

PHOSAL® 50SA

SISTEMA MISTO DE NANOEMULSÃO COM LIPOSSOMAS CARREADOR E SOLUBILIZANTE

INCI: *Lecithin, soybean, in etanol*

Descrição: 50% de fosfatidilcolina, 6% de lisofosfatidilcolina, 2 a 4% etanol

Phosal® 50SA é fosfatidilcolina solubilizada em sistema carreador com óleo de cartamo. A linha **Phosal®** é composta por produtos que são soluções altamente concentradas de fosfatidilcolina pura e insaturada. Ela oferece altas concentrações de fosfatidilcolina livre em solução de fácil manipulação e incorporação em formulações cosméticas como cremes e loções.

O sistema carreador anidro usado na linha **Phosal®** é composto de ingredientes naturais de grau alimentício e tem sido usado como material de partida para produção de lipossomas e nanoemulsões. Em virtude de sua alta concentração de fosfatidilcolina e ingredientes carreadores cuidadosamente selecionados, eles não são apenas eficientes veículos ou estabilizantes de substâncias ativas, mas também, conferem maciez e sensorial agradável para cosméticos em geral.

Recomendação de uso

De 1 a 100%, sendo que para géis transdermicos e como carreador de ativos em geral, normalmente utiliza-se até 20%, e para produtos de uso interno, pode ser utilizado até mesmo puro.

Aplicações

Phosal® 50SA é indicado como solubilizante de ativos lipofílicos, carreador.

Este composto representa uma ferramenta ideal para incorporação e emulsificação de ativos lipofílicos, como por exemplo, vitaminas, óleos essenciais, ceramidas entre outros e ou ingredientes hidrofílicos,

Aplicação oral: cápsulas oleosas, xaropes, líquidos orais, etc.

Aplicação tópica: cremes, loções, pomadas e demais sistemas emulsionantes.

Ativos lipofílicos podem ser incorporados diretamente em **Phosal® 50SA**, antes de emulsificá-lo com a fase aquosa. O processo de manipulação pode ser feito em temperatura ambiente, a menos que a substância ativa requeira aquecimento para solubilização.

Vantagens

- ✓ Biocompatibilidade
Por ser composto por fosfatidilcolina, que é um componente presente em todas as membranas celulares do corpo humano, **Phosal® 50SA** é 100% biocompatível afirmando sua eficácia como agente de penetração de uso tópico.
- ✓ Versatilidade
Apesar de sua característica lipofílica, não é certo dizer que **Phosal® 50SA** não consiga emulsionar produtos com característica hidrofílica. Isso se deve a sua composição de nano emulsão.
- ✓ Duplo uso
Pela origem e método de fabricação da linha **Phosal® 50SA**, ele pode ser usado tanto para uso tópico como por via oral. É excelente solubilizante de vitaminas nas mais diversas formulas. É o solubilizante de escolha para cápsulas oleosas, por exemplo. É super seguro sendo 100% derivado lecitina de soja, largamente utilizada por industrias de alimento, farmacêuticas, cosméticas, etc.

Mecanismo de ação

Lecitina

A lecitina representa uma mistura de lipídeos polares e apolares onde o conteúdo de lipídeos polares (= insolúveis em acetona) deve ser de pelo menos 60% (de acordo com monografia na farmacopéia européia - EU). A lecitina pode ser isolada não apenas da gema do ovo, como também de cérebro, ovas de peixe, sangue e semente de plantas. O desenvolvimento de procedimentos de separação da fração de lecitina do óleo das sementes foi um avanço importante para a produção de lecitina em escala industrial. O mais importante caminho para o isolamento de Lecitina é através da soja.

