

DERMOFARMACIA

Consideraciones acerca de la Formulación de los Antisolesares y los Bronceadores

Dra. Bertha Pareja(1)

(1) Farmacéutico Clínico, Profesor Emérito de la UNMSM

Desde el punto de vista de la tecnología farmacéutica, las preparaciones de empleo tópico son las más difíciles de diseñar y formular, debido a que en ningún otro grupo es necesario considerar el gran número de variables inherentes a esta vía de administración, ni el gran número de factores que pueden modificar su actividad farmacológica. Esto ha dado lugar a que exista un gran número de ensayos in vivo e in vitro para su evaluación y que las formas de presentación de un mismo principio activo sean muy numerosas, según sea el efecto terapéutico deseado. Así, encontramos en el mercado pomadas, cremas, lociones, suspensiones y soluciones conteniendo una misma molécula o sus derivados, que permiten emplearlas en los diferentes estadios de un mismo proceso patológico.

Sin embargo, desde el advenimiento de la Biofarmacia (1964) se han establecido ciertas normas generales que permiten realizar la formulación con criterio científico y en forma racional y ordenada. Así por ejemplo para formular un producto farmacéutico, administrable por cualquier vía, es necesario tener un buen conocimiento de la estructura y funciones del lugar de aplicación, así como de las propiedades fisicoquímicas y estructura de los principios activos y las bases o diluyentes, a los que debemos añadir, para el caso de los antisolesares y bronceadores, la naturaleza de las radiaciones solares y sus efectos sobre la piel.

Como sabemos, el espectro solar comprende básicamente tres zonas fundamentales que son: la luz visible o luz blanca, la luz ultravioleta y la infrarroja. La primera está compuesta por diferentes radiaciones que podemos observar en el fenómeno del arco iris, o cuando se refracta la luz a través de un prisma donde vemos los colores violeta, indigo, azul, verde, amarillo, anaranjado y rojo.

A partir del violeta, se sitúan las radiaciones invisibles que constituyen la zona ultravioleta y después del rojo, otras, también invisibles, constituidas por las radiaciones infrarrojas. El espectro solar nos proporciona aproximadamente 5% de radiaciones UV, 45% de radiaciones visibles y 50% de infrarrojas IR. Fig 2.

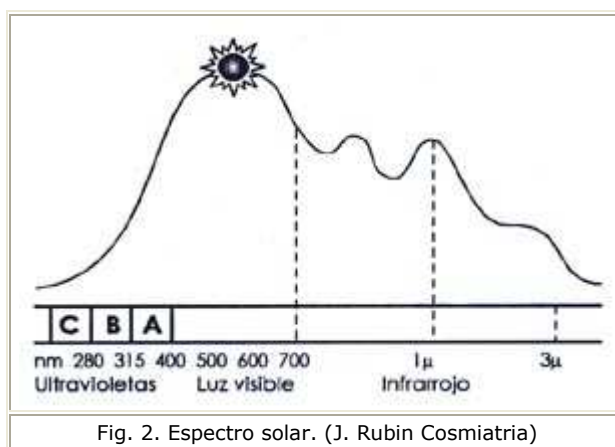


Fig. 2. Espectro solar. (J. Rubin Cosmiatria)

Nuestros sentidos corporales solamente perciben una proporción muy pequeña de estos rayos de luz y calor; fuera de este radio limitado, la mayoría de ellos sólo pueden registrarse con instrumentos más sofisticados o por algunas terminaciones nerviosas especializadas.

Las radiaciones UV representan el componente con mayor poder energético del espectro solar; de manera general se las divide en tres partes, es decir largas, medianas y cortas, según su longitud de onda. Las primeras atraviesan la mayor parte de los vidrios comunes, y en referencia a su efecto sobre la piel, no producen enrojecimiento, o sea eritema, pero sí poseen poder pigmentógeno, es decir que son las responsables del tan deseado bronceado que todos buscamos en el verano y que se manifiesta por un atractivo color dorado de la piel. Los del segundo grupo son los rayos eritematógenos, que son los que producen las quemaduras cuyas manifestaciones son el eritema, edema, formación de ampollas, ardor y a veces fiebre, además de una pigmentación grisácea poco estética. Por último, los UV del tercer grupo que son absorbidos por las capas más altas de la atmósfera y la estratósfera y no llegan a la superficie terrestre. Este proceso se atribuye a la capa de ozono, situada a una altura aproximada de 40 kilómetros; son poco eritematógenos, pero son potentes bactericidas.

