

Adiporeguline®

Aspartame + Cafeína



Adiporeguline®

Liporregulador com Aspartame + Cafeína

INCI Name: Caffeine, Sodium Salicylate, Lysolecithin, Hydrogenated Lecithin, Aspartame, Glycine Soja (Soybean) Germ Extract, Silica, Coleus Forskoliroot Extract.



Descrição

A empresa francesa Lucas Meyer, especialista no desenvolvimento de sistemas de liberação e fosfolipídeos, desenvolveu um ativo completo para a redução de medidas, Adiporeguline®. Este é o primeiro liporregulador com aspartame que age nos adipócitos, destinado ao tratamento da celulite.

Regulação dos processos de troca com a membrana

- Ativação da lipólise pela cafeína vetorizada
- Redução da lipogênese pelo aspartame

Regulação do metabolismo lipídico

- Diminuição do perímetro da coxa
- Redução do tamanho e da densidade dos adipócitos
- Diminuição do aspecto "casca de laranja"

Fisiopatologia da Celulite

A celulite, também conhecida como lipodistrofia ginóide, é um problema estético comum para as mulheres, caracterizado por um aspecto cutâneo de "casca de laranja", localizado principalmente nos glúteos e nas coxas. Ela é formada do desequilíbrio entre a lipogênese (produção e armazenamento de gordura) e a lipólise (quebra da gordura), envolvendo uma contínua produção de triglicerídeos com diminuição da lipólise. Assim, os lipídeos são estocados, resultando no aparecimento da celulite. Este desequilíbrio está ligado ao declínio da atividade catabólica da lipase hormônio-sensível (LHS) dependente de AMP cíclico.

Tratamento para Celulite

A solução inovadora para o tratamento da celulite está relacionada com a regulação da membrana celular, de modo a reduzir os adipócitos, através da diminuição da produção e do armazenamento de lipídeos.

O balanço do metabolismo lipídico em nível de adipócito está relacionado com o balanço nas propriedades da membrana de modo a:

- Reduzir o metabolismo da glicose.
- Promover a excreção de glicerol e ácidos graxos.

Adiporeguline®: Mecanismo de Ação Inovador

Adiporeguline® é um ativo completo que atua diretamente nas membranas celulares dos adipócitos e nas duas etapas do metabolismo:

Redução da lipogênese:

Aspartame: reduz o influxo de glicose para dentro da célula por antagonizar os receptores GLUT4. Além disso, promove a redução da formação de triglicerídeos, por meio da diminuição do metabolismo da glicose e da produção de lipídeos.

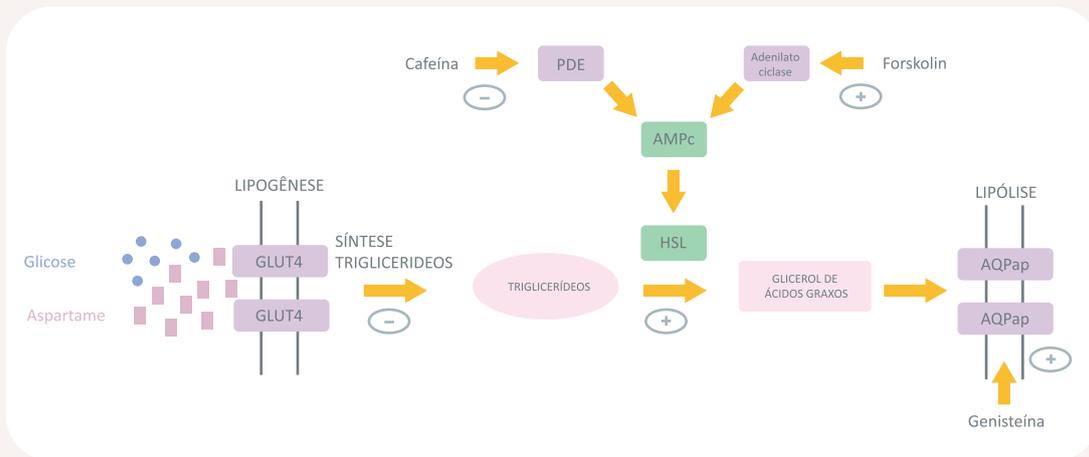
Ativação da lipólise:

A hidrólise dos triglicerídeos em ácido graxo e glicerol está ligada a ação de enzimas chaves, como a HS lipase, contida nos adipócitos.