Fosfolipídeos

O lipídeo contendo fósforo encontrado na lecitina foi designado com o termo "fosfolipídeo" (fosfoglicerídeos). Junto com os glicolipídeos e esfingolipídios, eles representam a fração dos lipídeos polares presentes na lecitina e são componentes essenciais de todas as membranas de células. Os glicerofosfolipídeos são os grupos predominantes de substâncias encontradas na lecitina disponível comercialmente e contêm uma região polar (hidrofílica) e uma apolar (lipofílica). A região apolar é formada por duas moléculas de ácidos graxos. A região polar consiste de um grupo fosfato e de um álcool. Os vários fosfolipídeos são diferenciados principalmente pela natureza do grupo álcool polar.

Se o grupo álcool é:

- colina, o fosfolipídeo correspondente é denominado de fosfatidil colina;
- etanolamina, o fosfolipídeo correspondente é denominado de fosfatidil etanolamina;
- inositol, o fosfolipídeo correspondente é denominado fosfatidil inositol.

Em termos de propriedades tecnológicas, os fosfolipídeos são os ingredientes ativos essenciais da lecitina. Enquanto que a denominação lecitina descreve as misturas de lipídios polares e não polares, o termo fosfolipídeo se refere às substâncias claramente caracterizadas e com propriedades que são reproduzíveis. Nós obtemos nossos fosfolipídeos através de um processo brando e que respeita o meio ambiente (fracionamento/extração), de lecitina derivada dos feijões de soja.

LECITINA/FOSFOLIPÍDEOS: Avaliação de segurança

A lecitina de soja e lecitina de gema de ovo são frequentemente utilizados em alimentos, produtos farmacêuticos e cosméticos. As lecitinas, assim como seus ingredientes - os fosfolipídeos - são aditivos alimentares (E 322) e são usados como agentes de preparo instantâneo (melhorando dispersão e umedecimento), agente de separação, umidificante e emulsificante. No ramo farmacêutico, a lecitina é utilizada como único emulsificante para a produção de emulsões lipídicas para nutrição parenteral. Aqui a lecitina é utilizada há mais de 30 anos. O WHO (*World Health Organization*) considera lecitina de soja e de gema de ovo nas formas insaturada e hidrogenada uma substância não tóxica. O WHO não estabeleceu limites na administração oral e não existe ADI (limite diário aceitável) para lecitina como aditivo alimentar [63]. O FDA conferiu ainda *status* GRAS (*Generally Recognized as Safe*) para lecitina. O Alemão Bundesgesundheitsamt (BGA, atualmente BGVV) publicou uma monografia para fosfolipídeos de soja com 73 - 79 % de fosfatidilcolina [64]. Esta monografia que revela a farmacocinética e toxicologia de fosfolipídeos aplicados oralmente. Estes dados levam às seguintes afirmações sobre os fosfolipídeos:

- ✓ não se conhece mutagenicidade em testes *in vitro*
- ✓ nenhuma contra-indicação conhecida
- ✓ nenhuma particular precaução quanto ao uso
- ✓ não há limitação quanto ao uso durante a gravidez
- ✓ nenhuma interação conhecida com drogas medicinais ou outras substâncias
- ✓ nenhuma overdosagem conhecida
- ✓ nenhuma particular precaução requerida

A indústria cosmética também tem utilizado com sucesso os fosfolipídeos para diferentes produtos cosméticos, como lipossomas, condicionador em produtos de cuidado dos cabelos ou emulsificante em cremes. De acordo com nosso conhecimento atual, nenhuma intolerância dérmica de natureza tóxica causada por fosfolipídeos pode ser observada. Resumindo, fosfolipídeos de soja e de gema de ovo não são tóxicos em animais e humanos, em todas as formas de administração conhecidas.

