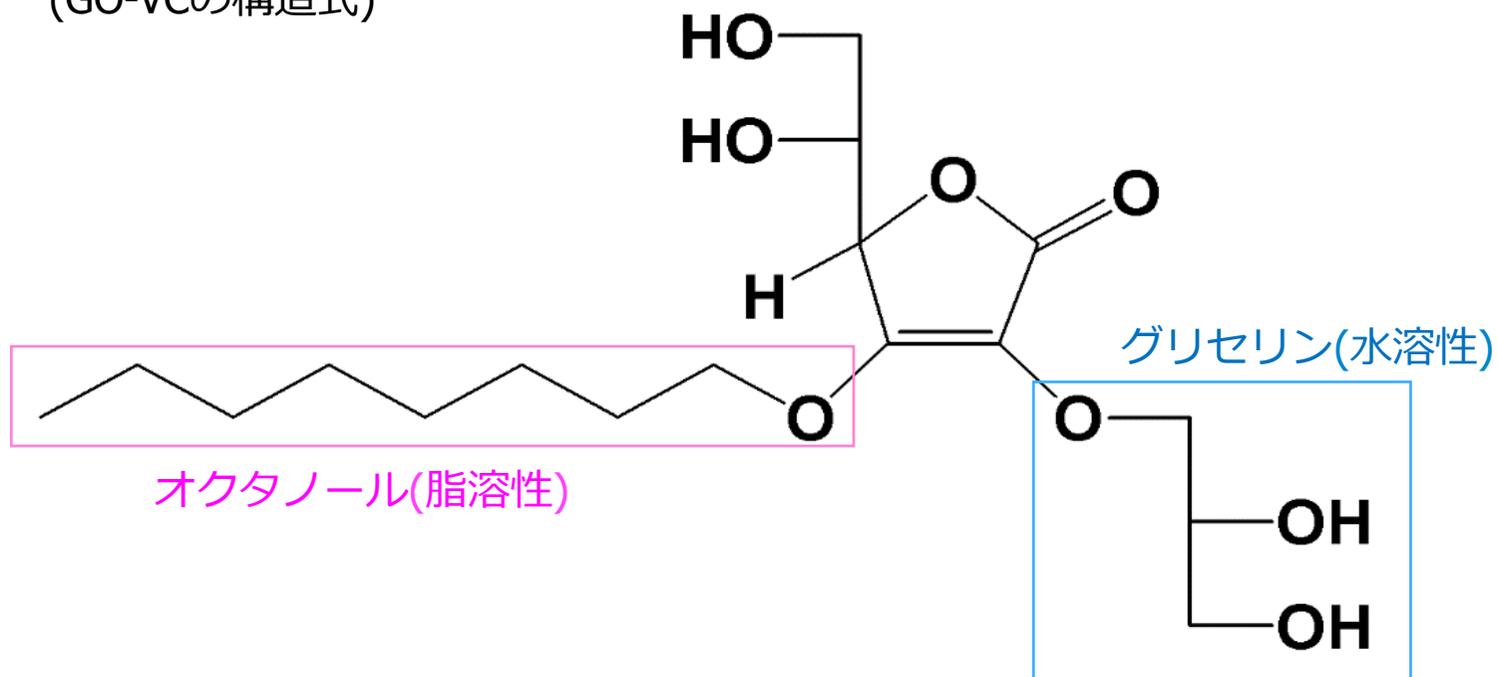


# 新規ビタミンC誘導体GO-VCの機能性と ニキビ及びその炎症に対する効果

# リセリルオクタールアスコルビン酸 (GO-VC) とは

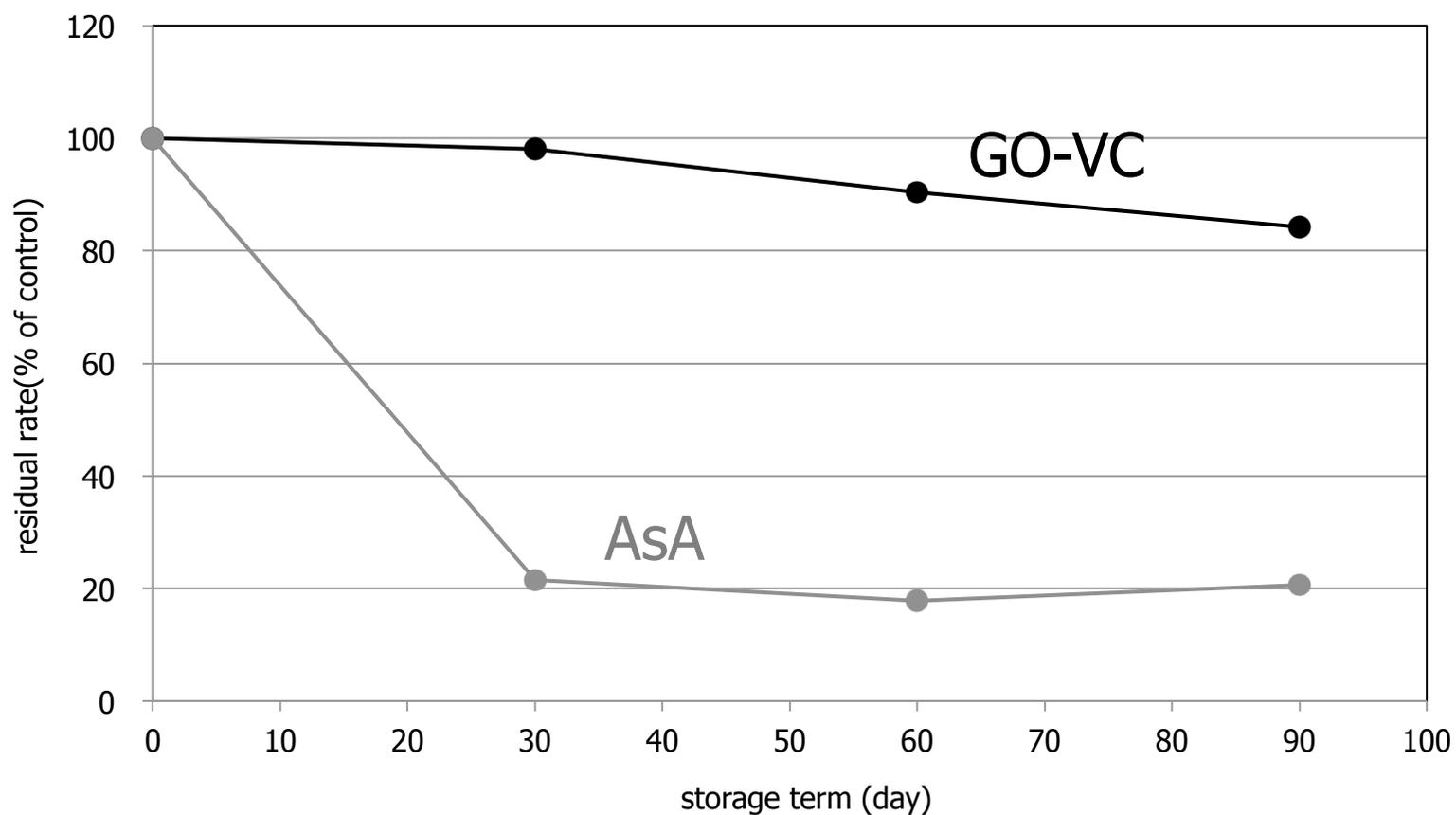
(GO-VCの構造式)



