

ÁCIDO ALFA LIPOICO

Atividade antioxidante

Contribui para a regulação da glicemia

Auxilia no gerenciamento do peso corporal

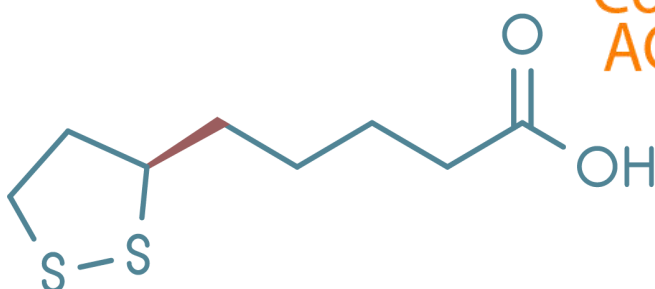
■ O QUE É?

O ácido alfa lipoico (ALA) é um composto dissulfeto que desempenha um papel importante no metabolismo energético celular e na manutenção da homeostase do organismo. Também conhecido como ácido tióctico, o ALA está presente em diversas fontes alimentares (incluindo espinafre, brócolis e tomate), bem como pode ser sintetizado pelas mitocôndrias no organismo humano.

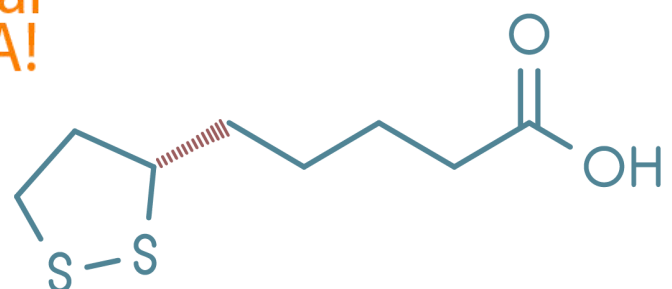
Tem sido demonstrado que o ALA atua como um antioxidante potente, atenuando os danos decorrentes da ação deletéria de espécies reativas de oxigênio (ROS) em diferentes estruturas e organelas celulares, além de auxiliar na regeneração de moléculas antioxidantes reduzidas (tal como as vitaminas C e E, ubiquinona e glutathiona). Ainda, o ALA modula vias de sinalização da insulina no músculo esquelético e reduz a síntese de triglicerídeos nos adipócitos. Com isso, evidências apontam que a suplementação com ALA pode auxiliar na prevenção e no tratamento de diversas condições clínicas caracterizadas por alterações metabólicas (incluindo obesidade, diabetes e esteatose hepática não alcoólica), além de doenças cardiovasculares, disfunções cognitivas, entre outras.¹⁻⁴



Comprar
AGORA!



Ácido **R**-alfa lipoico



Ácido **S**-alfa lipoico

■ FORMAS DISPONÍVEIS DE ÁCIDO ALFA LIPOICO PARA SUPLEMENTAÇÃO

Devido à quiralidade no carbono 6 de sua estrutura química, o ALA pode ser encontrado sob a forma de dois enantiômeros: S e R. Enquanto o enantiômero R é de ocorrência natural, a forma isomérica S é obtida sinteticamente. Em geral, a suplementação de ALA consiste na administração de uma mistura racêmica das formas R e S que, apesar de apresentarem algumas diferenças farmacocinéticas, podem ser absorvidas e utilizadas pelo organismo. Como alternativa à suplementação com a mistura racêmica de ambas as formas isoméricas, o estereoisômero R pode ser utilizado isoladamente na suplementação de ALA. No entanto, se isolado, é instável quando exposto a pH ácido, luz, calor ou umidade, e a complexação com sais metálicos fracos (como sais de potássio ou de sódio) pode ser empregada para auxiliar em sua estabilização. Desta forma, estudos têm demonstrado que o ácido R-alfa lipoico (ou R-ALA) na forma de sal sódico apresenta boa solubilidade e estabilidade, e que a suplementação com este composto limitar a ocorrência de efeitos gastrointestinais que podem ser observados após a administração de ALA.^{5,6}

