

USO: Interno**CAS:** 59-67-6**Fator de Correção:** N.A.**FM:** C6H5NO2**Fator de Equivalência:** 1,00**PM:** 123,11**DCB:** 59-67-6

NIACINA OU ÁCIDO NICOTÍNICO

VITAMINA B3 NA FORMA ÁCIDA

A Vitamina B3 existe na forma ácida (Ácido Nicotínico ou Niacina) e na forma de amida (Nicotinamida, Niacinamida ou Vitamina PP). A forma ácida (Niacina) apresenta efeito vasodilatador e se ingerido a partir de determinadas doses produz dentre outros efeitos adversos o rubor facial, já a Nicotinamida não produz estes efeitos adversos.

A Niacina apresenta ação vasodilatadora e anti-hiperlipidêmica. É usada para corrigir a deficiência de Ácido Nicotínico, na prevenção e tratamento da pelagra. É também empregada como terapia adjuvante em pacientes com hiperlipidemia e em associação com outros vasodilatadores (ex. papaverina).

A forma de Ácido Nicotínico (Niacina) é reservada principalmente para hiperlipidemia e quando se deseja uma atividade vasodilatadora. Já a Nicotinamida que corresponde à amida do Ácido Nicotínico, não apresenta atividade anti-hiperlipidêmica e tampouco vasodilatadora (portanto não apresenta os efeitos adversos decorrentes da vasodilatação), mas também é indicada na profilaxia e tratamento da pelagra, assim como a Niacina. De forma geral, em suplementos polivitamínicos, é recomendável a utilização da Vitamina B3 na forma de Nicotinamida.

Apresentação

Pó cristalino branco a quase branco.

Aplicações

- ✓ Vasodilatação;
- ✓ Hipercolesteremia;
- ✓ Hipolipemiante;
- ✓ Labirintite;
- ✓ Memória.



Recomendação de uso

A Vitamina B3, na forma ácida ou amida, é normalmente administrada na faixa de 20 a 100mg ao dia para o tratamento e prevenção dos estados de sua deficiência.

Nas hiperlipidemias a Niacina é empregada em doses iniciais de 375 a 500mg administradas à noite durante 1 mês e aumentada de acordo com a resposta para uma dose de manutenção de 1 a 2g administradas à noite. A dose diária não deve ser aumentada mais de 500mg em cada período de 4 semanas.

Farmacologia

A Vitamina B3 é uma vitamina solúvel, que atua no organismo em diversas reações metabólicas. As principais são aquelas envolvidas com a produção de energia por fazer parte de duas coenzimas: a Nicotinamida Adenina Dinucleotídeo (NAD) e fosfato de Nicotinamida Adenina Dinucleotídeo (NADP). Estas coenzimas participam da transferência de elétrons na cadeia respiratória.

Farmacocinética

Após administração oral, a Niacina é absorvida facilmente no tubo digestivo e distribuída amplamente nos tecidos corporais.

A Niacina se distribui no leite materno.

A via principal de metabolismo é sua conversão a N-metilnicotinamida e derivados 2-piridona e 4-piridona; também se forma ácido nicotínico.

Em doses terapêuticas, pequenas quantidades de Niacina, são excretadas pela urina, de forma inalterada. Em doses mais altas, a forma inalterada de Niacina é excretada também em maior quantidade.

Advertência

Os efeitos adversos mais comuns da Niacina são: prurido, rubor facial, cefaléia, parestesias, náuseas e outros sintomas de irritação gástrica. Doses altas podem ativar úlcera péptica, produzir lesão hepática e hiperuricemia, ou prejudicar a tolerância à glicose. Entre as duas formas clássicas de liberação da Niacina encontra-se a forma de liberação intermediária ou estendida. A mesma é absorvida num período de 8 a 12 horas, intermediário entre a niacina cristalina e a lenta. Esta deve ser ingerida uma vez por dia e é a única formulação aprovada pelo FDA para tratamento das dislipidemias.

Contra-indicações

Doença hepática crônica e gota grave são contra-indicações absolutas da Niacina. A hiperuricemia e o diabetes não contra-indicam o uso do medicamento.

Efeitos adversos

O uso da Niacina de liberação rápida é limitado pela alta taxa de efeitos colaterais (10-50% dos casos de interrupção do tratamento): rubor, calor, prurido, náusea, dispepsia, dor abdominal e diarreia. Em comparação com a formulação de liberação rápida a forma lenta não causa "flushing", contudo, cerca de 75% dos participantes de estudos randomizados apresentaram aumento das aminotransferases três vezes o limite superior do normal, sendo que muitos apresentaram sinais de insuficiência hepática. Outro efeito colateral descrito com o uso da Niacina de liberação imediata é a hiperglicemia.

Outros possíveis e raros efeitos colaterais com as diversas formulações de Niacina são a hiperuricemia, gota, arritmias cardíacas, tontura, calafrios, edema, cefaléia, e ativação de úlcera péptica.

Formas Farmacêuticas de Interesse e Farmacotécnica Aplicada**Cápsulas de liberação lenta com Ácido Nicotínico**

Ácido nicotínico	375 – 500 mg
HPMC (Methocel E4M Premium)	140mg (cps 0) ou 200mg (cps 00)
Lactose monoidratada qsp	1 cápsula

OBS: Esta manipulação é preparada para minimizar efeitos adversos associados ao alto pico plasmático promovidos por determinados fármacos, como ácido nicotínico (IJPC, 1999).

⇒ As cápsulas de liberação lenta minimizam os efeitos adversos relacionados ao ácido nicotínico como, "flushing" (rubor facial), náusea dentre outros.

Associação do ácido nicotínico com papaverina

Ácido nicotínico	15mg
Cloridrato de papaverina	50mg
Excipiente qsp	1 cápsula

Indicação: medicação antiespasmódica e vasodilatadora, tratamento da hipertensão arterial.

Posologia: tomar às refeições 1 a 4 cápsulas, 3 x ao dia ou a critério médico.

Associação ácido nicotínico, papaverina e vitamina B6

Ácido nicotínico	15mg
Cloridrato de piridoxina	100mg
Cloridrato de papaverina	50mg
Excipiente qsp	1 cápsula

Indicação: Anti-isquêmico, antiateromatoso e anti-hipertensivo. Indicado na senilidade arterial.

Posologia: 4 a 6 cápsulas diariamente.

Referências Bibliográficas

1. Batistuzzo.J.A.O.Itaya.M.Eto.Y.FORMULÁRIO MÉDICO FARMACÊUTICO.3ª edição.São Paulo:Tecnopress,2006.
2. França, F.F.A.C. Andrejus Korolkovas – Dicionário Terapêutico Guanabara. Edição 2004/2005. Rio de Janeiro: Guanabara Koogan, 2004.
3. McKenney J. New perspectives on the use of niacin in the treatment of lipid disorders. Arch Intern Med. 2004;164:697-705.
4. MONOGRAFÍAS FARMACÊUTICAS.1º edição. Colégio Oficial de Farmacêuticos de La Provincia de Alicante, 1998.
5. Krinsky, D.L.. et al. Natural Therapeutics Pocket Guide. 2nd ed. Hudson: APHA, 2003.
6. Sweetman.C.S. Martindale – GUIA COMPLETA DE CONSULTA FARMACOTERAPEUTICA. 1º edição.Barcelona(Espanha): Pharma Editores, 2003.
7. The Merck Index,p.1120, item.6612, 12.ed, 1996.

Última atualização: 09/07/2012 DP
21/07/17 SY

