaltenen Wirkstoff handelt es sich um ein Peptid, das die Ausbildung des SNARE-Proteinkomplexes von Hautneuronen zu Muskelzellen inhibiert und damit die Signalübertragung zur Muskelkontraktion an dieser Stelle unterbricht. Dadurch kann die Intensität von Mimikfalten reduziert werden. Dieser Prozess ist dem des Neurotoxins Botulinumtoxin (auch bekannt unter dem Namen Botox) ähnlich, wobei der Einfluss von Botox eine langandauernde Blockade der Signalübertragung zur Muskelkontraktion zur Folge hat. Die Wirkung von X50 Myocept ist temporär und kurzzeitig reversibel, sobald der Wirkstoff nicht mehr angewendet wird. Anhand des Wirkmechanismus von X50 Myocept wird deutlich ersichtlich, dass die Funktion zellspezifischen Steuerungspeptide nicht nur in der selektiven Ansteuerung bestimmter Zielzellen besteht, sondern die Bindung an den jeweiligen Zellrezeptoren bereits Prozesse aktiviert, die die gewünschte Wirkung des entsprechenden X50 Wirkstoffs unterstützen. Durch die Bindung der X50 Myocept Kapsel an das Hautneuron wird bereits ein physiologischer Prozess aktiviert, der die Aufnahme von Ca^{2+} -Ionen ins Innere des Hautneurons inhibiert. In Folge der Reduktion der Ca^{2+} -Ionenkonzentration im Inneren des Hautneurons werden weniger Neurotransmitter zur Signalübertragung (hier Acetylcholin zum Auslösen einer Muskelkontraktion) an der Zellmembran des Neurons bereitgestellt. Je weniger Acetylcholin an der Innenseite der Neuronenmembran zur Verfügung steht, desto schwächer ist die Signalübertragung zur Muskelzelle und somit zur Muskelkontraktion. Die Signalübertragung kann jedoch nur erfolgen, wenn zwischen dem Hautneuron und der Muskelzelle der sogenannte SNARE-Proteinkomplex ausgebildet wird. Durch das in den Kapseln enthaltene Peptid wird die Ausbildung dieses Proteinkomplexes jedoch zusätzlich behindert. Dies erfolgt durch sterische Hinderung, indem das Peptid die Aktivität des SNAP-25-Proteins blockiert, das am SNARE-Proteinkomplex beteiligt ist. So wird der Signalübertragung zur Muskelkontraktion über zwei parallele Wege entgegengewirkt, sodass die Ausbildung von Mimikfalten effektiv reduziert werden kann. Durch die synergistischen Effekte zwischen den Steuerungspeptiden und dem Wirkstoff in der Kapsel wird die gewünschte Wirksamkeit zusätzlich gesteigert. Die *in-vivo*-Studie zur Untersuchung der Reduktion von

Mimikfalten wurde mit einem Panel bestehend aus 30 Probanden (männlich/weiblich) im Alter von 40-55 Jahren durchgeführt. Dabei wurde die Ausbildung der Mimikfalten an der äußeren Augenkontur (Krähenfüße) mittels Fringe-Projektion im dreidimensionalen Raum als Oberflächenstruktur untersucht. Das Testprodukt mit 0,001 % X50 Myocept-Pulver (entspricht 1 % von 1 g X50 Myocept-Kapseln (Pulver) in 1 L Wasser) wurde dazu über einen Zeitraum von vier Wochen zwei Mal täglich appliziert. Bereits nach 14 Tagen wurde eine durchschnittliche Reduktion der Mimikfalten um 12 % ermittelt, die nach 28 Tagen bis auf durchschnittlich 20 % (bestes Ergebnis 27 %) gesteigert werden konnte. In **Abb. 7** sind zwei ausgewählte Probandenergebnisse mit den jeweils zugehörigen Fringe-Projektionen dargestellt.

Eine Technologie, viele Wirkstoffe – X50 Kapseln als universelles Trägersystem

Mit Hilfe der X50 Technologie können zahlreiche Wirkstoffe für verschiedene kosmetische Anwendungen verkapselt werden. Eine bestehende Auswahl ist in **Tab. 1** zusammengestellt. Diese Technologie ist sowohl mit hydro- als auch mit lipophilen Wirkstoffen kompatibel und kann somit auch als Plattform für bestehende Wirkstoffe einer Produktlinie genutzt werden, um das Potential dieser Wirkstoffe zu steigern.