Na Active Pharmaceutica, dispomos das seguintes formas de ácido alfa lipoico:

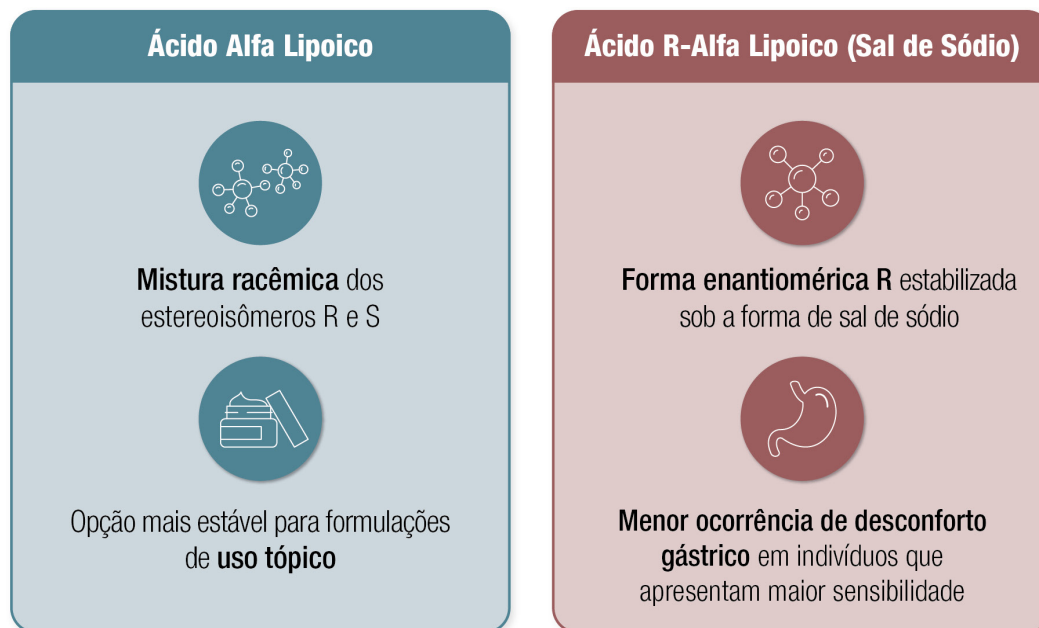


FIGURA 2 – Principais diferenças entre o ácido alfa lipoico e o ácido alfa R-lipoico (sal de sódio).

■ QUAL O MECANISMO DE AÇÃO?

Após a ingestão pela via oral, o ALA é convertido no fígado à sua forma reduzida, o ácido dihidrolipoico (DHLA). Assim como o ALA, o DHLA é uma molécula anfifílica, ou seja, apresenta tanto propriedades lipofílicas quanto hidrofílicas. Essa característica permite que ALA/DHLA exerçam efeitos biológicos interessantes não só nas membranas celulares, mas também no citoplasma das células. Por esta razão, o DHLA é capaz de atravessar com maior facilidade a barreira hematoencefálica e neutralizar ROS envolvidas com o estresse oxidativo, resultando em um papel neuroprotetor. Já nas mitocôndrias, o ALA participa como cofator enzimático em diferentes reações necessárias para a respiração celular. A presença de grupamentos tióis em sua estrutura química permite, ainda, que o ALA apresente afinidade por minerais inorgânicos, tais como o ferro e o cobre. Desta forma, o ALA pode auxiliar na quelação (neutralização) de íons metálicos livres, possibilitando a sua eliminação do organismo e reduzindo a toxicidade decorrente do acúmulo destes metais.^{4,7-9}

Ainda, tem sido demonstrado que as vias metabólicas reguladas pela insulina são influenciadas diretamente pelo estresse oxidativo intracelular. Desta forma, ao atenuar o estresse oxidativo, o ALA pode estimular a fosforilação dos receptores de insulina, além de promover o aumento da translocação e da redistribuição de transportadores de glicose (GLUT4) na membrana plasmática. Com isso, o ALA aumenta a recaptção de glicose pelas células, reduzindo a hiperglicemia.⁴

