MELATONINA EN COSMÉTICA Y EN RADIOTERAPIA

La Melatonina es un poderoso antioxidante, que además de actuar sobre los radicales libres, reduce el daño oxidativo derivado de la exposición solar, de los hábitos tóxicos y el cronoenvejecimiento y además aumenta la producción de colágeno y elastina en el fibroblasto gracias a su aporte de energía. Y por si fueran pocas sus virtudes, también, reduce las imperfecciones en la piel y mejora su textura debido a su actividad sobre el queratinocito reduciendo la aparición de manchas. Se considera un antioxidante más potente que la vitamina C y muchas de estas virtudes se debe a que poseemos receptores melatoninérgicos. En la actualidad se está usando junto a filtros físicos, para desarrollar un mayor FPS y evitando el daño debido a las radiaciones. También se han visto muy buenos resultados en pacientes, con dermatitis atópica. Y en alopecia.

Otro de los usos muy importantes, es en Radioterapia. Estudios realizados, han demostrado que el uso de Melatonina al 0,5 %, previene la aparición de radiodermitis.

https://analesranm.es/revista/2018/135_01/rev02

Se suele usar junto a Vitamina A, Vitamina E, Extracto de Avena, entre otros. Enlaces, sobre el tema:

https://europepmc.org/article/med/35081038

https://scholar.google.com.ar/scholar?start=10&q=melatonin+topical+formulation+for+radioterapie+treatment&hl=es&as_sdt=0,5&as_vis=1#d=gs_qabs&u=%23p%3DObAfjeMroOsJ

https://www.researchgate.net/publication/221865928_Breast_Cancer_Therapy_Based_on_Melatonin

SILICONA 350

INCI: Dimethicone

Nombre químico: Polydimethylsiloxane base fluid

Fórmula molecular: (CH3)3SiO[SiO(CH3)2]nSi(CH3)3

Descripción: Silicona 350 es un fluido de polidimetilsiloxano comúnmente usado como un fluido base en productos de cuidado personal, debido a su excelentes características de dispersión y las características únicas de la volatilidad. Es claro, insípido e inodoro, esencialmente y no graso.

A diferencia de otros carriers volátiles utilizados en la industria del cuidado personal, este fluido de silicona volátil no enfría la piel cuando se evapora, una consecuencia de su inusualmente bajo calor de vaporización.

Modo de Empleo: Silicona 350 se puede usar solo o mezclado con otros fluidos cosméticos para proporcionar una base de fluida para una variedad de ingredientes cosméticos. Se dispone de una buena solubilidad en la mayoría de los alcoholes anhidros y en muchos disolventes utilizados en cosmética.

Solubilidad:
Alta solubilidad en: Solventes Clorados, en Solventes aromáticos y en Solventes alifáticos.
Buena solubilidad en Alcoholes.
Pobre solubilidad en Agua.

Vida Útil y Almacenamiento: Cuando se almacena a una temperatura de 25 ° C en los envases originales sin abrir, este producto tiene una vida útil de entre 30 y 60 meses a partir de la fecha de producción dependiendo de la viscosidad.

TRIGLICÉRIDOS CÁPRICO/ CAPRÍLICO
(GENTILEZA DE FAGRON IBÉRICA)

DENOMINACION INCI/CTFA: Caprylic/ Capric Triglyceride

Sinonimas: Triglicéridos de Cadena Media; MCT oils

Descripción: Es un aceite neutro compuesto por fracciones de ácidos grasos de coco C8-C10.

Características:

INDICE DE ACIDEZ: < 0.1
INDICE DE SAPONIFICACION: 335-350
INDICE DE YODO: aprox. 0.5
INDICE DE HIDROXILO: < 5
INDICE DE REFRACCION (20º C):1.448-1.450
PUNTO DE ENTURBIAMIENTO: < a - 5º C
PUNTO DE SOLIDIFICACION: < a - 10º C
DENSIDAD (20º C): 0.945-0.949 g/cm3
VISCOSIDAD (20º C): 25-31 mPas

Propiedades: Es un triglicérido de ácidos grasos vegetales saturados. Debido a su carácter neutro, es un componente oleoso muy afín a la piel. Aceite no oclusivo, permite la evaporación de agua.