Atualmente, a enzima lipase hormônio-sensível é ativada pela fosforilação, a qual é estimulada pela proteína cinase AMP cíclico-dependente. A produção de AMP cíclico depende do sistema adenilcicase e de agente estimulantes, como as catecolaminas.

Os ingredientes de Adiporeguline® que promovem a ativação da lipólise são:

- Forskolin: Aumenta a concentração de AMP cíclico, influenciando a ação da HS lipase;
J. Pharmaed Exp. Ther. 1986 Aug.; 238(2): 659-64.
- Cafeína: Inibe a fosfodiesterase (PDE), aumentando a meia-vida do AMP cíclico, que promove seu aumento intracelular, resultando no aumento da lipólise;
Arq Bras Endocrinol Metab v.47 n.2 São Paulo abr. 2003.
- Genisteína: Inibe as etapas finais da cascata lipídica. Além de estimular o aumento da expressão dos canais de aquaporinas, acelerando a detoxificação celular.



Mecanismo de ação de **Adiporeguline®**. O aspartame liga-se aos receptores GLUT 4, antagonizando a ação da glicose, enquanto a cafeína e o forskolin potencializam a hidrólise de triglicerídeos, aumentando o AMP cíclico e a atividade HS lipase. Com isso, a genisteína estimula os canais de aquaporina, aumentando a liberação de glicerol.

Sistema de Liberação por Fosfolipídeos

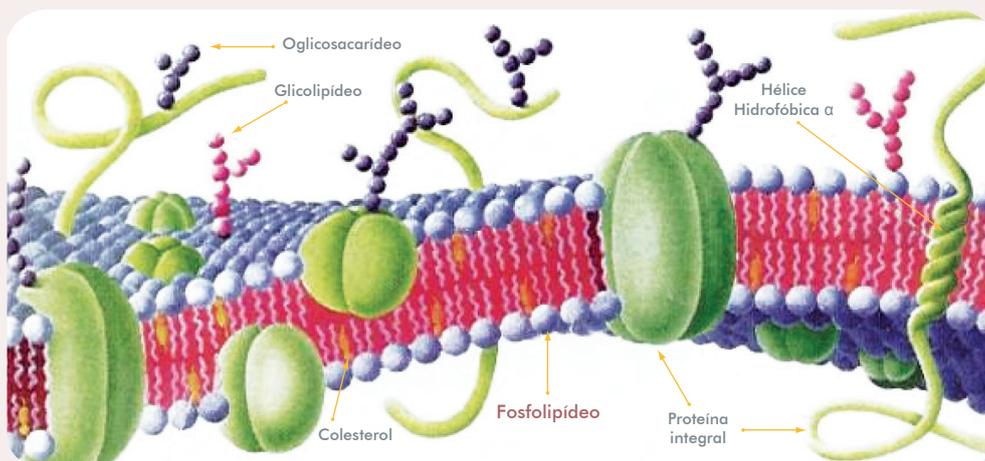
Para agir com efetividade nos adipócitos, os ativos necessitam atingir seus alvos. No entanto, para alcançar o local de ação com efetividade é necessário ter sistemas de liberação que garantam que o ativo chegue com eficácia, sem promover efeitos deletérios.

Os fosfolipídeos são moléculas naturais usadas por todas as células que permitem uma troca entre o meio intracelular e o meio extracelular.

Desse modo, moléculas anfifílicas como a cafeína, quando combinadas com fosfolipídeos, penetram com uma eficácia superior à pele e em suas células. Sem este veículo natural, moléculas hidrofílicas, como o aspartame, poderiam ser pressionadas para fora pela barreira cutânea. Da mesma maneira que o **forskolin** e a **genisteína**, que não são solúveis em formulações padrões, são disponíveis graças ao sistema de liberação promovido pelos fosfolipídeos.