O ALA também participa do metabolismo lipídico, regulando a expressão de genes relacionados com a síntese de triglicerídeos, ácidos graxos e de enzimas envolvidas na lipogênese (que ocorre principalmente no fígado e no tecido adiposo). Ainda, ao estimular o catabolismo de ácidos graxos, o ALA pode auxiliar no gerenciamento do peso corporal, além de reduzir os fatores de risco para o desenvolvimento de doenças coronarianas, especialmente a dislipidemia. Além disso, tem sido evidenciado que o ALA pode reduzir os níveis de chemerin, uma adipocina produzida pelos adipócitos na presença de citocinas pró-inflamatórias e que está associada à obesidade e outros componentes da síndrome metabólica.^{5,10-12}

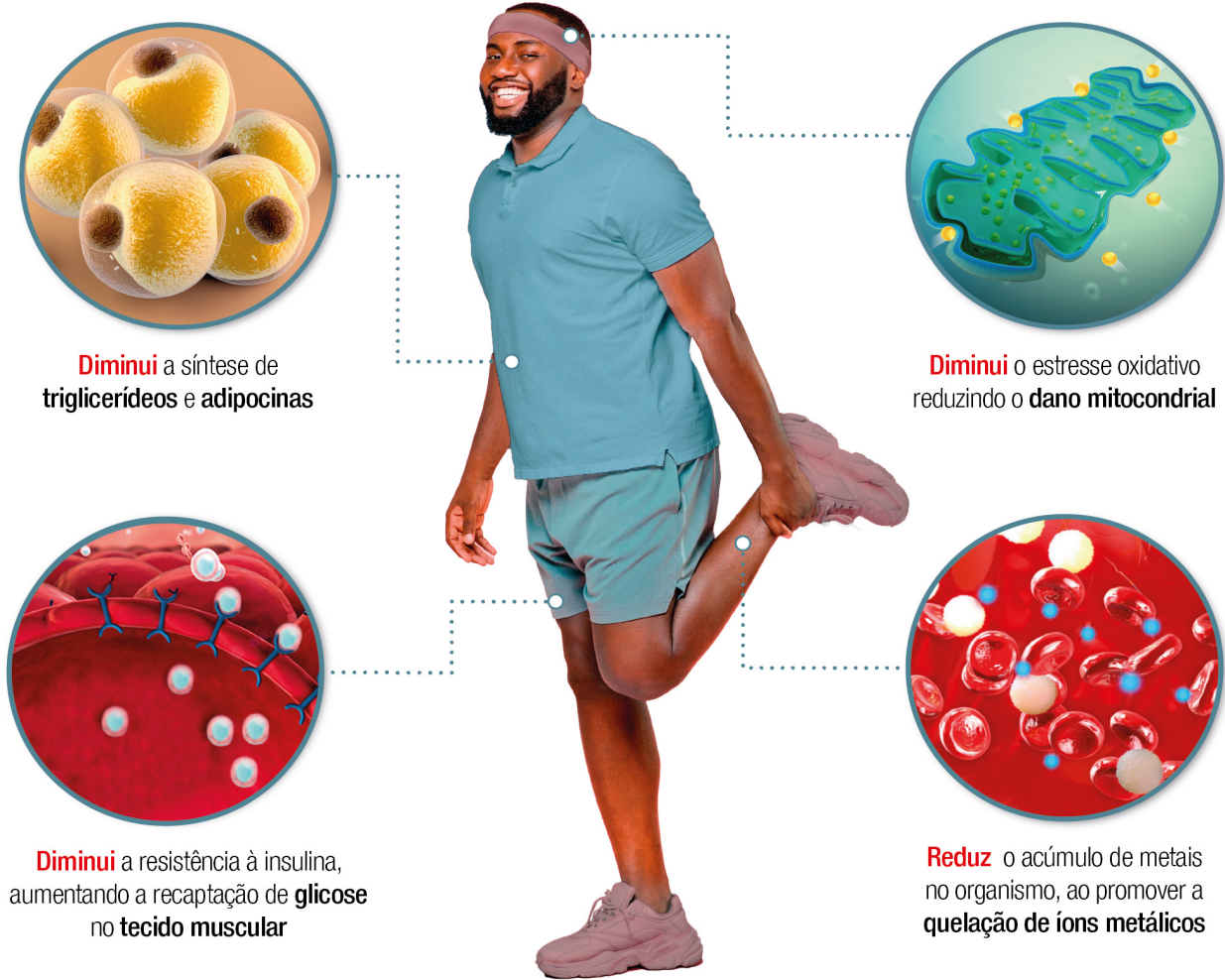


FIGURA 3 – Principais mecanismos de ação do ácido alfa lipoico (ALA) no organismo humano. Adaptado de www.shutterstock.com, 2021.