Ausblick

Der zielgenaue Wirkstofftransport zu bestimmten Zellen ist wie in diesem Artikel beschrieben ein moderner und zukunftsweisender Ansatz, um die Wirksamkeit kosmetischer Wirkstoffe effizient zu steigern. Im Inneren der Zelle kann in einem nächsten Schritt weiter zwischen einzelnen Zellorganellen als spezifischen Wirkorten unterschieden werden. So stehen beispielsweise Mitochondrien als zentrale Kraftwerke der Zellen [5] im Fokus einiger Wirkstoffe. In diesem Zuge wurde ein neuer X50 Wirkstoff für Mitochondrien entwickelt, der noch in 2020 zur Verfügung stehen wird.

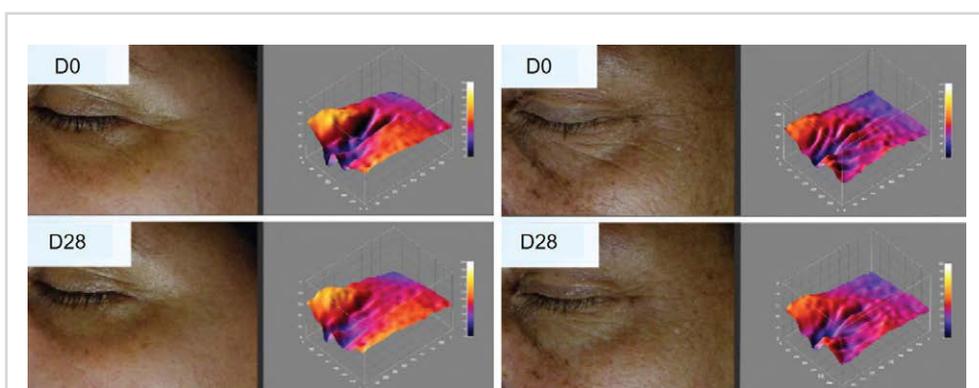


Abb. 7 Ausgewählte Probandenergebnisse der *in-vivo*-Studie zur Reduktion von Mimikfalten an der Augenkontur. Jeweils links: vor und nach vierwöchiger Anwendung des Testprodukts; jeweils rechts: zugehörige Fringe-Projektionen.

*Stärkung
Hautbarriere*

Anti-Cellulite

Kollagen Booster

Whitening

Strahlkraft

Hyaluron Booster

Anti-Mimikfalten

X50 Capsules™

Dermales Trägersystem der Zukunft für maximierte & selektive Wirksamkeit

Steuerungspeptide transportieren den Wirkstoff gezielt an seinen bestimmten Wirkort.

Volles Wirkstoffpotential bei geringer Einsatzkonzentration (0,001%) ermöglicht hohe Kosteneffektivität.

Hohe Verträglichkeit und Nachhaltigkeit durch biokompatible und bioabbaubare Kapsel.



GloryActives

Distribution für Deutschland und Österreich:

Ihr Partner für Wirkstoffe in der Kosmetik

GloryActives GmbH
Am Prüssee 46
D-21514 Güster

+49 4158 209469
info@gloryactives.de
www.gloryactives.de



Zusammenfassung

Die Anforderungen an kosmetische Wirkstoffe sind so vielfältig wie ihre jeweiligen Wirkmechanismen. Eines ist ihnen jedoch allen gemeinsam: Um ihr volles Potential entfalten zu können, muss der Wirkstoff an seinem bestimmten Wirkort in der Haut effizient verfügbar sein. Dies ist eine wesentliche Herausforderung bei der Entwicklung moderner Wirkkosmetik. In diesem Zusammenhang haben sich beispielsweise dermale Trägersysteme als effektive Transportmedien für Wirkstoffe erfolgreich etabliert.

Die in diesem Artikel beschriebenen X50 Kapseln sind ein solches Trägersystem, in dem der jeweilige Wirkstoff verkapselt vorliegt. Darüber hinaus verfügen diese speziellen Trägerkapseln über spezifische Steuerungspeptide an ihrer Oberfläche, die einen selektiven Transport des Wirkstoffs zu bestimmten Zielzellen ermöglichen, in denen anschließend die Freisetzung des Wirkstoffs erfolgt. Damit kann der Wirkstoff sein volles Potential direkt am jeweiligen Wirkort entfalten. Wie die durchgeführten *in-vitro*- und *in-vivo*-Studien zeigen, kann die Effizienz kosmetischer Wirkstoffe mit Hilfe dieser zukunftsweisenden Technologie signifikant gesteigert werden.