- Sistema de liberação com fosfolipídeos

 → Excelente penetração, atingindo os adipócitos mais profundos
 → Desenvolvido com complexo solúvel de fácil manipulação



Membrana plasmática e seus componentes, entre eles em destaque os fosfolípidos.

Eficácia Comprovada de Adiporeguline®

Eficácia ex vivo

Adiporeguline® aumenta a lipólise em 30%

O objetivo deste estudo foi verificar a atividade lipolítica de **Adiporeguline®**. Para a realização do estudo de eficácia ex vivo, foi aplicada uma emulsão contendo 8,3% de **Adiporeguline®** (equivalente a 5% de cafeína) versus placebo, em tecidos cutâneos de humanos, por um período de oito dias.

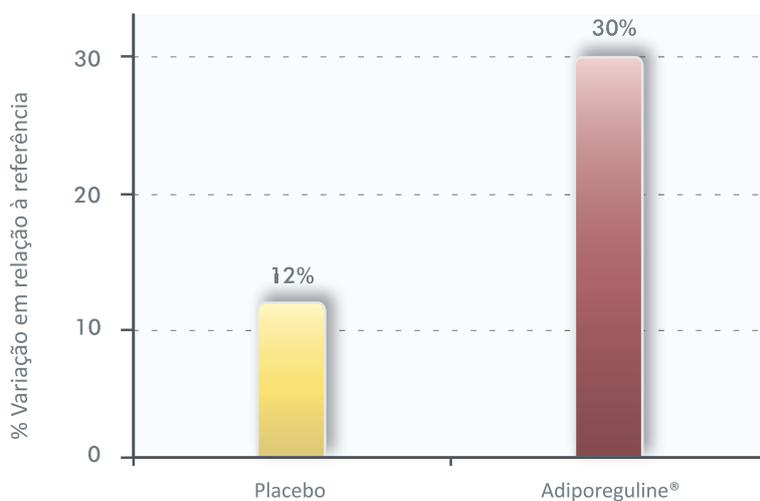
A avaliação da atividade lipolítica foi realizada através da dosagem de glicerol nos meios de culturas, além de ser realizada a análise das imagens relacionada ao tamanho dos adipócitos, sendo estes mensurados em três parâmetros: superfície, perímetro e diâmetro.

Resultados

Adiporeguline® promoveu:

- Ativação da lipólise via HS lipase.
- Promoveu um aumento de 30% na lipólise.

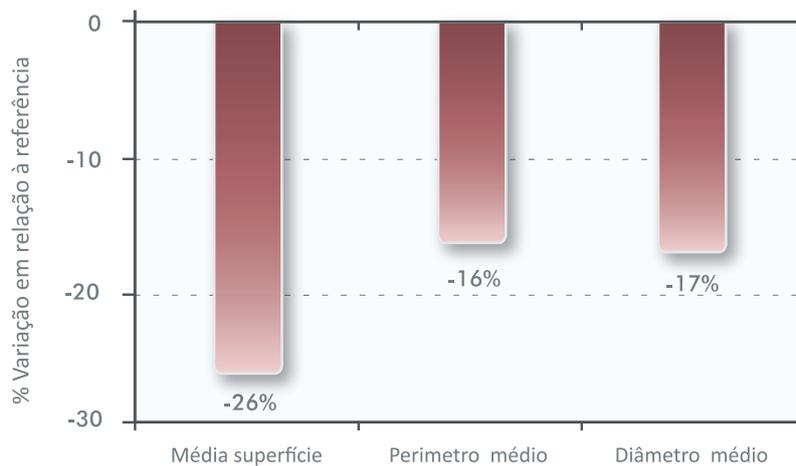
Avaliação do Percentual de Glucose Liberados no Meio de Cultura



Adiporeguline® envolve um significativo aumento de 30% de glicerol livre no meio de cultura, em comparação com a referência mostrando lipólise.

*Significativa diferente ($p < 0,05$) - Referência: zona não tratada.

Diminuição da Superfície, Perímetro e Diâmetro dos Adipócitos



Significativo aumento de 30% de glicerol livre no meio de cultura, em comparação.