Su bajo contenido en sustancias insaturadas y su bajo índice de acidez, aportan una estabilidad excelente y duradera al producto. Como ingrediente activo o bien como vehículo inerte, los triglicéridos de cadena media presentan una baja viscosidad en comparación con los aceites vegetales.

Es miscible con alcohol etílico, alcohol isopropílico, cloroformo, glicerina. Posee también propiedades disolventes para materias liposolubles. Es un producto muy estable, tanto almacenado a altas como bajo condiciones de humedad atmosférica elevada.

Aplicaciones: Como vehículo disolvente, permite la adición de principios activos sensibles, los cuales a veces sólo pueden ser manipulados a bajas temperaturas, pues permanece líquido a temperaturas inferiores a los 0ºC.

Los campos típicos de aplicación son:

- Productos dermofarmacéuticos y cosméticos
- Cremas y todo tipo de emulsiones (o/w, w/o y ungüentos anhidros): 5-40 %.

- Aceites corporales y de baño: 10-60 %.
- Champúes y preparados sobreengrasantes para el baño: 3-20 %.
- Preparados en forma de barra: 10-40 %.

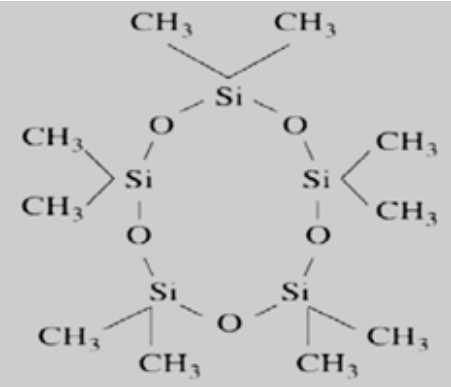
DOW CORNING 245-SILICONA VOLÁTIL 344

INCI: Cyclopentasiloxane

Apariencia: Líquido incoloro.

Características:
- Vehículo volátil
- Compatible con una amplia gama de ingredientes cosméticos
- Baja tensión superficial

Estructura Química:



Beneficios:
- Imparte tacto sedoso suave para la piel
- Difusión Excelente
- No deja residuos aceitosos ni acumula.
- Elimina la pegosidad.
- No es grasosa

Modo de empleo: XIAMETER PMX-0245, Ciclopentasiloxano se puede utilizar solo o mezclado con otros fluidos cosméticos para proporcionar una base de fluido para una variedad de ingredientes cosméticos.

Se dispone de una buena solubilidad en la mayor parte alcoholes anhidros y en muchos disolventes cosméticos.

XIAMETER PMX-0245,Ciclopentasiloxano es un líquido volátil con una presión de vapor apreciable a temperatura ambiente.

Vida útil y Almacenamiento: Si XIAMETER PMX-0245, se congela en ningún caso debe usarse una llama para fundir el producto.

Cuando se almacena a una temperatura de 25°C, en los envases originales sin abrir, este producto tiene una vida útil de 30 meses a partir de la fecha de producción.

PROPILENGLICOL

Sinónimos: 1,2-Propanodiol. 2-Hidroxipropanol. Metiletilenglicol. Metilglicol. E1520.

INCI: Propylene glycol.

Formula molecular: C3H8O2

Peso molecular: 76,09

Datos físico-químicos: Líquido viscoso, límpido, incoloro, higroscópico. Miscible con agua y con etanol al 96%.

Densidad: 1,038 g/ml (20 ºC).

Índice de refracción: 1,4324 (20ºC).