- 両親媒性 (水溶性+脂溶性)
- グリセリンの保湿効果に加え、オクタノールの抗菌活性も期待される

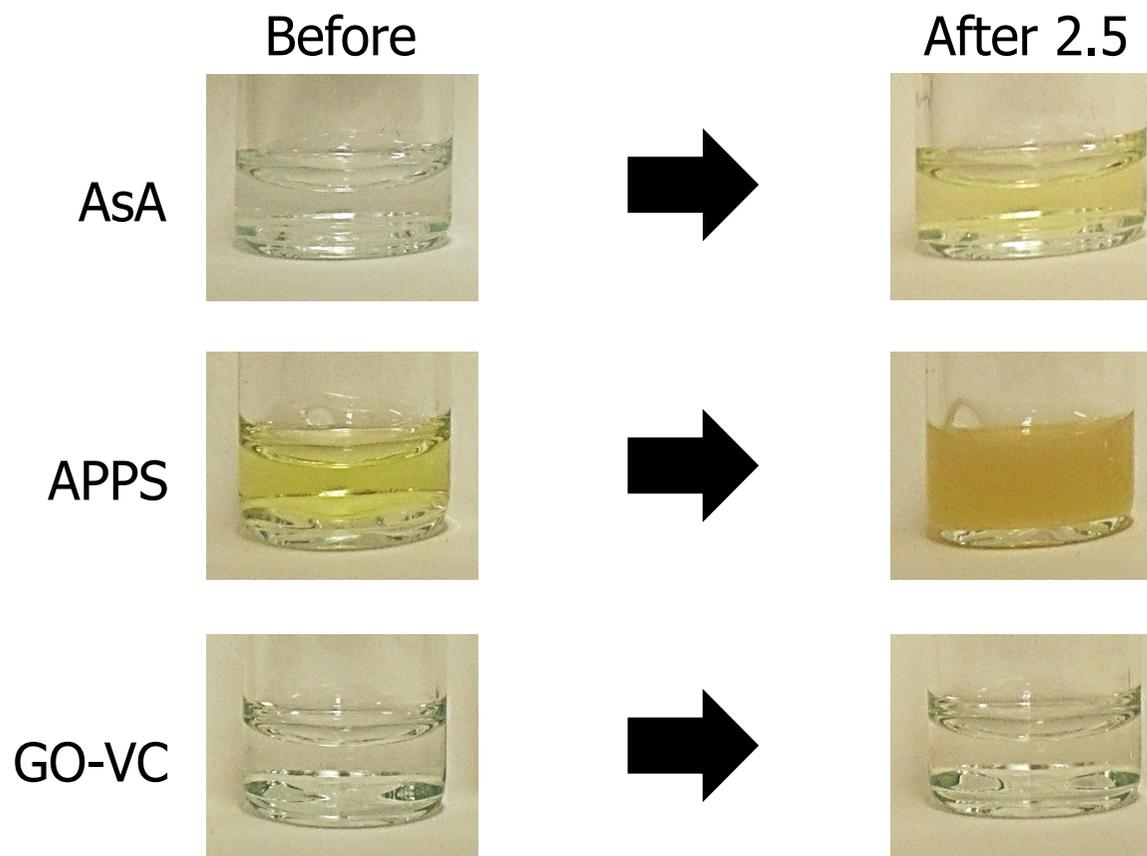
# GO-VCは高い安定性を示す

ビタミンC (AsA) 及びGO-VCを2%含むローション(pH 5)を50℃で90日間保存後、HPLCによる各残存量を測定した。



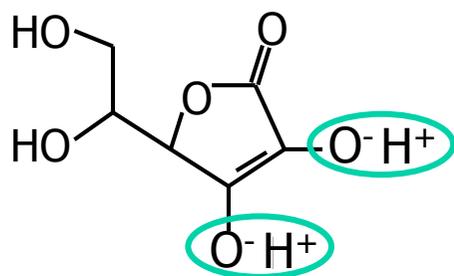
# GO-VCは室温で1年保存可能

下記はビタミンC (AsA)、APPS及びGO-VCを5%含む水溶液を100℃で2.5時間保存した。

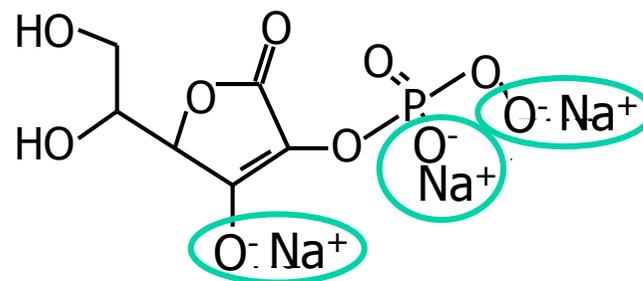


ビタミンCや従来のビタミンC誘導体はアニオンとして水に溶解する

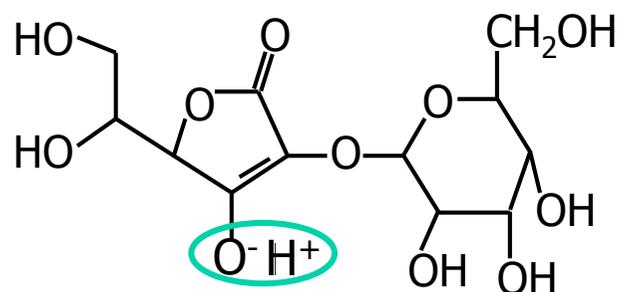
ビタミンC (AsA)



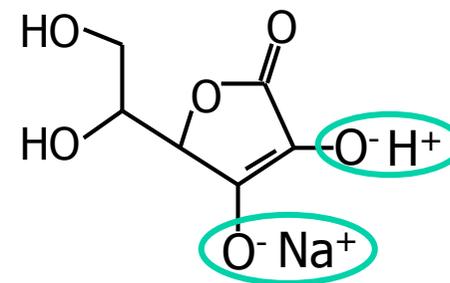
アスコルビン酸リン酸Na (APS)



アスコルビン酸グルコシド (AG)



アスコルビン酸Na (AsANa)



# GO-VCはジェルの粘度を低下させない

下記はジェルにビタミンC (AsA) 及びVC誘導体を5%添加した。



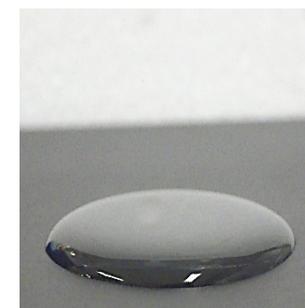
Control



AsA (粘度↓)



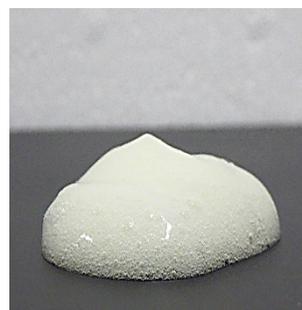
APS (粘度↓)



AA2G (粘度↓)



VCIP  
(乳白色化)

