

PermeaGel

Formulação Transdérmica e Sistema de Liberação Transdérmica

A viabilização de tratamentos através da via transdérmica tem se tornado possível pelo uso de promotores de absorção cutânea, os quais alteram a permeabilidade cutânea, ou ainda pela modificação das propriedades físico-químicas do ativo no sistema.

Os fosfolipídios apresentam um importante papel nesta proposição, pois são substâncias capazes de penetrar e proporcionar a desorganização da bicamada lipídica do estrato córneo. Associado ao efeito promotor, os fosfolipídios podem também interagir com ativos formando complexos, proporcionando, assim, uma adequada solubilidade ou até mesmo adequada partilha do ativo no estrato córneo. Além do mais, sistemas fosfolipídios/água podem apresentar características desejáveis para a veiculação transdérmica de ativos por formarem, em condições determinadas de temperatura e hidratação, sistemas líquidos cristalinos que modulam a velocidade de ativos através da pele (formação de cristal líquido).

Permeagel traz a proposta de obtenção de sistemas a base de fosfolipídios, a caracterização da influência destes sistemas no perfil de permeação e retenção cutâneas. Ocorre aumento da permeação cutânea do ativo em propilenoglicol contendo fosfolipídios. Para melhor caracterizar o mecanismo de ação, estudos de pré-tratamento da pele e partilha foram conduzidos e comprovam a ação do fosfolipídio como verdadeiro promotor de absorção cutânea.

Avaliação da retenção demonstraram correlação entre o aumento da permeação com a quantidade retida junto à pele. Características como formação de cristal líquido (fase lamelar) fazem do sistema cristalino um sistema em potencial para a liberação tópica, obtendo uma liberação sustentada junto às camadas mais profundas da pele. Estudos complementares sugerem que a otimização da permeação se deve não somente ao efeito promotor de absorção do fosfolipídio, mas também, a fatores relacionados com o ponto de fusão e com atividade termodinâmica do ativo no sistema.

O uso do produto em formulações pode ser explorado para liberação transdérmica do ativo de forma segura, além disso, otimizam da permeação cutânea do ativo.

COMPOSIÇÃO

- Fosfolípido - Agente de alta penetração capaz de atravessar a camada córnea da pele.
- Monoéster emoliente - Promotor da penetração cutânea.
- Silicone - Espalhabilidade e melhora o toque.
- Ethoxydiglycol - Poder plasticizante e solubilizante, aumenta a penetração cutânea.
- BHT - Antioxidante.
- Alcool
- Propilenoglicol - Umectante.
- Co-Polímero do Ácido Sulfônico Acrilildimetiltaurato e Vinilpirrolidona Neutralizado - Estabilizante, Agente de consistência e Suspensor.
- Sistema de liberação transdérmica.

Fosfolípido | Agente de alta penetração capaz de atravessar a camada córnea da pele.

Os fosfolípidos compõem o revestimento neuronal e a bainha de mielina em nosso organismo, além de excelente emulsificador lipolítico. Dentro dessa denominação temos a Lecitina, cuja a principal fonte comercial como ingrediente alimentar vem da soja. Há muito tempo a indústria alimentícia reconhece a lecitina como um emulsificador lipofílico, usado em produtos como margarina e chocolate. Mas a lecitina pode ser muito mais que isso.

A lecitina é uma combinação de fosfolípidos que ocorrem naturalmente nos grãos de soja. Gomas de lecitina são obtidas do óleo de soja após a extração do óleo e depois é removida do óleo de por um processo de precipitação de vapor. As gomas são secas em vácuo até cerca de 65% do teor de fosfolípidos.

Ethoxydiglycol | aumenta a penetração cutânea.

Estudos indicam que o Etoxidiglicol promove rápida penetração no estrato córneo, carreando o ativo e mantendo-o agindo por mais tempo. Etoxidiglicol apresenta uma gama bem grande de solubilidade. É facilmente solúvel em água, óleos vegetais e glicóis, além de agir muito bem como um solubilizante de fragrâncias, ésteres e filtros solares. (Excelente solubilizante para benzofenonas, parabenos e agentes sólidos) e como carreador para alfa hidroxí-ácidos.

O Etoxidiglicol é considerado de pureza suficiente para ser aplicado em produtos tanto de uso tópico quanto uso interno, por ser considerado de grau cosmético e farmacêutico, possibilitando, além

de todas as suas características, a solubilização de componentes difíceis de ser incorporados em soluções, xaropes, etc.

Co-Polímero do Ácido Sulfônico Acriloildimetiltaurato e Vinilpirrolidona Neutralizado | Estabilizante,
Agente de consistência e Suspensor.

É um polímero sintético pré-neutralizado inovador, que permite a formação de Géis Cristalinos com características de excelente Consistência, toque agradável e estável em meios ácidos.