Propiedades y usos: Es un excipiente disolvente, cosolvente, y humectante, con propiedades bactericidas y fungicidas. A concentraciones elevadas actúa como conservante de efectividad casi similar al etanol, sobretodo conjuntamente con parabenos, por lo que se usa en dermatología para prevenir o tratar infecciones secundarias. Es un buen vehículo para principios activos con insuficiente solubilidad en agua o inestables en soluciones acuosas, como antihistamínicos, barbitúricos, vitaminas A y D, paracetamol, alcaloides, esteroides, fenoles, sulfamidas, anestésicos locales, aceites volátiles. Se considera una base hidrosoluble que

tiene una acción emoliente (impidiendo la desecación de la epidermis en su capa córnea) y protectora de la piel (impidiendo la acción de irritantes). A elevada concentración (> 40 %) tiene acción queratolítica, aumentando la abrosción de los proncipios activos, aunque puede ser demasiado irritante. Tiene un efecto estabilizante de emulsiones. También se usa como agente plastificante en formulaciones para recubrir la piel con un film. Aporta menor viscosidad que la glicerina a las fórmulas magistrales. Se incorpora en la fase acuosa de las emulsiones. Las soluciones acuosas pueden esterilizarse al autoclave. Una solución acuosa al 2 % es isoosmótica con el suero.

Dosificación:

- Como solvente o cosolvente: tópicos 5 - 80 %
  soluciones orales 10 - 25 %
  parenterales 10 – 60 %
- Como humectante: aprox. 15 %.
- Como conservante: 15 - 30 %.

Efectos secundarios: Es irritante y sensibilizante por vía tópica, sobretodo a concentraciones mayores al 30 %. En ese caso se puede sustituir por Glicerina o Sorbitol sol. 70%. Puede producir hemólisis por vía interna a más del 35 % de concentración.

Incompatibilidades: Algunos agentes oxidantes como el potasio permanganato.

Observaciones: Presenta tendencia a la oxidación a elevada temperatura, por lo que no se debe exponer al calor o a la llama.

Conservación: En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ Y DE LA HUMEDAD.

SEPIGEL 305

Fórmula marco:
Polyacrylamide 35 – 45 %
C13-14 Isoparaffin 15 – 25 %
Laureth-7 3 – 8 %

Datos físico-químicos: Líquido viscoso o ligeramente amarillento, opalescente, con ligero olor característico.

Densidad: aprox. 1,08 g/ml. Índice de refracción: aprox. 1,4450.

Propiedades y usos: Es una mezcla de polímero acrílico, isoparafina, y un emulgente. El Sepigel 305 tiene propiedades gelificantes. La isoparafina hace que los geles obtenidos no sean transparentes, pero permite cierta afinidad con componentes grasos. El emulgente permite obtener geles con una concentración baja de producto y sin necesidad de dispersión ni neutralización. Simplemente hay que añadir el producto sobre la solución a gelificar con agitación suave. La gelificación es instantánea. Los geles tienen buena consistencia y no hay adhesividad. El rango de pH de máxima estabilidad del gel es de 4 – 9 (pudiendo aguantar hasta 2 – 12). Los geles admiten la incoporación de hasta un 45 % de alcohol y/o propilenglicol. El Sepigel 305 también tiene propiedades espesantes y estabilizantes de emulsiones. Se incorpora con agitación ligera bien templadas o ya frías.

Dosificación:
Vía tópica: Al 2 – 3 % como gelificante
Al 0,3 – 3 % para aumentar la viscosidad de las emulsiones
Al 3 – 10 % en cremigeles.

Incompatibilidades: Tiene baja tolerancia a los electrolitos.

Conservación: En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

MELATONINA

Sinónimos: N-Acetil-5-metoxitriptamina. Regulina.

Fórmula molecular: C13H16N2O2

Peso molecular: 232,28

Datos físico-químicos: Polvo cristalino blanco o casi blanco. Insoluble en agua, soluble en etanol. Libremente soluble en DMS y soluble 0,5 g en 10 g de propilenglicol.

Punto de fusión: 116-118ºC.

Absorción UV máx: 223, 278 nm.

Propiedades y usos: Se trata de una neurohormona producida por la glándula pineal a partir del triptófano.

