

## Azeloglicina<sup>®</sup>

**Clareador, sebonormalizante, antiacnéico e hidratante**

*INCI Name: potassium azeloyl diglycinate.*



### Definição

**Azeloglicina<sup>®</sup>** é o diglicinato de azeloil potássio, um ativo dermocosmético derivado da condensação do ácido azeláico com a glicina.

O sal é obtido pela reação entre a glicina previamente clorada, ácido azeláico e o hidróxido de sódio de potássio em meio suficientemente aquoso para favorecer a reação.



### Propriedades

**Azeloglicina<sup>®</sup>** é um ativo clareador; sebonormalizante; antiacnéico e anti-queratinizante. Melhora a hidratação e a elasticidade da pele. Não é comedogênico, e é hipoalergênico. Além disso, é hidrossolúvel, sendo facilmente incorporada nas formulações, não apresentando problemas farmacotécnicos, muito comuns quando se manipula o ácido azeláico.

**Propriedade clareadora:** A **Azeloglicina<sup>®</sup>** tem potencial terapêutico na rosácea e nas desordens hiperpigmentantes. A utilização da **Azeloglicina<sup>®</sup>** em produtos tópicos está relacionada ao fato do ácido azeláico naturalmente produzido pelo *Pityrosporum ovale*, ser uma causa conhecida de um dos desequilíbrios da pele, denominado *pityriasis versicolor*, que se caracteriza pelo aparecimento de manchas leucodérmicas por falta da melanina. Esta despigmentação da pele se deve à inibição da tirosinase pelo ácido azeláico. A **Azeloglicina<sup>®</sup>** imita a natureza e também inibe a tirosinase exercendo assim sua ação clareadora.

A resposta da **Azeloglicina<sup>®</sup>** pode ser notada em apenas 21 dias de aplicação contínua, não só pelo clareamento como também pelo bloqueio do avanço da mancha. Os resultados máximos se concretizam após 2 a 3 meses, quando a **Azeloglicina<sup>®</sup>** além de prevenir o aparecimento de novas manchas, continua exercendo sua ação clareadora sobre as manchas existentes.

**Propriedade sebonormalizante: Azeloglicina<sup>®</sup>** reduz os níveis de ácidos graxos livres no sebo, ao mesmo tempo em que reduz o número de *Propionibacterium* e *Micrococci* intrafoliculares, sem interferir na produção sebácea normal. Sabe-se que o efeito redutor da **Azeloglicina<sup>®</sup>** sobre os ácidos graxos se deve à inibição competitiva da 5-alfa-redutase, bloqueando a conversão da testosterona a diidrotestosterona (DHT). A ação normalizadora de lipídeos é muito evidente na região da testa e do queixo.

**Propriedade antiacnéica: Azeloglicina<sup>®</sup>** interfere na patogênese da acne por sua propriedade anti-queratinizante, antibacteriana; antiinflamatória e sebonormalizante. Em baixas concentrações, a **Azeloglicina<sup>®</sup>** apresenta propriedades bacteriostáticas contra uma extensa variedade de aeróbios *S. aureus*, *S. epidermidis*, *E. coli*, *P. aeruginosa*, *C. albicans* e anaeróbios (*Propionibacterium acnes*).

Em altas concentrações, age como bactericida contra *S. epidermidis* e *S. aureus*.

**Propriedade anti-queratinizante: A Azeloglicina<sup>®</sup>** é um agente anti-queratinizante devido ao seu efeito citostático antiproliferativo sobre os queratinócitos.

**Propriedade hidratante: A Azeloglicina<sup>®</sup>** hidrata a pele e dá mais elasticidade porque está ligada a duas moléculas de glicina.



## Avaliação da eficácia

O objetivo deste estudo foi avaliar a eficácia clareadora da **Azeloglicina<sup>®</sup>** em pele hiperpigmentada e normal.

Uma solução aquosa na concentração de 3% de **Azeloglicina<sup>®</sup>** foi preparada e aplicada em cinco voluntários. Esta solução foi aplicada em pontos hiperpigmentados no dorso de suas mãos e em regiões de pele normal. As regiões foram cuidadosamente selecionadas e suas localizações anotadas.

O tratamento foi realizado com duas aplicações diárias da solução de **Azeloglicina<sup>®</sup>**. Após três semanas de tratamento, foi realizado o acompanhamento da cor da pele utilizando um colorímetro.

Os parâmetros utilizados no colorímetro foram a luminosidade (Fig 1), faixa vermelho-verde e faixa amarelo-azul que juntas definem a cor da pele. A referência interna para a realização das medidas foi a pele não tratada monitorada no início e no final do tratamento.