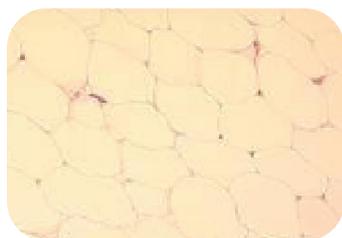
*Significativa diferente ($p < 0,05$) - Referência: zona não tratada.

Resultados

Adiporeguline® promoveu:

- Diminuição na superfície média dos adipócitos em 26% após oito dias de tratamento.
- Diminuição no perímetro dos adipócitos em 16% e no diâmetro dos adipócitos em 17%.
- Redução do aspecto “casca de laranja”, proporcionando uma pele mais firme.

Redução do Aspecto “Casca de Laranja”



Referência



Com Adiporeguline®

Imagem do tecido cutâneo humano, evidenciando o aspecto “casca de laranja” promovido pelo Adiporeguline® após oito dias de tratamento.

Eficácia ex vivo

Adiporeguline® reduz a lipogênese em 28%

O objetivo deste estudo foi verificar a atividade inibitória da lipogênese de Adiporeguline®. Para a realização do estudo de eficácia ex vivo, foram aplicadas diferentes emulsões em tecidos cutâneos humanos por um período de oito horas.

Emulsão 1
8,3% de Adiporeguline®
(equivalente a 5% de cafeína)

Emulsão 3
Baseada em cafeína e álcool

Emulsão 2
Baseada em extrato vegetal e
álcool

Emulsão 4
Placebo

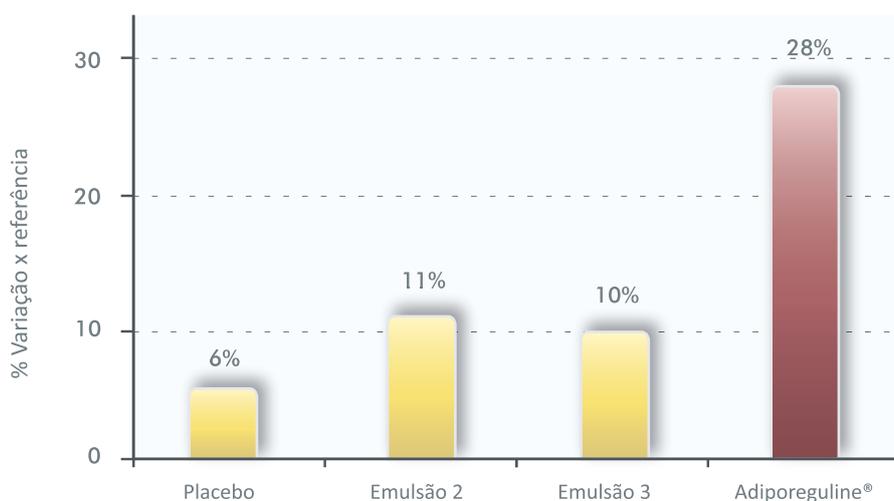
A avaliação da atividade inibitória da lipogênese foi realizada através da dosagem de glicose nos meios de culturas, além de ser realizada a análise das imagens relacionadas ao tamanho dos adipócitos.

Resultados

Adiporeguline® promoveu:

- Inibição da lipogênese em 28% se comparado as outras formulações.
- Ação antagonista à glicose devido a presença dos aspartame, o que previne o metabolismo da glicose e a lipogênese.

Avaliação do Percentual de Glicose Presente no Meio de Cultura



Adiporeguline® envolve um significativo aumento de 28% de glicose no meio de cultura com o da referência.
*Significativa diferente ($p < 0,05$) - Referência: zona não tratada.

Eficácia *in vivo*

Adiporeguline® reduz 0,64cm de coxa após 28 dias

Com o objetivo de avaliar a atividade lipólítica de Adiporeguline®, foi realizado um estudo *in vivo* com 25 voluntárias que aplicaram na coxa uma emulsão contendo 8,3 de Adiporeguline® (equivalente a 5% de cafeína), duas vezes ao dia, por um período de oito semanas. A avaliação dos resultados foi realizada no perímetro da coxa após 2 semanas.