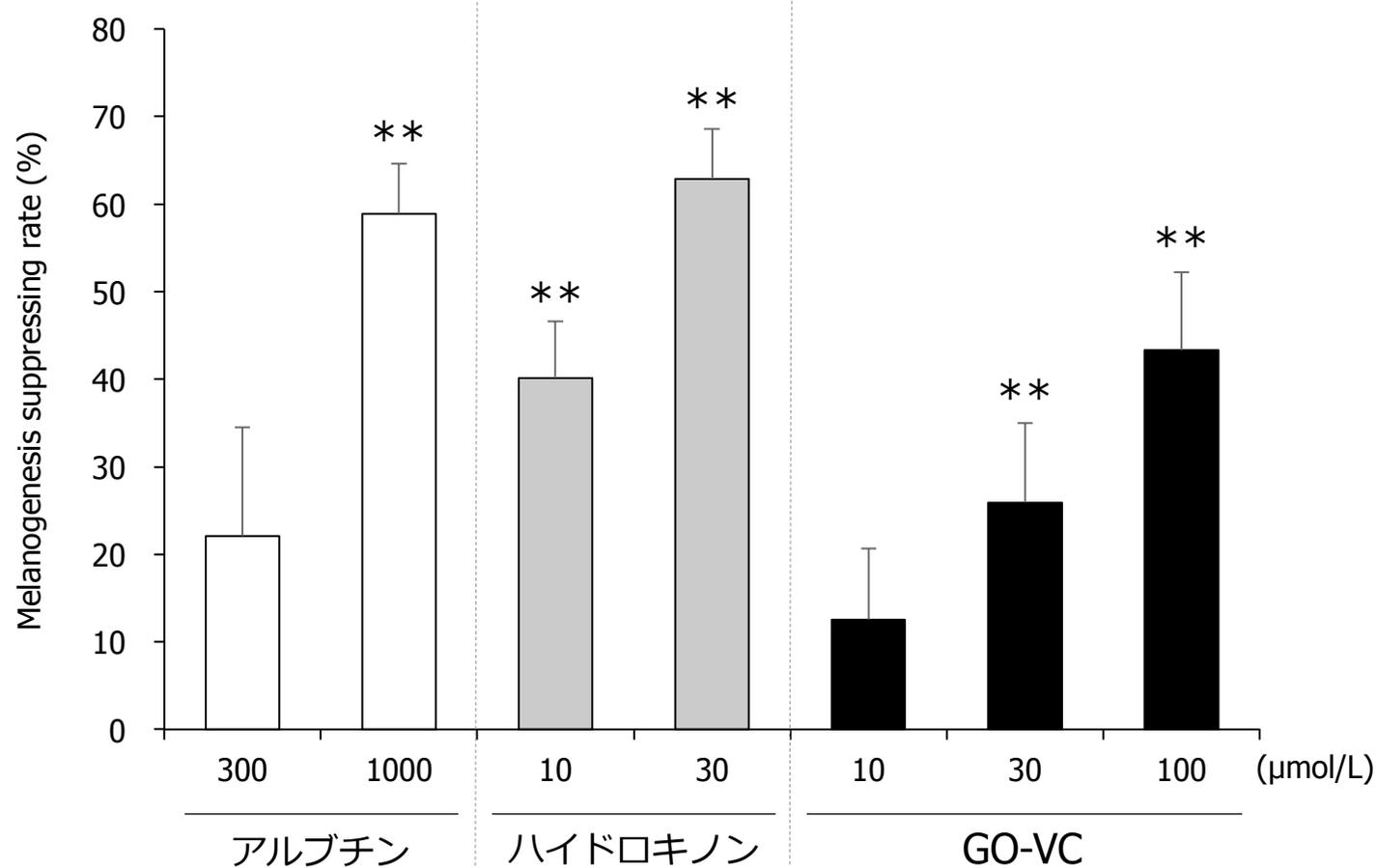


APPS  
(粘度若干↓、乳白色化)