Die Zielelektivität der X50 Kapseln wird durch den jeweiligen chemischen Aufbau der entsprechenden Steuerungspeptide erreicht, die gemäß des sogenannten Schlüssel-Schloss-Prinzips nachweislich spezifisch an Rezeptoren der bestimmten Zielzelle binden. Die Kapsel wird anschließend in ganzer Form durch Endozytose ins Zellinnere aufgenommen, in dem der Wirkstoff durch enzymatischen Abbau des biokompatiblen Kapselmaterials nach und nach kontrolliert freigesetzt wird. Die dabei gebildeten Abbauprodukte sind Substrate körpereigener Stoffwechselprozesse (z.B. Zitratzyklus) und können der entsprechenden Zielzelle zudem als Nährsubstrat zur Verfügung stehen. Somit können mit Hilfe der X50 Technologie verschiedene Hautzellen wie beispielsweise Fibroblasten, Melanozyten, Hautneuronen, Adipozyten und Keratinozyten hoch selektiv mit wirkstoffbeladenen Kapseln angesteuert werden, um dort z.B. die Kollagensynthese anzuregen (Kapseln mit Anti Falten-Wirkstoff), die Melaninbildung zu inhibieren (Kapseln mit Whitening-Wirkstoff) oder Muskelkontraktionen temporär zu entspannen (Kapseln mit Anti Mimikfalten-Wirkstoff).

Im Folgenden sind die wichtigsten Vorteile der X50 Capsules™ Technologie gegenüber Kapseln ohne Steuerungspeptide bzw. unverkapselten Wirkstoffen zusammengefasst:

- Erhebliche Wirksamkeitssteigerung durch Zellelektivität
- Synergistische Effekte zwischen den Steuerungspeptiden und dem Wirkstoff in der Kapsel
- Beschleunigte und quantitativ vollständige Penetration/ Diffusion bis in die Dermis
- Kontinuierliche Freisetzung des Wirkstoffs durch enzymatischen Abbau des biokompatiblen Kapselmaterials (kontrollierte Freisetzung, Langzeitwirkdepot)
- Stabilisierung des Wirkstoffs bis zur Freisetzung in der Zelle
- Verhinderung von Wechselwirkungen zwischen Wirkstoff und Produktformulierung
- Niedrige Einsatzkonzentrationen bei gleicher Wirksamkeit durch hohe Wirkeffizienz möglich
- Verhinderung unspezifischer Zellreaktionen und anderer Nebeneffekte stellt in Kombination mit niedrigen Einsatzkonzentrationen ein hohes Sicherheitsprofil dar
- Einfache Einarbeitung
- Hohe Kosteneffektivität

Die zellspezifischen X50 Kapseln sind für verschiedene Wirkstoffe und Zielzellen verfügbar bzw. kombinierbar und stellen einen besonders nachhaltigen und modernen Ansatz dar, um den hohen Ansprüchen heutiger Wirkkosmetik umfänglich gerecht zu werden.

Referenzen

- [1] E. Fischer, Einfluss der Configuration auf die Wirkung der Enzyme, Ber. Dtsch. Chem. Ges. 1894, 27(3), 2985-2993.
- [2] F. W. Lichtenthaler, 100 Years Schlüssel-Schloss-Prinzip: What Made Emil Fischer Use this Analogy?, Angew. Chem., Int. Ed. Engl. 1994, 33, 2364-2374.
- [3] C. R. Harding, The stratum corneum: structure and function in health and disease, Dermatol. Ther. 2004, 17, 6-15.
- [4] E. Proksch, J. M. Brandner, J-M Jensen, The skin: an indispensable barrier, Exp. Dermatol. 2008, 17(12), 1063-1072.
- [5] I. E. Scheffler, A century of mitochondrial research: achievements and perspectives, Mitochondrion 2001, 1(1), 3-31.

Kontakt

Dr. Sandra Christian

Dr. Volker Krug

GloryActives GmbH

21514 Guester | Germany

www.gloryactives.de

Alfons Hidalgo

Infinitec Activos S.L.

08028 Barcelona | Spain

www.infinitec.es

Korrespondenzautor:

Dr. Sandra Christian

E-Mail: dr.s.christian@gloryactives.de