Como resultado, obteve-se um aumento significativo da luminosidade em todas as áreas em que a **Azeloglicina<sup>®</sup>** foi aplicada. A eficácia do clareamento também ficou evidente na faixa

vermelho-verde que mostrou uma diminuição de 10,1% na pigmentação das manchas e 12,2% na pigmentação da pele normal.

ISPE Study 104/97/00 (Oct 8, 1997).

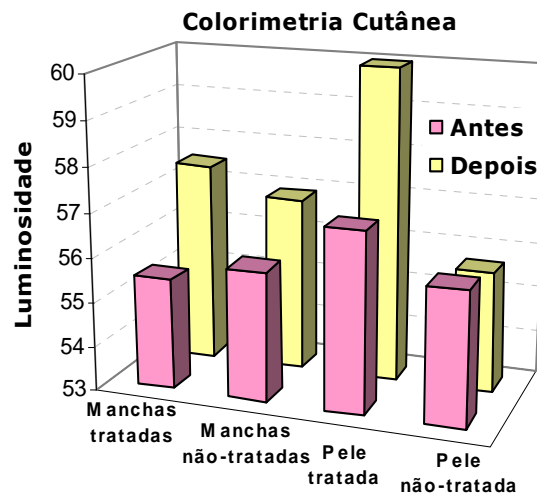


Fig.1 Avaliação do efeito clareador na pele.

### Avaliação do efeito sebonormalizante

O objetivo deste estudo foi avaliar a eficácia sebonormalizante da **Azeloglicina**<sup>®</sup>. Uma solução aquosa na concentração de 3% de **Azeloglicina**<sup>®</sup> foi preparada e aplicada em cinco voluntários que possuíam pele oleosa e afetada pela acne, duas vezes ao dia por um período de três semanas.

Utilizando um sebometer, foi analisado os níveis de lipídio cutâneo na testa, nariz e queixo. Como resultado, foi obtido uma redução dos lipídios cutâneos de 29,4%, 27,0% e 31,3% na testa, nariz e queixo, respectivamente. Nota-se que a **Azeloglicina**<sup>®</sup> é efetiva no tratamento de pele oleosa afetada com acne, reduzindo significativamente o excesso de lipídio cutâneo. ISPE Study 102/97/00 (Oct 8, 1997).

### Avaliação do efeito sobre a hidratação e elasticidade

O objetivo deste teste foi verificar a atividade da **Azeloglicina**<sup>®</sup> na manutenção na elasticidade, hidratação e suavidade da pele. Uma solução aquosa na concentração de 3% de

**Azeloglicina**<sup>®</sup> foi preparada e aplicada em cinco voluntários em áreas específicas da face, duas vezes ao dia por três semanas.

Como resultado, foi verificado que os valores de umidade basal da pele tiveram um aumento 12,7% na testa e 8,2% na bochecha e a viscoelasticidade na testa aumentou 2,5%.

ISPE Study 103/97/00 (Oct 8, 1997).

Nota-se pelos estudos clínicos que a **Azeloglicina**<sup>®</sup> possui todas as propriedades do Ac.Azeláico e ainda características adicionais de um ingrediente multifuncional

## **Avaliação toxicológica**

### **A) Irritação da pele**

Para a realização deste teste, foram selecionadas 20 pessoas e nelas foi aplicado um patch oclusivo com **Azeloglicina**<sup>®</sup> (30% ativa) por um período de 48 horas. A atividade irritante foi avaliada clinicamente 30 minutos após aplicação para avaliar o efeito irritativo imediato e após 48 horas.

Nenhum sinal de irritação imediata e/ou provocada por exposição de 48 horas foi apresentado. Portanto, **Azeloglicina**<sup>®</sup> pode ser considerada não-irritante.

ISPE Study 31/98/00 (Feb 23, 1998).

### **B) Hipoalergenicidade**

Este teste visa avaliar se a **Azeloglicina**<sup>®</sup> possui também uma ou até uma mistura de substâncias que podem se apresentar como alérgenos.

Para a realização deste teste, foram selecionadas 20 pessoas e nelas foi aplicado um patch oclusivo com **Azeloglicina**<sup>®</sup> (30% ativa) por um período de 48 horas. Depois de retirado o patch, as reações induzidas na pele foram avaliadas por 24 e 48 horas.

Nenhuma reação alérgica foi observada, concluído que a **Azeloglicina**<sup>®</sup> é hipoalergênica.

ISPE Study 52/01/01 (Mar 21, 2001).

### **C) Irritação dos Olhos**

O potencial irritante de membrana de mucosa foi avaliado observando os efeitos ocorridos na membrana corialantóica de ovo após exposição a **Azeloglicina**<sup>®</sup>. Os resultados possibilitaram concluir que **Azeloglicina**<sup>®</sup> pode ser vista como não irritante de membranas mucosas.