Interviene en la inhibición del desarrollo gonadal y en el control del estro. También actúa en los cambios de coloración de la piel, con fines protectores. Parece existir un ritmo diurno de secreción de melatonina: se segrega en las horas de oscuridad y puede influir en el patrón de sueño. Se ha estudiado su efecto en el insomnio, jet lag, y tratornos depresivos.

En adultos, la absorción de la melatonina ingerida es completa y puede disminuir hasta el 50% en la gente mayor. Los alimentos afectan tanto la velocidad de absorción como la concentración sérica de la melatonina. La cinética es lineal en un intervalo de dosis entre 2 y 8 mg y la biodisponibilitat del 15% aproximadamente puesto que experimenta un significativo efecto de primer paso. La fijación a proteínas plasmáticas es del 60%, la mayor parte a la albúmina, a la glucoproteína ácida alfa1 y a las lipoproteínas de alta densidad (HDL). La principal vía de metabolización es la hepática por medio del sistema del citocromo P450 y de los isoenzimas correspondientes CYP1A1, CYP1A2 y posiblemente también el CYP2C19. Los metabolitos inactivos y una pequeña proporción de la melatonina inalterada (2%) tienen una semivida de eliminación de 3,5-4 h y se excretan por vía renal en forma de conjugados sulfatados y glucuronicos.

En monoterapia, la Melatonina está indicada en el tratamiento a corto plazo del insomnio primario caracterizado por un sueño de mala calidad en pacientes de más de 55 años.

Dosificación: Normalmente se trata de una sustancia de administración oral en forma de comprimidos de liberación modificada. La dosis recomendada es de un comprimido de 2 mg, una vez al día, 1-2 horas antes de ir a dormir, después de haber ingerido algún alimento. Continuar esta pauta de dosificación durante tres semanas.

Uso tópico: entre 0,5 a 1 %

Contraindicaciones: No debe utilizarse en pacientes con enfermedades autoinmunes, insuficiencia renal, o insuficiencia hepática.

Se debe usar con precaución en situaciones en que la somnolencia pueda conllevar un riesgo para la seguridad, como la conducción de vehículos o el manejo de maquinaria.

Precauciones: No hay datos clínicos referidos a la utilización de la melatonina en el embara-

zo, por lo tanto y aunque los estudios en animales no muestren efectos teratogénicos, no se recomienda la utilización en este estado. Se ha detectado melatonina endógena en la leche materna, razón por la cual se sospecha que también se podría excretar si se hace una administración exógena, así pues, no está recomendada la utilización durante el amamantamiento.

Interacciones: La melatonina se metaboliza por el sistema del citocromo P450, por lo tanto las interacciones se producirán con fármacos que utilizan esta misma vía: inhibidores del metabolismo (fluvoxamina, metoxaleno, cimetidina, estrógenos, quinolonas...) y inductores del metabolismo (fenobarbital, carbamacepina, tabaco).

Son también conocidos los efectos sobre los niveles de melatonina endógena provocados por diferentes tipos de medicamentos: agonistas y antagonistas adrenérgicos, agonistas y antagonistas opiáceos, antidepresivos, inhibidores de las prostaglandinas, benzodiazepines, triptófano y el alcohol.

Conservación: En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.
Recomendado conservar a menos de 25ºC.

DIMETILSULFÓXIDO

Sinónimos: DMSO. Sulfinilbismetano.

Formula molecular: C_2H_6OS

Peso molecular: 78,13

Descripción: Solvente dipolar aprótico.

Datos físico-químicos: Liquido incoloro o cristales incoloros, higroscópico. Miscible con agua y con etanol al 96%.

Punto de fusión: 18,5ºC.

Densidad: 1,100 – 1,104 g/ml.

Índice de refracción: 1,4780 – 1,4790.

Propiedades y usos: Presenta un amplio espectro de actividad farmacológica, incluyendo una acción penetrante de membranas, antiinflamatoria, analgésica local, bacteriostática débil, vasodilatadora y diurética. Atraviesa la barrera epidérmica, solubiliza el colágeno y libera radicales libres.

Se absorbe rápidamente por todas las vías. Se metaboliza por oxidación a dimetilsulfona (que se excreta junto con el DMSO por orina y heces) y reducción a sulfuro de dimetilo (que se excreta por pulmones y piel).