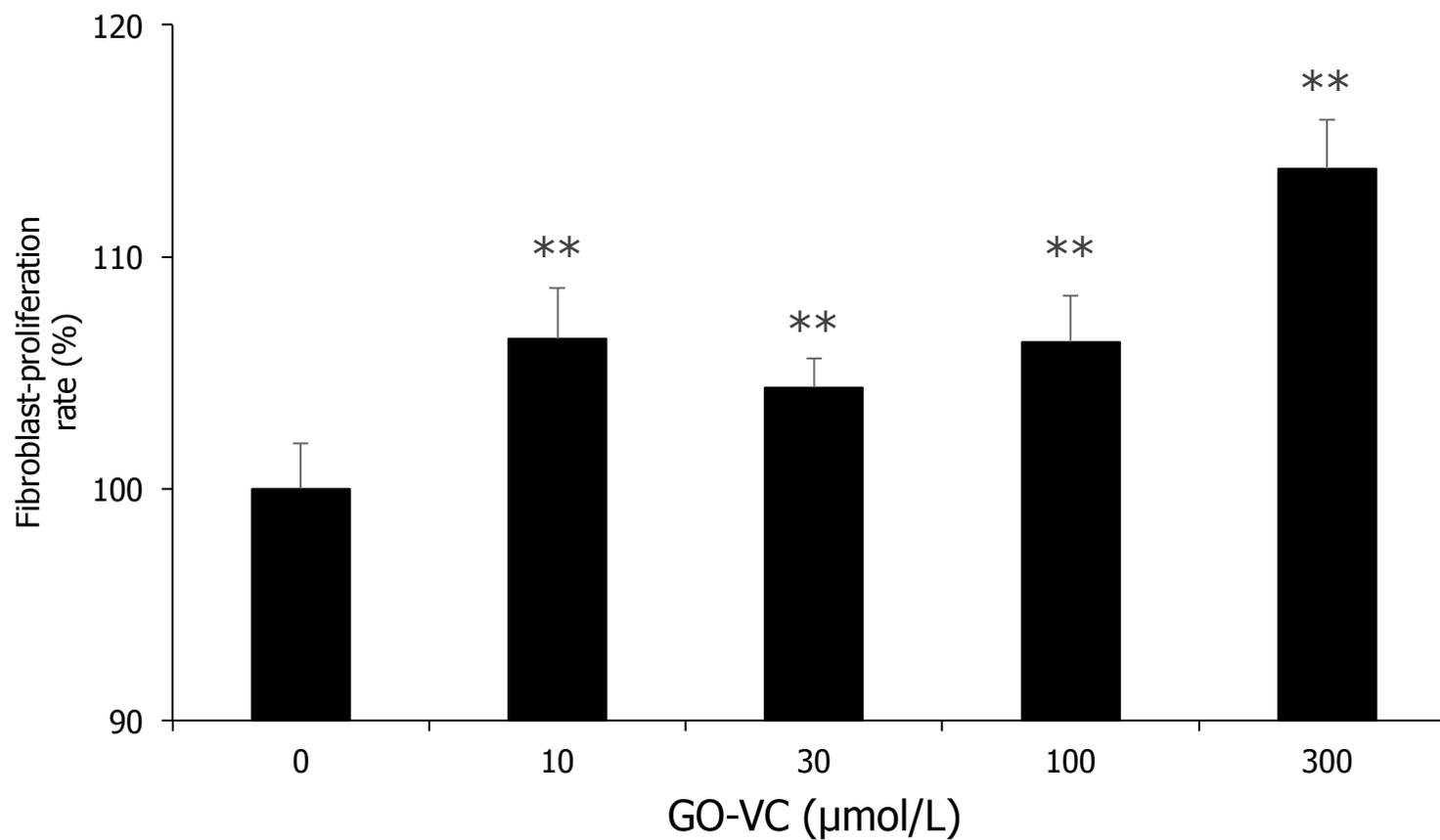


GO-VC  
(変化なし)

