

Ácido alfa lipóico

Potente antioxidante oral e cosmético

Denominação química: 1,2-Dithiolane-3- pentanoic acid; 1,2-dithiolane-3-valeric acid.

Sinônimo: Ácido Tióctico

CAS: 1077-28-7

PM: 206,33

FM: C₈H₁₄O₂S₂

Fator de correção: não se aplica

Fator de umidade: não se aplica

Fator de equivalência: não se aplica

USO ORAL E TÓPICO

USO HUMANO

O Ácido alfa lipóico (ALA) é uma coenzima antioxidante muito eficaz, pois além de combater os radicais livres, regenera os antioxidantes oxidados. Combate os radicais livres tanto em locais gordurosos como locais baseados em água, tais como a pele e músculos.

É um composto organossulfurado derivado do ácido octanóico que contém dois átomos de enxofre (em C6 e C8) vicinais ligados por uma ligação dissulfídica. O ácido lipóico é ainda responsável por estimular a biossíntese de uma enzima do nosso organismo que exerce também uma marcada ação neutralizadora dos radicais livres. Esta enzima neutraliza um dos radicais livres mais agressivos para a pele, o radical peróxido, transformando-o em água. Pensa-se que o ácido lipóico tem também um papel importante no metabolismo do organismo, mais particularmente na produção de energia (RADDATZ, 1997).

Propriedades

- Previne lesões foto-oxidativas realizadas através da redução da ativação do NF-kappaB;
- Inibe a atividade da enzima tirosinase, através da quelação de ions cobre;
- Inibe o processo inflamatório das células;
- Atividade antioxidante potente.

Mecanismo de ação

USO ORAL

Depois de ingerido, o Ácido alfa lipóico é prontamente reduzido a ácido dihidrolipóico. Este, por sua vez, é capaz de varrer uma ampla variedade de espécies reativas do oxigênio tais como os radicais hidroxila, superóxido, peroxila, oxigênio singlet e óxido nítrico. Além disso, o ácido dihidrolipóico prolonga a atividade das vitaminas E e C, regenerando o ascorbato de seu radical ascorbil, que por sua vez pode regenerar o tocoferol de seu radical tocoferil. Desta forma, estas vitaminas que são antioxidantes por si mesmas, atuam em sinergismo reparando-se mutuamente. Estudos revelam que células suplementadas com Ácido alfa lipóico aumentam seu conteúdo de glutatona; o ácido dihidrolipóico e o Ácido alfa lipóico protegem as proteínas, segundo demonstrado em testes com fumantes, nos quais observou-se a tioração do ácido dihidrolipóico, enquanto o Ácido alfa lipóico bloqueia a glicação da albumina incubada em altas doses de glicose, provavelmente por ligação aos sítios hidrofóbicos. O Ácido alfa lipóico também é útil nas complicações diabéticas, incluindo os danos neurológicos e a catarata. Neste último caso, sabe-se que esta pode ser causada por competição entre o dihidroascorbato e a glicose para transporte da membrana. Assim, o Ácido alfa lipóico, que prontamente entra na célula, pode regenerar o ascorbato e o tocoferol e manter os níveis de glutatona, sendo assim um poderoso tratamento preventivo.

Finalmente, o Ácido alfa lipóico pode ser administrado conjuntamente com T4, proporcionar uma diminuição nos níveis séricos do colesterol, não afetando a taxa de triglicérides. Além disso, o Ácido alfa lipóico tem apresentado resultados satisfatórios em pacientes com cirrose hepática induzida pelo álcool e também na prevenção da formação de cristais de oxalato de cálcio em rins de animais de laboratório.

USO TÓPICO

O Ácido alfa lipóico tem sido denominado de antioxidante universal, atuando como destruidor de radicais livres. Radicais livres são subprodutos de processos como respiração e digestão, acentuados por fatores externos como luz solar, fumaça e poluição atmosférica. Segundo a teoria do envelhecimento por radicais livres, o processo começa nas células, onde moléculas de oxigênio perdem um elétron nas interações com outras moléculas, transformando-se em

radicais livres. Estes, por sua vez, roubam elétrons de outras moléculas saudáveis na tentativa de se equilibrar, danificando os componentes das células. O colágeno, proteína que ajuda a conferir elasticidade e viço à pele, degrada-se. Com o tempo, o organismo perde a capacidade de auto reparo, sofrendo sintomas como ressecamento, perda da elasticidade, maciez, firmeza, e menor resposta imunológica. A exposição ao sol ativa a produção de radicais livres e também a produção de ácido araquidônico, um precursor das moléculas que podem inflamar a pele. Quando as enzimas provocam a digestão do colágeno, pequenos defeitos podem aparecer na pele, como a formação de rugas.