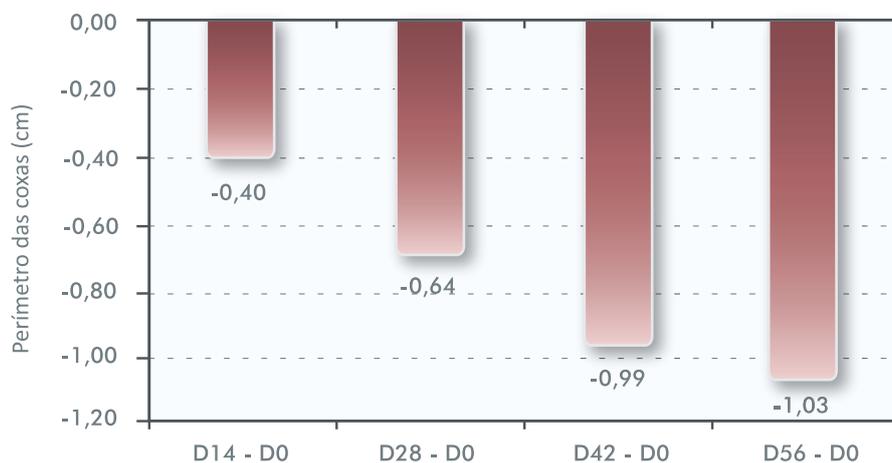
Resultados

Adiporeguline® promoveu:

- Uma redução de medidas no perímetro da coxa em mais de 80% das voluntárias após a aplicação de Adiporeguline®.
- Redução na coxa de 0,40cm após 14 dias de aplicação.

- Após 56 dias de aplicação de **Adiporeguline®**, a redução no perímetro da coxa foi de 1,03cm, sendo que algumas voluntárias perderam até 2cm de coxa.

Redução de 1,03cm de Coxa após 56 Dias de Tratamento



Teste in vivo em 25 indivíduos do sexo feminino com IMC > 18,7. Fórmula: O/A gel creme contendo 8,3% de Adiporeguline®

*Significativa de D14: - 0,40cm

Conclusão

Adiporeguline® comprovou ser eficaz no tratamento da celulite, uma vez que atua efetivamente aumentando a lipólise e reduzindo a lipogênese, devido ao seu mecanismo de ação que “blinda” a formação da celulite e o aumento de medidas.

Especificações Farmacoténicas

INCI Name	Caffein, Sodium Salicylate, Lysolecithin, Hydrogenated Lecithin, Aspartame, Glycinesoja (Soybean) germ stract, Silica, Coleus Forskoliroot Extract.
APARÊNCIA	Pó bege
FORMULAÇÃO	Dispensar em água a 70° durante 20 minutos
pH ÓTIMO	> 4
DOSAGEM	2 a 10%
APLICAÇÃO	Cremses, loções e géis
INDICAÇÃO	Corpo

Referências

Lucas Meyer, França.
Referência do Forskolin.

Rui Curi; Cláudia J. Lagranha; Jair Rodrigues G. Jr; Tania Cristina Pithon-Curi; Antonio Herbert Lancha Jr; Ídico L. Pellegrinotti; Joaquim Procópio. **Ciclo de Krebs como fator limitante na utilização de ácidos graxos durante o exercício aeróbico.** Arq Bras Endocrinol Metab v.47 n.2 São Paulo abr. 2003

Szkudelska K, Nogowski L, Szkudelski T. **Genistein affects lipogenesis and lipolysis in isolated rat adipocytes.** Department of Animal Physiology and Biochemistry, University of Agriculture, 60-637 Woły ska 35, Poznan, Poland. J Steroid Biochem Mol Biol. 2000 Dec 31;75(4-5):265-71.



BIOTEC DERMOCOSMÉTICOS LTDA.

Rua Gomes de Carvalho, 1069 - 5º andar
CEP 04547-004 - Vila Olímpia - São Paulo - SP
Tel: 55 (11) 3047 2447 / Fax: 55 (11) 3047 2455
info@biotecdermo.com.br



0800 770 6160

www.biotecdermo.com.br