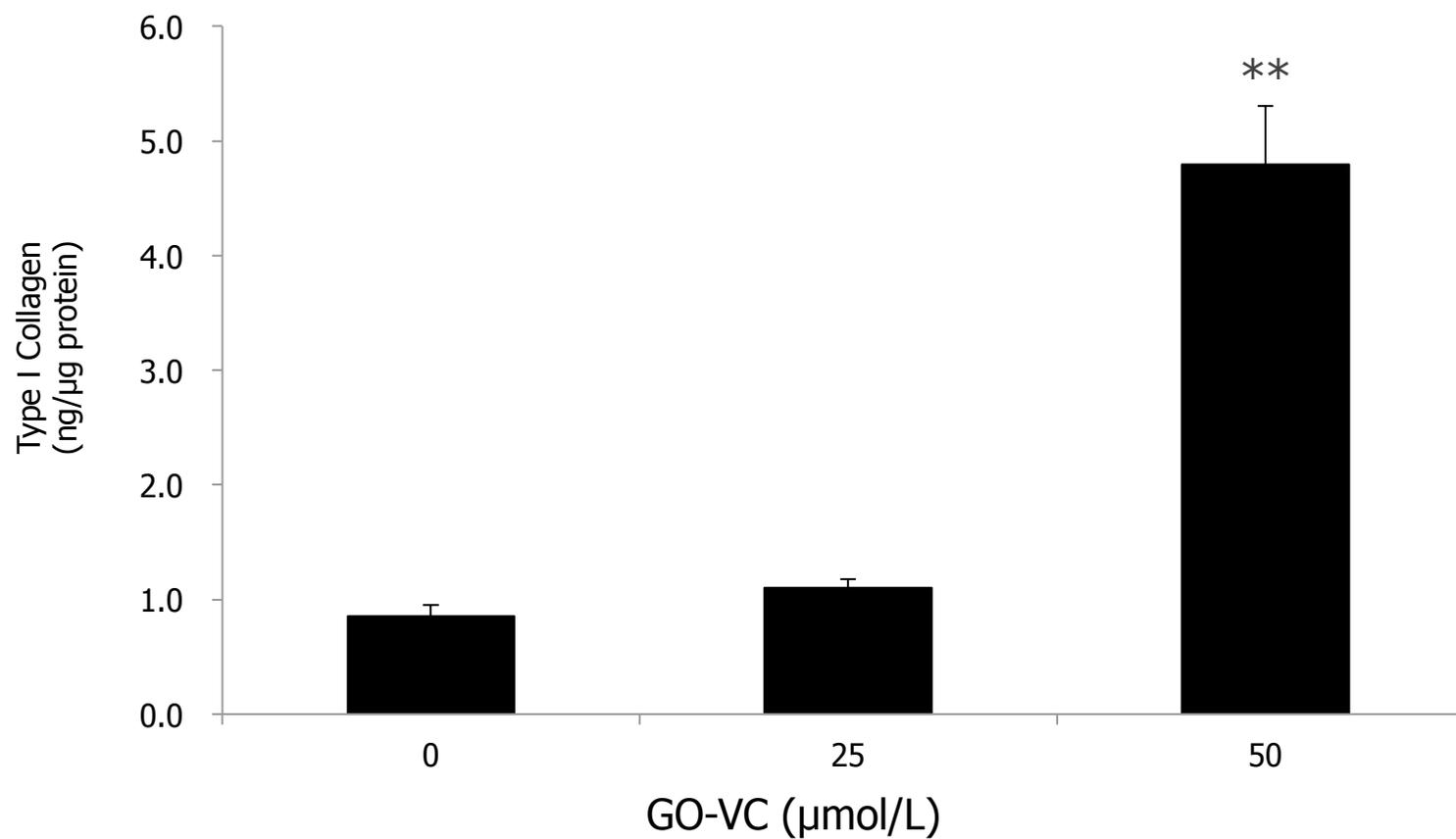
# GO-VCによるメラニン産生の抑制



# GO-VCによる線維芽細胞の増殖の促進効果



# GO-VCによるコラーゲン産生の促進効果

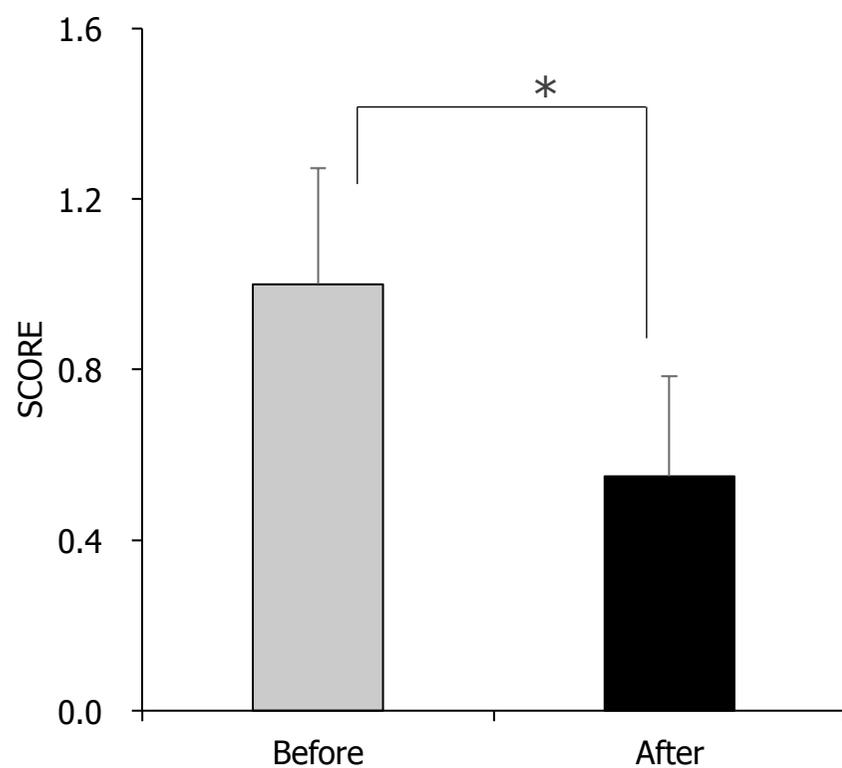


# Clinical Test

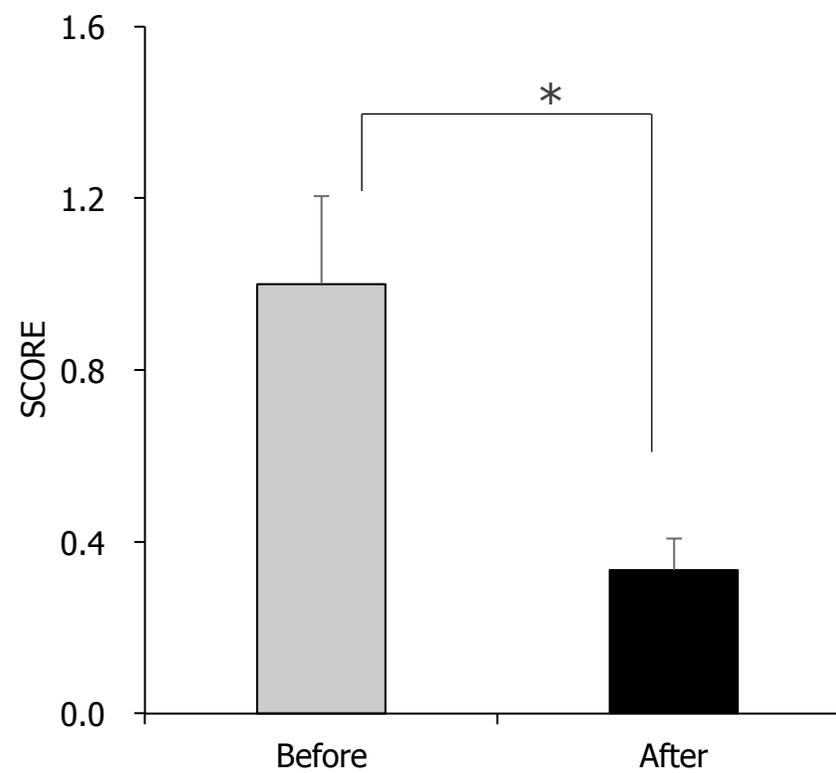
赤み、ニキビに対する改善効果

# D-VCの赤みに対する効果

## 赤みの数

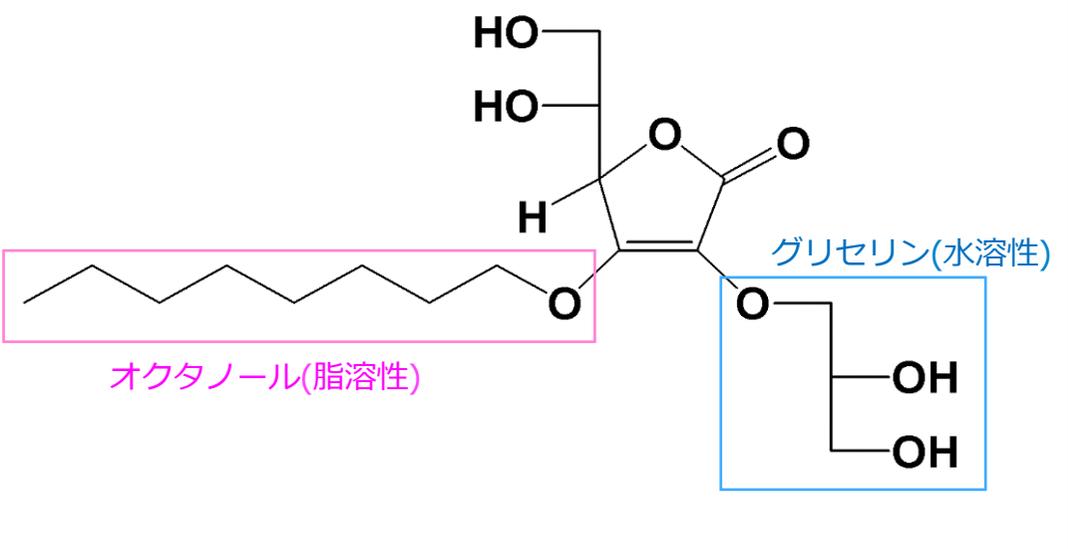


## 赤みの面積



# Summary -GO-VCの機能性-

GO-VCの構造式



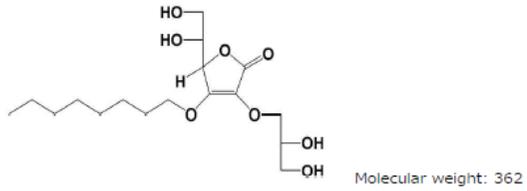
- 両親媒性 (水溶性+脂溶性)
- 高い安定性
- ジェルにも配合可能
- 保湿効果に加え、抗菌活性も期待され
- 線維芽細胞の増殖
- メラニンの抑制
- コラーゲンの増加
- 赤みの減
- ニキビの改善

原材料名 **GO-VC**

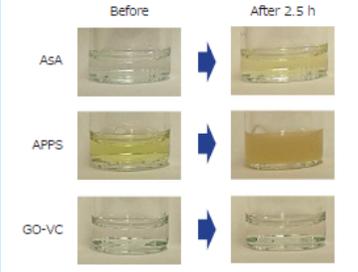