Indicações e aplicações

O Ácido Alfa Lipóico é usado no tratamento da dermatose inflamatória, tratamento medicamentoso, procedimentos cirúrgicos e tratamentos cosméticos. Tem sido preconizado como antioxidante na prevenção e controle da catarata, diabetes melito, retinopatia diabética e doenças cardiovasculares. Por sua forte ação antioxidante, o Ácido Lipóico é eficaz no tratamento da neuropatia diabética. Atua como cofator em diversos processos metabólicos celulares, como a oxidação do piruvato e o transporte de radicais acetato para o ciclo de Krebs. É usado como coadjuvante no tratamento da cirrose hepática em alcoólatras. Também atua como antioxidante contra a radiação ultravioleta na pele, indicado para uso após exposição ao sol e em formulações antienvhecimento.

Sugestões de dosagem (USO ORAL)

- Como antioxidante: 100 a 600 mg/dia, dividido em duas ou três doses;
- Como hepatoprotetor a dosagem é de 10 a 30 mg ao dia;
- Complicações no diabetes: 800mg/ dia.

Concentração usual (USO TÓPICO)

O Ácido alfa lipóico é indicado nas concentrações que variam de 0,5 a 5,0% em cremes e loções não-iônicas.

Interações medicamentosas

Informações não encontradas nas literaturas consultadas.

Recomendações farmacotécnicas

Se necessário, neutralize o Ácido Alfa Lipóico com trietanolamina. Acrescentar em veículos como pomada ou cremes, com o auxílio de um óleo vegetal ou propilenoglicol, após o resfriamento da emulsão.
pH de estabilidade: 3,8 a 4,0.

Incompatibilidades:

- Substâncias alcalinas.
- Ácido Sulfônico Fenilbenzimidazol, o pH de estabilidade do Eusolex 232 é 7,0, logo ativos ácidos promovem a perda de eficácia do filtro por reduzir o pH a valores inferiores a este.
- Algisium C, tem o pH de estabilidade de 3,5 a 7,0. Se for necessário a associação verificar a possibilidade de ajuste do pH da formulação para 3,5.
- Aminofilina, Ácido Alfa Lipóico decompõe a aminofilina liberando teofilina que é insolúvel.
- Arbutin C, hidrolisa do Arbutin anulando sua ação específica.
- Argirol, Ácido Alfa Lipóico decompõe do mesmo.
- Biosulfur.
- Coaltar
- Elastocel, pode liberar compostos de enxofre em formulações com pH abaixo de 5,0. • Eritromicina. • Extrato de Hamamelis
- Fluconazol.
- Glutaraldeído.
- Hipoclorito de Sódio.
- Hipossulfito de Sódio, Ácido Alfa Lipóico o decompõe liberando SO₂ e enxofre que precipita.
- Óxido de Zinco ocorre à reação química que forma os respectivos sais de zinco, fazendo com que o óxido de zinco perca suas propriedades antissépticas e secativas.
- Padina pavônica.
- Pca-Na, o pH de estabilidade do Pca-Na situa-se entre 4,0 a 6,5, não associar
- Ácido Alfa Lipóico, se necessário e possível, neutralize o ácido a pH 4,0.
- Piritionato de Zinco.



- Polimixina B.
- Subgalato de bismuto.
- Sulfeto de selênio.
- Sulfureto de potássio.
- Tintura de quina.

Incompatibilidades com veículos:

Diadermina, porque ativos ácidos reduzem o pH de estabilidade da diadermina a valores inferiores a 7,0 que provoca a quebra da viscosidade da diadermina e sua fluidificação. Gel aniônico, tem pH de estabilidade incompatíveis. Utilizar gel não iônico (natrosol) ou gel de Carboximetilcelulose (CMC) com o ALA que, possuem resistência a pH ácido.

Informações de armazenamento

Verificar a informação no rótulo ou certificado de análise do produto.

Referências bibliográficas

The Merck Index; Merck & CO., INC. 12ª Ed., 1989.

Nicholas VP. The use of topical ascobyl palmitate and alpha lipoic acid for aging skin. 1998; 20-24.

Batistuzzo JAO. Formulário Médico Farmacêutico. Pharmabooks: São Paulo 2006. 3º edição.

Cavalcanti LC. Incompatibilidades Farmacotécnicas na Farmácia Magistral: causa recomendação e uso terapêutico. Pharmabooks: São Paulo, 2006.

Martindale: The Complete Drug Reference. 35. Ed. PhP: Londres, 2007.

Raddatz G, Bisswanger H. Receptor site and stereospecificity of dihydrolipoamide dehydrogenase for R- and S-lipoamide: a molecular modeling study. Journal of biotechnology. 1997; 58 (2): 89–100. PMID 9383983. doi:[10.1016/S0168-1656\(97\)00135-1](https://doi.org/10.1016/S0168-1656(97)00135-1).

Última atualização: 23/07/2018.