Su principal utilización es como vehículo en la administración de fármacos, incrementando el paso a través de la piel e intensificando su acción, por lo que también aumenta su riesgo de toxicidad, por lo que hay que usarlo con precaución a las mínimas concentraciones posibles. También se emplea en solución acuosa en instilaciones vesicales, en el alivio sintomático de la cistitis intersticial.

Se ha usado por vía oral, intravenosa o tópica para un amplio rango de indicaciones, como por ejemplo, alteraciones cutáneas y musculoesqueléticas, aunque su efecto beneficioso es limitado.

Por vía tópica se emplea como irritante en el tratamiento de la alopecia areata y del líquen amiloidoso.

Por vía oral o parenteral se emplea también en la amiloidosis renal.

Dosificación: Como solvente hasta el 100%.

Como potenciador de la penetración de principios activos vía tópica, a partir del 80%.

En soluciones para instilación para la cistitis intersticial, al 50% en dosis de 50 ml durante 15 min, repitiendo la terapia cada dos semanas.

En solución alcohólica al 10% para el líquen amiloidoso.

Al 4% vía oral o al 2% vía parenteral para la amiloidosis renal.

Efectos secundarios: Elevadas concentraciones aplicadas por vía tópica causan quemazón, prurito, eritema, vesiculación y urticaria, y, con su empleo continuado, descamación.

Pueden aparecer efectos sistémicos después de su utilización por algunas de las vías, como transtornos gastrointestinales, dolor de cabeza, somnolencia y reacciones de hipersensibilidad. Además puede producir olor a ajo en el aliento y en la piel.

Se ha observado hemólisis intravascular después de la administración intravenosa, y molestias y espasmos después de la instilación vesical.

Precauciones: Su uso como base penetrante puede aumentar las acciones tóxicas del fármaco.

Recomendado realizar un control de la funcionalidad ocular cada 6 meses en tratamientos prolongados, y un control de la funcionalidad hepática y renal 2 veces al año.

Las instilaciones vesicales pueden ser perjudiciales en pacientes con tumores malignos en el tracto urinario, debido a la vasodilatación que ocasiona.

Interacciones: Reduce las concentraciones plasmáticas de sulindaco, y ambos farmacos administrados conjuntamente han dado lugar a neuropatías periféricas.

Incompatibilidades: Plásticos (envasar siempre en vidrio), agentes oxidantes.

Observaciones: Fotosensible. Muy higroscópico.
Puede CONGELAR. Si es así, antes de su uso calentarlo al baño María muy ligeramente (máximo 25 – 30 ºC) con el envase destapado y con todas las precauciones necesarias.

Declarar en el cartonaje “Puede causar molestias de estómago, diarrea, somnolencia, y dolor de cabeza”.

Conservación: En frascos de vidrio, HERMETICAMENTE CERRADOS. PROTEGER DE LA LUZ.

FORMULACIÓN CREMA ANTI RADICALES LIBRES

Sepigel 305	3 %
Propilenglicol	5 %
Triglicéridos cáprico caprílico	3 %
Silicona 350	3 %
Silicona volátil	3 %
Melatonina	1 %
DMSO	1,5 %
Agua Conservada csp	100 g

Procedimiento: En recipiente adecuado, pesar el sepigel 305 junto al propilenglicol, agregar la mitad del agua conservada y batir enérgicamente hasta obtener una crema. Agregar los triglicéridos, la silicona 350 y la silicona vólatil. Mezclar bien hasta homogeneidad. Por otro lado, disolver la melatonina en el DMSO. Añadir a la crema antes formada, completar el peso con el agua conservada. Batir hasta obtener una crema homogénea.

Se recomienda un PH entre 4.5 a 5.0, conservando a temperatura inferior a 25°C. Por un tiempo de 3 meses.

Aspecto: Cremigel homogéneo libre de elementos extraños.

BIBLIOGRAFÍA:

Acofarma Fichas Técnicas
www.ulprospector.com