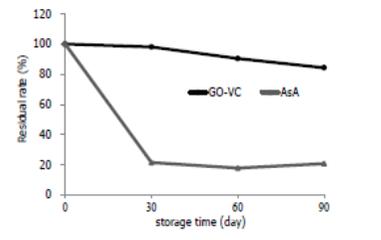
GO-VCはビタミンC(AsA)の2位の水酸基にグリセリン、3位の水酸基にオクタノールが結合した構造をした両親媒性ビタミンC誘導体です。AsAは非常に不安定ですが、GO-VCは従来のビタミンC誘導体以上に安定性に優れています。皮膚生理学的効果に関して、GO-VCはグリセリンが結合していることから、その保湿性が期待でき、AsA誘導体リン酸エステルのナトリウム塩(APS)やマグネシウム塩(APM)などの水溶性AsA誘導体のように肌を顕著に乾燥させてしまう副作用を軽減できる可能性があります。また、抗菌活性を有するオクタノールが結合していることから、抗菌性に関しても期待できます。また、線維芽細胞賦活作用やI型コラーゲン産生促進作用、アルブチンよりも強いメラニン産生抑制効果が確認されており、臨床試験においても0.1%と低い濃度で赤みに対して効果を発揮することが確認されています。

また、GO-VCは化粧水や美容液、クリーム、ジェルなど幅広い化粧品基材に配合が可能です。水溶性AsA誘導体のAPSやAPMなどはイオン性のため、水溶性高分子配合剤に添加した場合には粘度の変化や沈殿を引き起こしてしまう可能性があります。インソルビルミチン酸アスコルビル(VCI)などの脂溶性のAsA誘導体はほとんど水に溶けないため、イオン性分子になることは稀ですが、乳化することなく化粧水などの水溶性剤に配合することは困難です。一方で、GO-VCはAsAのイオン性の強い2つの水酸基がグリセリンとオクタノールで置換されているため、水溶性高分子配合剤に粘度を低下させることなく配合することが可能です。また、完全に非イオン性ではなく、微弱にマイナスの電荷をもっていると考えられるため、イオン導入も可能であると考えられます。

構造と効果 | GO-VC



RESULTS (stability-data)



**GO-VCはビタミンCよりも高い安定性を示す**

ビタミンC(AsA)及びGO-VCを2%含む水溶液(pH5)を50℃で90日間保存後、HPLCにより各残存量を測定したところ、30日の時点でAsAでは残存量が30%以下まで減少していたのに対して、GO-VCは90%以上の残存量が確認されました。また、90日後もGO-VCは80%以上の残存量が確認されました。つまり、GO-VCはAsAと比較して、安定性が非常に高いことが確認されました。