Estabilidade: As formulações baseadas em Co-Polímero do Ácido Sulfônico Acriloildimetiltaurato e Vinilpirrolidona Neutralizado apresentam excelente estabilidade, especialmente com princípios ativos difíceis de se trabalhar.

Sensorial: Excelentes propriedades sensoriais, conferindo uma agradável sensação à pele, sem o toque pegajoso característico dos polímeros tradicionais.

As emulsões formuladas são extremamente suaves, com aspecto brilhante, excelente espalhamento e rápida absorção na pele, proporcionando uma sensação muito agradável.

Segurança: Os dados toxicológicos disponíveis demonstram que o Co-Polímero do Ácido Sulfônico Acriloildimetiltaurato e Vinilpirrolidona Neutralizado é um produto praticamente atóxico por via oral, não é sensibilizante para a pele e olhos e não exibe nenhuma atividade mutagênica em testes de laboratório.

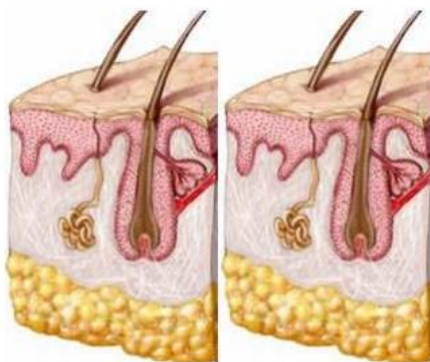
Sistema de liberação transdérmica

Os fosfolípidios apresentam um importante papel nesta proposição, pois são substâncias capazes de penetrar e proporcionar a desorganização da bicamada lipídica do estrato córneo. Associado ao efeito promotor, os fosfolípidios podem também interagir com ativos formando complexos, proporcionando, assim, uma adequada solubilidade ou até mesmo adequada partilha do ativo no estrato córneo.

Sistemas fosfolípidios/água podem apresentar características desejáveis para a veiculação transdérmica de ativos por formarem, em condições determinadas de temperatura e hidratação, sistemas líquidos cristalinos que modulam a velocidade de ativos através da pele.

Penetração Através da Barreira Cutânea

Rotas de penetração dérmica:

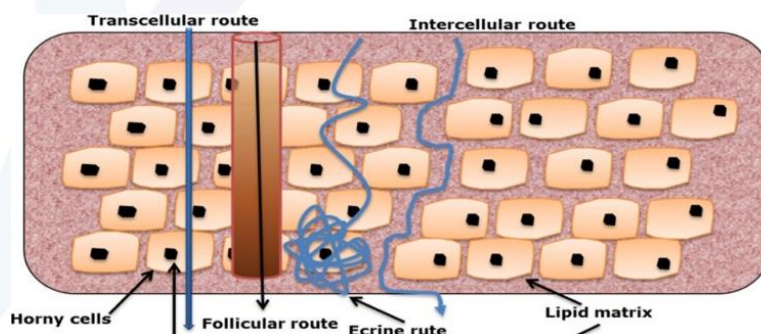


1. Rota através das camadas cutâneas intactas.

2. Rota através do folículo pilosebáceo.

3. Rota através da glândula sudorípara.

Pela rota através das camadas cutâneas intactas, existem ainda 2 formas de penetração:



BENEFÍCIOS:

- Evita a via gástrica e seus efeitos colaterais
- Rápida absorção
- Compatibilidade com a bicamada lipídica
- Promotor de permeabilidade pela formação de cristais líquidos
- Estabilidade de pH
- Odor agradável
- Agilidade no tratamento

Informações Adicionais:

Com o Sistema de Liberação Transdérmica, conseguimos veicular ativos antiandrogênicos, gel para cicatrizes hipertróficas, e/ou quelóides, estimulantes celulares, para medições e controle da dor clínica, aguda e neuropática, na reumatologia, na reposição hormonal, na celulite, gordura localizada, estrias, enfim dependendo do que almeja o profissional prescritor, ele hoje pode contar com um veículo eficaz, rápido, e principalmente de fácil absorção e eliminação dos ativos, sem riscos colaterais para o paciente.

Estável em pH 4,0 a 9,0

Em pH < 4, após alguns meses pode ocorrer o rompimento do polímero e uma consequente queda de viscosidade; apesar disso, é possível se preparar formulações em pH inferior a esse, desde que elas sejam utilizadas rapidamente.

Em pH > 9, pode haver liberação de amônia.

Armazenagem: Recipiente hermético, temperatura ambiente 25°C, protegido da luz e umidade. Incompatível com Eletrólitos.

Compatível com alguns tensoativos em baixa concentração.

RECOMENDAÇÃO DE USO:

Recomenda-se a adição de até 25% de ativos do volume total de Permeagel.

REFERÊNCIAS

MATERIAL FABRICANTE