ISPE Study 26/98/00 (Mar 6, 1998).



## Indicações e aplicações

Devido às propriedades acima, a Azeloglicina<sup>®</sup> é indicada no bloqueio, redução e prevenção das manchas de pele; como normalizador da secreção sebácea; no tratamento e na prevenção da acne e como adjuvante na redução de rugas.

**Azeloglicina<sup>®</sup>** deve ser usada com cuidado em mulheres grávidas ou lactantes. A relação risco/benefício nesses casos deve ser discutida com o médico.



## Concentração de uso e recomendações farmacotécnicas

A **Azeloglicina<sup>®</sup>** pode ser usada em sistemas hidrofílicos como soluções aquosas, géis, cremes e emulsões O/A (fluidas ou cremosas, não iônicas, aniônicas simples ou compostas) nas faixas de 3 a 10%.

NOTA: **Azeloglicina<sup>®</sup>** não necessita de correção para as doses acima recomendadas. Caso se deseje a concentração em termos do ativo (*Diglicinato de Azeloil Potássio*), será necessário fazer conversão. Considerar a pureza do produto indicada no laudo (28 a 32%).

O uso de **Azeloglicina<sup>®</sup>** não é indicado em emulsões A/O ou sistemas lipídicos anidros.

A **Azeloglicina<sup>®</sup>** deve ser incorporada somente à temperatura ambiente.

A incorporação da **Azeloglicina<sup>®</sup>** em gel pode provocar queda na viscosidade do mesmo. Se o problema ocorrer com o gel de Natrosol, recomenda-se aumentar a concentração do Natrosol para 2,5 a 3%. Se o problema ocorrer com o gel de Carbopol, sugere-se substituí-lo pelo gel de Natrosol.

O fabricante não recomenda a associação da **Azeloglicina<sup>®</sup>** com hidroquinona devido a sua propriedade citotóxica, o que não acontece com a **Azeloglicina<sup>®</sup>**. Além disso, a **Azeloglicina<sup>®</sup>** é estável, enquanto a hidroquinona pode oxidar-se.

As associações de **Azeloglicina<sup>®</sup>** com ácido kójico ou ácido glicólico também não são recomendadas pelo fabricante.

A associação da **Azeloglicina<sup>®</sup>** com os alfa-hidroxiácidos também não é recomendada pelo fabricante, por serem estáveis em pH de 2-4, enquanto que a **Azeloglicina<sup>®</sup>** possui faixa de pH de estabilidade de 5 a 11.



## Sugestões de formulação

### Gel-creme hidratante, clareador e antiacnéico

<b>Azeloglicina<sup>®</sup></b>	8,0%
Elastocell <sup>®</sup>	5,0%
Gel-creme Nikkomulse 41 <sup>®</sup> com Plurigel <sup>®</sup>	qsp 100%

pH de estabilidade: 6,0 – 7,0

**Comentários:** A **Azeloglicina**<sup>®</sup> associada ao Ellastocell<sup>®</sup> resulta em uma formulação perfeita, onde os ativos se complementam e potencializam-se mutuamente. Esta formulação dispensa o uso de antioxidantes, pois a glicina apresenta uma atividade antimicrobiana. O gel-creme Nikkomulse 41<sup>®</sup> com Plurigel<sup>®</sup> possui toque seco e agradável para peles mistas a oleosas.

### **Gel-creme *oil-free* antiacnéico**

<b>Azeloglicina</b> <sup>®</sup>	6,0%
Tiolisina Complex 30 <sup>®</sup>	3,0%
Net FS <sup>®</sup>	4,0%
Gel de Natrosol	qsp 100%

*pH de estabilidade: 6,0 – 7,0*

**Comentários:** Formulação contendo **Azeloglicina**<sup>®</sup>, que apresenta efeitos clareadores, sebonormalizantes e anti-acnéico, Tiolisina Complex 30<sup>®</sup>, um sebonormalizante hidrossolúvel. Em uma base de gel creme com Natrosol e Net FS<sup>®</sup>.



### **Referências bibliográficas**

Literatura do fabricante – Sinerga (Itália).

Cosmetics & Toiletries magazine, Vol. 117, N<sup>o</sup>3, p. 43-50, march 2002.

Alcântara Rua Yolanda Saad Abuzaid, 150, lojas 118/119. Telefone (21) 2601-1130

Centro / Zé Garoto Rua Coronel Serrado, 1630 lojas 102/103. Telefone (21) 2605-1349



vendas@farmacam.com.br



whatsapp (21) 98493-7033



Facebook.com.br/farmacam



Instagram.com.br/farmacam