**GO-VCは100℃で2.5時間保存しても濁らない**

ビタミンC(AsA)、APPS及びGO-VCを5%含む水溶液を100℃で2.5時間保存したところ、AsAは濁変がみられ、APPSでは濁変と濁りがみられました。一方で、GO-VCは全く濁変がみられず、濁りも確認されませんでした。

化粧品原料データシート	
商品名	GO-VC
表示名称	カプリリル2-グリセリルアスコルビン酸
INCI	CAPRYLYL 2-GLYCERYL ASCORBATE
CAS	1359731-61-5
定義	本品は、アスコルビン酸(*), グリセリン(*), オクタノール(*)からなる
性状	無色～淡黄色の液体
全成分	
配合目的	抗酸化、美白、抗しわ、抗ニキビ、保湿
配合推奨量	0.05~0.1 %
用途	化粧品
製造注意	特に無し
配合注意	特に無し
保管注意	直射日光を避け、密閉容器にて冷蔵(4℃程度)保管する ポイラー等の熱源付近や可燃物の近くに置かない
危険物性	特に無し
毒性	ヒト皮膚感受性 (RIPT) : 感受性無し (有効成分 20 %水溶液) 眼刺激性 (BCOP) : 刺激性無し (有効成分 0.5 %水溶液) 遺伝毒性 (AMES) : 変異原性無し ヒトパッチ : 刺激性無し (有効成分 20 %水溶液)
備考	特に無し

MEMO

I.T.O Provitamin, 株式会社 アイ・ティー・オー  
〒180-0006 東京都武蔵野市中町1-6-7-3F  
Tel 050-3540-8236 Fax 050-3665-7635

Tel 0120-31-6588  
E-mail ito@provitamin.jp

<http://ito-provitamin.jp>

**No.011 RESULTS (viscosity-data)**

**GO-VCはジェルなどの水溶性高分子配合剤の粘度を低下させない**

ビタミンC(ASA)、APS、AA2G、VCIP、APPS及びGO-VCを5%の濃度でジェル製剤に添加したところ、ASA、APS、AA2Gはジェル基材の粘度を低下させました。また、VCIPは粘度の低下はおきませんでした。乳白色化を引き起こしました。APPSは若干の粘度低下と乳白色化を引き起こしました。一方で、GO-VCは粘度低下を引き起こすことなく、透明にジェル基材に配合することができました。

**RESULTS (in vitro-data)**

**GO-VCによるメラニン産生抑制効果**

B16メラノーマ4A5細胞をアルブチン、ハイドロキノン及びGO-VCで72時間処理後、細胞内のメラニン量を測定しました。その結果、GO-VCは濃度依存的にメラニン産生を抑制し、美白剤として有名なアルブチンよりも低濃度で効果を発揮しました。

The lines on the columns show SD (n = 4). \*\* indicates that the probabilities of significance levels are less than 0.01 (p < 0.01) between individual Sample concentration and the control, respectively.

Substance	Concentration (µmol/L)	Melanin suppressing rate (%)
Arbutin	300	~22
	1000	~60**
Hydroquinone	10	~40**
	30	~65**
GO-VC	10	~15
	100	~45**

**GO-VCによる繊維芽細胞賦活化作用**

正常ヒト線維芽細胞NHDF を10~300µmol/LのGO-VCで48時間処理後、MTTアッセイ法にて細胞増殖率を測定しました。その結果、10~300µmol/L全ての濃度で細胞増殖率の有意な増加が確認されました。

The lines on the columns show SD (n = 4). \*\* indicates that the probabilities of significance levels are less than 0.01 (p < 0.01) between individual Sample concentration and the control, respectively.

GO-VC (µmol/L)	Fibroblast-proliferation rate (%)
0	100
10	~108**
30	~105**
100	~108**
300	~115**

**GO-VCによるI型コラーゲン産生促進効果**

正常ヒト線維芽細胞NHDF を20、50 µmol/LのGO-VCで24時間培養し、ELISAによりI型コラーゲン量を測定しました。その結果、50 µmol/Lにて有意な増加が確認されました。つまり、GO-VCによるI型コラーゲン産生促進効果が確認されました。

The lines on the columns show SD (n = 5). \* indicates that the probabilities of significance levels are less than 0.05 (p < 0.05) between individual Sample concentration and the control, respectively.

GO-VC (µmol/L)	Type I Collagen (ng/ug protein)
0	~0.8
25	~1.0
50	~4.8**

**RESULTS (clinical-data)**

洗顔後0.1%GO-VC配合ジェルを朝晩1日2回塗布を行いました。期間は1~4ヶ月で、被験者は6名。評価方法は、皮膚画像解析装置ロボスキンアナライザーによって赤みに対してスコア化しました(おさめスキンクリニック(東京、渋谷区)、院長 納 さつき 先生提供データ)。

**GO-VCによる赤み減少効果 (皮膚画像解析装置ロボスキンアナライザーによる評価)**

赤みの数及び面積ともに有意な減少がみられました。n = 6 Mean±SE \*p<0.05 Wilcoxon signed-rank test)

**Before** **After**

**GO-VCによるメラニン産生抑制効果** 赤みの低減がみられ、顕著なニキビ改善効果が確認されました。