EVIDÊNCIAS NA LITERATURA

MANEJO DA DIABETES

A diabetes é uma doença metabólica caracterizada pelo aumento da concentração sérica de glicose (hiperglicemia). A hiperglicemia, por sua vez, está associada a defeitos na secreção ou na ação da insulina – hormônio produzido pelo pâncreas e responsável pela captação da glicose pelas células. Neste contexto, estudos pré-clínicos vêm demonstrando que o ALA pode modular as vias de sinalização intracelular ativadas pela insulina, promovendo o aumento da recaptação de glicose pelas células. Assim, um estudo randomizado, duplo-cego e controlado por placebo conduzido com 12 indivíduos pré-diabéticos (homens e mulheres, com idade média de 47 anos) avaliou o efeito da suplementação com ALA pela via oral (600 mg ao dia, por 30 dias) sobre o perfil glicêmico. Ao término do tratamento, foi observada uma redução significativa da glicemia, sugerindo que o ALA melhorou a sensibilidade à insulina nestes indivíduos.¹³

Adicionalmente, a hiperglicemia crônica pode levar também a alterações fisiopatológicas na retina, nos vasos sanguíneos e em fibras nervosas do sistema nervoso periférico, comprometendo a qualidade de vida dos pacientes diabéticos. A neuropatia diabética, por exemplo, é uma condição em que danos nos nervos periféricos resultam em dor, formigamento e perda da sensibilidade, especialmente nos membros inferiores. Desta forma, tem sido demonstrado que a administração de 600 mg de ALA ao dia, ao longo de 4 a 8 semanas, pode limitar a progressão da neuropatia diabética e minimizar estes sintomas.⁵

Ainda, em função das alterações hormonais que ocorrem durante a gestação, a diabetes mellitus gestacional (DMG) costuma ser uma das alterações metabólicas mais comuns em gestantes. Caracterizada pela intolerância aos carboidratos (especialmente

glicose) e diagnosticada pela primeira vez durante a gestação, a DMG requer atenção devido aos riscos de evolução para diabetes mellitus do tipo 2 (DM2), síndrome metabólica e doenças cardiovasculares. Neste contexto, um estudo randomizado, duplo-cego e controlado por placebo realizado com 60 gestantes diagnosticadas com DMG (com idade entre 18 e 40 anos) avaliou os benefícios da suplementação de ALA pela via oral (100 mg ao dia). Ao término de 8 semanas de tratamento, foi possível observar uma redução da hiperglicemia nestas gestantes, sugerindo que o ALA pode reduzir a intolerância à glicose desenvolvida durante a gestação.¹⁴

■ GERENCIAMENTO DO PESO CORPORAL

A obesidade é uma doença crônica caracterizada pelo acúmulo excessivo de gordura corporal, que pode acarretar em diferentes efeitos deletérios à saúde. Normalmente, está associada ao desequilíbrio entre o consumo e o gasto calórico, resultando em dislipidemia (aumento da concentração de lipídeos na corrente sanguínea) e no aumento do tamanho dos adipócitos (células do tecido adiposo, que armazenam lipídeos e ácidos graxos no organismo). Neste contexto, evidências vêm demonstrando que a suplementação com ALA pode reduzir a síntese de triglicerídeos no fígado e nos adipócitos, bem como aumentar o catabolismo de ácidos graxos nos músculos, auxiliando no tratamento da dislipidemia. Assim, um estudo randomizado, duplo-cego e controlado por placebo realizado com 360 indivíduos obesos (homens e mulheres, com idade entre 18 e 65 anos) avaliou o efeito da suplementação com ALA pela via oral (1.200 ou 1.800 mg ao dia) sobre o gerenciamento do peso corporal. Após 20 semanas de tratamento, foi observado que o tratamento com ambas as doses de ALA promoveu uma redução significativa do índice de massa corporal (IMC) e da circunferência abdominal destes indivíduos.¹⁵