Teste de solubilidade – testes gerais

TESTE 01: HIDROCORTISONA ACETATO + Phosal® 50SA		
FÓRMULA	CONCENTRAÇÃO	OBSERVAÇÕES
Hidrocortisona acetato	1,0%	Perfeita solubilização em Phosal® 50SA , facilidade de incorporação na base, formulação com coloração branca.
Phosal® 50SA	2,0%	
Nostrabase® Creme Não Iônico	QSP	

TESTE 02: HIDROCORTISONA ACETATO + Phosal® 50SA		
FÓRMULA	CONCENTRAÇÃO	OBSERVAÇÕES
Hidrocortisona acetato	1,0%	Perfeita solubilização em Phosal® 50SA , facilidade de incorporação na base, formulação com coloração amarelada.
Phosal® 50SA	8,0%	
Nostrabase® Creme Não Iônico	QSP	

TESTE 03: HIDROCORTISONA ACETATO + Phosal® 50SA		
FÓRMULA	CONCENTRAÇÃO	OBSERVAÇÕES
Hidrocortisona acetato	1,0%	Perfeita solubilização em Phosal® 50SA , facilidade de incorporação na base, formulação com coloração amarelada.
Phosal® 50SA	2,0%	
Nostrabase® Facility	QSP	

TESTE 04: ESTRADIOL BASE + Phosal® 50SA		
FÓRMULA	CONCENTRAÇÃO	OBSERVAÇÕES
Estradiol base	1,0%	Perfeita solubilização em Phosal® 50SA , facilidade de incorporação na base, formulação com coloração amarelada.
Phosal® 50SA	3,0%	
Nostrabase® Facility	QSP	

TESTE 05: ESTRADIOL BASE + Phosal® 50SA		
FÓRMULA	CONCENTRAÇÃO	OBSERVAÇÕES
Estradiol base	1,0%	Perfeita solubilização em Phosal® 50SA , facilidade de incorporação na base, formulação com coloração branca.
Phosal® 50SA	3,0%	
Nostrabase® Gel Creme	QSP	

TESTE 06: ÁCIDO SALICÍLICO + Phosal® 50SA		
FÓRMULA	CONCENTRAÇÃO	OBSERVAÇÕES
Ácido Salicílico	2,0%	Solubilização parcial (presença alguns cristais), quebra de formulação, com tom amarelado.
Phosal® 50SA	8,0%	
Base Gel Creme	QSP	
Phosal® 50SA	10,0%	
Nostrabase® Creme Não Iônico	QSP	

TESTE 07: ÁCIDO SALICÍLICO + Phosal® 50SA		
FÓRMULA	CONCENTRAÇÃO	OBSERVAÇÕES
Ácido Salicílico	2,0%	Solubilização média (presença de alguns cristais se misturado na mão, há necessidade de gral para quebra dos cristais), formulação estável
Phosal® 50SA	20,0%	
Nostrabase® Creme Não Iônico	QSP	

TESTE 08: ALANTOÍNA + Phosal® 50SA		
FÓRMULA	CONCENTRAÇÃO	OBSERVAÇÕES
Alantoína	1,0%	Perfeita solubilização, facilidade na incorporação, e formulação estável.
Phosal® 50SA	3,0%	
Nostrabase® Cold Cream	QSP	

✓ Perfeita solubilização = aspecto de pasta

OBS: Ácido Salicílico em maiores concentrações não teve boa solubilidade em **Phosal® 50SA**.

Testes com hormônios bioidênticos

Hormônio	Solubilidade
Estradiol base	1g hormônio para 8g Phosal® 50SA
Hidrocortisona base	1g hormônio para 2g Phosal® 50SA
Estrona base	1g hormônio para 7g Phosal® 50SA
Estriol base	1g hormônio para 3g Phosal® 50SA
Progesterona base	1g hormônio para 3g Phosal® 50SA
Testosterona base	1g hormônio para 3g Phosal® 50SA
Liotironina Base T-3	1g hormônio para 2g Phosal® 50SA
Levotiroxina Base T-4	1g hormônio para 3g Phosal® 50SA

Referências

Testes feitos no laboratório da Pharma Nostra, baseado na literatura do fornecedor.

Referências bibliográficas

1. Material do Fabricante - Lipoid/ Alemanha.

Última atualização: 03/06/15 MJD
13/07/17 SY