Adicionalmente, outro estudo clínico randomizado, duplo-cego e controlado por placebo foi conduzido com 60 indivíduos com DM2 que apresentavam sobrepeso (homens e mulheres, com idade média de 61 anos). Este estudo avaliou o efeito da suplementação com ALA pela via oral (600 mg ao dia, durante 20 semanas) sobre o perfil lipídico destes indivíduos. Ao término da intervenção, foi observada a redução no IMC e nas concentrações séricas de triglicerídeos e de glicose nestes indivíduos, sugerindo que a suplementação com ALA pode auxiliar no gerenciamento do peso corporal ao reduzir a hiperglicemia e a dislipidemia – fatores de risco para o desenvolvimento de síndrome metabólica.¹⁶

■ ATIVIDADE NEUROPROTETORA

Devido a sua atividade antioxidante potente, o ALA pode atuar como um neuroprotetor ao reduzir o acúmulo de ROS e outras espécies reativas no sistema nervoso central, atenuando a peroxidação lipídica. Adicionalmente, o ALA desempenha papel anti-inflamatório e contribui para a homeostase do metabolismo glicídico. Assim, evidências apontam os benefícios da suplementação com ALA (doses entre 100 e 600 mg ao dia) em pacientes diagnosticados com doenças neurodegenerativas e neuropsiquiátricas, tais como doença de Alzheimer, esclerose múltipla, transtorno afetivo bipolar e transtorno depressivo.¹⁷⁻¹⁹

■ SAÚDE REPRODUTIVA

O estresse oxidativo, a resistência à insulina e a obesidade são fatores de risco associados à infertilidade, tanto em mulheres quanto em homens. Neste contexto, tem sido demonstrado que a suplementação com ALA pode melhorar os parâmetros reprodutivos em mulheres com síndrome do ovário policístico (incluindo a maturação dos oócitos e a taxa de ovulação) e em homens, melhorando a qualidade espermática (morfologia e motilidade dos espermatozoides). Adicionalmente, alguns estudos têm demonstrado o efeito benéfico da suplementação com ALA (doses entre 400 e 800 mg ao dia) sobre as taxas de sucesso das técnicas de reprodução assistida.²⁰

■ PREVENÇÃO DO ENVELHECIMENTO CUTÂNEO

Evidências apontam que a aplicação tópica de antioxidantes pode reduzir o estresse oxidativo no tecido cutâneo, minimizando os danos associados principalmente à exposição excessiva aos raios ultravioleta (UV). Neste contexto, já foi demonstrado que a aplicação tópica de um creme contendo ALA (5%) na região da face reduziu os sinais do fotoenvelhecimento cutâneo, atenuando rugas e linhas de expressão.²¹

INFORMAÇÕES ADICIONAIS

SUGESTÃO POSOLÓGICA:

USO ORAL: 100 a 800 mg ao dia, divididos em duas ou três administrações

USO TÓPICO: 0,5 a 5%

FORMAS FARMACÊUTICAS: cápsulas, sachês, cremes, loções, séruns

■ SUGESTÕES DE FORMULAÇÕES

USO ORAL

Efeito antioxidante

Ácido R-Alfa Lipoico (Sal de Sódio) 100 mg
Ubiquinol-Kaneka QH™ 30% 50 mg
Excipiente q.s.p. 1 dose

Posologia: administrar 1 dose, pela via oral, duas vezes ao dia.

Ação neuroprotetora

Ácido R-Alfa Lipoico (Sal de Sódio)..... 150 mg
N Acetil L Cisteína 100 mg
Excipiente q.s.p. 1 dose

Posologia: administrar 1 dose, pela via oral, duas vezes ao dia.

Melhora do desempenho físico e da recuperação muscular

Ácido R-Alfa Lipoico (Sal de Sódio) 150 mg
WATTS'UP 500 mg
Excipiente q.s.p. 1 dose

Posologia: administrar 1 dose, pela via oral, 15 minutos antes do exercício físico.

Melhora de parâmetros associados à fertilidade masculina

Ácido Alfa Lipoico 800 mg
Mio Inositol 1 g
Betaína Base Anidra 100 mg
Metilfolato (L 5 Metil Tetrahydrofolato de Cálcio) 400 mcg
Metilcobalamina (Vitamina B12) 500 mcg
Piridoxal 5 Fosfato (Vitamina B6) 50 mg
Excipiente q.s.p. 1 dose

Posologia: administrar 1 dose, pela via oral, duas vezes ao dia.

Melhora de parâmetros associados à fertilidade feminina

Ácido Alfa Lipoico	300 mg
Mio Inositol	2 g
D Chiro Inositol	500 mg
Excipiente q.s.p.	1 dose

Posologia: administrar 1 dose ao dia, pela via oral.

Melhora do metabolismo glicídico

Ácido Alfa Lipoico	150 mg
Cinnamon bark (<i>Cinnamomum verum</i> ; 40% polifenóis)	350 mg
Excipiente q.s.p.	1 dose

Posologia: administrar 1 dose, pela via oral, duas vezes ao dia.

Adjuvante no tratamento de neuropatia diabética

Ácido Alfa Lipoico	1 g
BHT	0,1 g
Sacarina sódica	0,1 g
Óleo essencial de canela	0,3 - 0,5 mL
Dióxido de silício coloidal	2 g
Óleo de amêndoas q.s.p.	100 mL

Posologia: administrar 5 mL, pela via oral, duas a três vezes ao dia.

USO TÓPICO

Sérum facial antioxidante

Ácido Alfa Lipoico	5%
Propanediol q.s.p.	30 mL

Posologia: aplicar sobre a pele limpa e seca, preferencialmente à noite.

Hidratante facial antioxidante

Ácido Alfa Lipoico	3%
Palmitato de ascorbila	2%
HA Active (ácido hialurônico 95%)	2%
Creme não iônico q.s.p.	30 g

Posologia: aplicar na região da face, pescoço e colo, preferencialmente à noite.

Este insumo deve ser utilizado sob orientação médica ou de outro profissional de saúde habilitado.

Informativo destinado a profissionais de saúde.



LITERATURAS CONSULTADAS

1. Passiatore M, Perna A, De-Vitis R, Taccardo G. The use of alfa-lipoic acid-r (Ala-r) in patients with mild-moderate carpal tunnel syndrome: A randomised controlled open label prospective study. *Malaysian Orthop J*. 2020;14(1):1-6. doi:10.5704/MOJ.2003.001
2. Packer L, Witt EH, Tritschler HJ. Alpha-lipoic acid as a biological antioxidant. *Free Radic Biol Med*. 1995;19(2):227-250. doi:10.1016/0891-5849(95)00017-R
3. Solmonson A, DeBerardinis RJ. Lipoic acid metabolism and mitochondrial redox regulation. *J Biol Chem*. 2018;293(20):7522-7530. doi:10.1074/jbc.TM117.000259
4. Rochette L, Ghibu S, Muresan A, Vergely C. Alpha-lipoic acid: molecular mechanisms and therapeutic. *NRC Res Press*. 2015;1027(September):1021-1027.
5. Salehi B, Berkay Yilmaz Y, Antika G, et al. Insights on the use of α -lipoic acid for therapeutic purposes. *Biomolecules*. 2019;9(8):1-25. doi:10.3390/biom9080356
6. Carlson DA, Smith AR, Fischer SJ, Young KL, Packer L. The plasma pharmacokinetics of R-(-)-lipoic acid administered as sodium R-(-)-lipoate to healthy human subjects. *Altern Med Rev*. 2007;12(4):343-351.
7. May JM, Qu Z chao, Nelson DJ. Uptake and reduction of α -lipoic acid by human erythrocytes. *Clin Biochem*. 2007;40(15):1135-1142. doi:10.1016/j.clinbiochem.2007.06.009
8. Sales IMS, De Freitas RM, Tomé A da R. Estudos histopatológicos dos efeitos do ácido lipóico nas convulsões induzidas pela pilocarpina. *Rev Neurociências*. 2001;18(3):308-313. doi:10.34024/rnc.2010.v18.8459
9. Liu J. The effects and mechanisms of mitochondrial nutrient α -lipoic acid on improving age-associated mitochondrial and cognitive dysfunction: An overview. *Neurochem Res*. 2008;33(1):194-203. doi:10.1007/s11064-007-9403-0
10. Prieto-Hontoria PL, Pérez-Matute P, Fernández-Galilea M, et al. Effects of alpha-lipoic acid on chemerin secretion in 3T3-L1 and human adipocytes. *Biochim Biophys Acta*. 2016;1861(3):260-268. doi:10.1016/j.bbali.2015.12.011
11. Pashaj A, Xia M, Moreau R. α -Lipoic acid as a triglyceride-lowering nutraceutical. *Can J Physiol Pharmacol*. 2015;93(12):1029-1041. doi:10.1139/cjpp-2014-0480
12. Gomes MB, Negrato CA. Alpha-lipoic acid as a pleiotropic compound with potential therapeutic use in diabetes and other chronic diseases. *Diabetol Metab Syndr*. 2014;6(1). doi:10.1186/1758-5996-6-80
13. Gosselin LE, Chrapowitzy L, Rideout TC. Metabolic effects of α -lipoic acid supplementation in pre-diabetics: A randomized, placebo-controlled pilot study. *Food Funct*. 2019;10(9):5732-5738. doi:10.1039/c9fo00390h
14. Aslfalah H, Jamilian M, Rafiei F, Khosrowbeygi A. Reduction in maternal serum values of glucose and gamma-glutamyltransferase after supplementation with alpha-lipoic acid in women with gestational diabetes mellitus. *J Obstet Gynaecol Res*. 2019;45(2):313-317. doi:10.1111/jog.13842
15. Okanović A, Prnjavorac B, Jusufović E, Sejdinović R, Sarajevo I, Šehović M. Alpha-lipoic acid reduces body weight and regulates triglycerides in obese patients with diabetes mellitus Polyclinic for Pulmonary Diseases of Health and Educational Institution ". 2014:96-101.
16. Koh EH, Lee WJ, Lee SA, et al. Effects of alpha-lipoic acid on body weight in obese subjects. *Am J Med*. 2011;124(1):85.e1-85.e8. doi:10.1016/j.amjmed.2010.08.005
17. Cekici H, Emre BakArhan Y. Potential Therapeutic Agent In Psychiatric And Neurological Diseases: Alpha Lipoic Acid. *Acta Psychopathol*. 2018;04(02):1-6. doi:10.4172/2469-6676.100165
18. Hager K, Kenkies M, McAfoose J, Engel J, Münch G. α -Lipoic acid as a new treatment option for Alzheimer's disease - A 48 months follow-up analysis. *J Neural Transm Suppl*. 2007;(72):189-193. doi:10.1007/978-3-211-73574-9_24
19. Sanders LLO, De Souza Menezes CE, Chaves Filho AJM, et al. α -Lipoic Acid as Adjunctive Treatment for Schizophrenia: An Open-Label Trial. *J Clin Psychopharmacol*. 2017;37(6):697-701. doi:10.1097/JCP.0000000000000800
20. Di Tucci C, Galati G, Mattei G, et al. The role of alpha lipoic acid in female and male infertility: a systematic review. *Gynecol Endocrinol*. 2021;37(6):497-505. doi:10.1080/09513590.2020.1843619
21. H. Beitner. Randomized, placebo-controlled, double blind study on the clinical efficacy of a cream containing 5 % a-lipoic acid related to photoaging of facial skin. *Br J Dermatol*. 2003;149:841-849.

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) 2605-9480



vendas@farmacam.com.br



whatsapp (21) 98493-7033



[Facebook.com.br/farmacam](https://www.facebook.com/farmacam)



[Instagram.com.br/farmacam](https://www.instagram.com/farmacam)