En referencia a la acción de los rayos luminosos sobre la piel, la penetración es proporcional a la longitud de onda; así, los UV son casi totalmente absorbidos por las hileras superficiales de células de la epidermis, la luz visible es más penetrante que la UV y puede atravesar 0.6 mm de nuestra piel.

Los IR producen vasodilatación, que se manifiesta por un enrojecimiento inmediato pero de corta duración, débilmente pigmentógeno, mientras que los UV producen reacciones químicas importantes y sus efectos varían de acuerdo a la longitud de onda. Así, por ejemplo, las longitudes de onda comprendidas entre 250 y 300 nm son sobre todo eritematógenas con un máximo para los 296 nm. Esta es la zona de la quemadura solar que se manifiesta como un proceso inflamatorio con enrojecimiento; la piel se torna caliente, tensa y adolorida, y cualquier exposición posterior al Sol se toma intolerable. Fig 1.

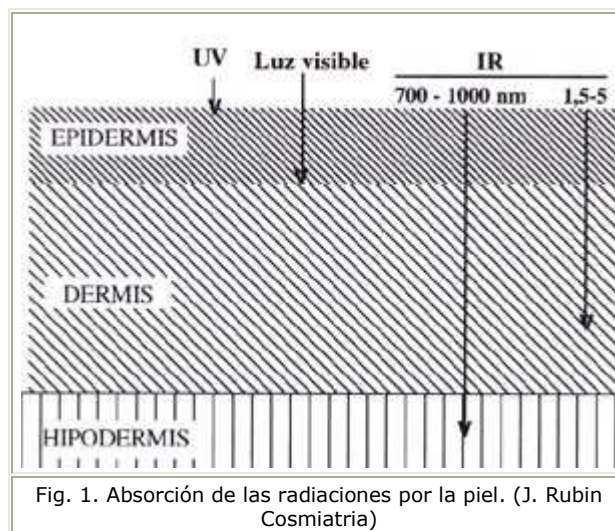


Fig. 1. Absorción de las radiaciones por la piel. (J. Rubin Cosmiatría)

Sólo las radiaciones absorbidas por la piel son biológicamente activas. Por eso, las que poseen los efectos más marcados y severos son las UV, en especial las de longitud de onda corta. Sin embargo, la acción de los IR, de manera especial los de

onda larga, así como los de la luz visible, deben ser tomados en consideración debido a su fuerte proporción en el espectro solar.

En lo referente a la protección de la piel de los efectos de la radiación solar, podemos decir que si bien la pigmentación es un mecanismo defensivo natural de la piel, no es suficiente para protegerla en todas las circunstancias, como por ejemplo en las exposiciones largas en la playa durante el verano, las excursiones a las montañas y la práctica de diferentes deportes, por lo que es necesario el empleo de otros medios, entre los que podemos mencionar los siguientes:

a) Empleo de sombreros y de bloqueadores físicos que protegen la piel del total de las radiaciones, sin dejar pasar ninguna fracción, ya que tienen la propiedad de reflejar el total de las radiaciones. Estas son cremas o pomadas fuertemente pigmentadas, vaselina amarilla o maquillajes especiales. Si bien estos son efectivos, tienen el inconveniente de que al formar una película gruesa, son inestéticos y dan mal aspecto a la persona que los emplea; sin embargo, previenen el eritema y el bronceado, lo cual es deseable en los niños pequeños o las personas de piel muy blanca.

b) Los absorbentes químicos, llamados también agentes filtrantes, son los más comúnmente empleados y se presentan en diferentes formas cosméticas como cremas, lociones o suspensiones; son los más seguros. Se formulan en diferentes concentraciones las que se diferencian por números según su potencia. Así por ejemplo, el bronceador No.4 es el más débil y corresponde a concentraciones del 2% de principio activo; se le emplea para los niños y las personas que se exponen al Sol por cortos periodos de tiempo. El No.8 que es el más empleado, generalmente corresponde a concentraciones de principio activo del 5% y es utilizado por la mayor parte de las personas; el No. 15 que es el de mayor concentración "sólo debe" utilizarse por prescripción del dermatólogo.

El mayor o menor éxito que se obtenga con estas preparaciones está en relación con la forma de su empleo, ya que el principio activo que contienen, es decir, el agente filtrante, tiene una vida media que varía entre 4 y 8 horas, lo que quiere decir que para proteger la piel, no es suficiente una sola aplicación, sino que hay que aplicarlo a intervalos regulares según el lugar y el tiempo de exposición al Sol, de manera especial cuando uno se baña en el mar.

En lo referente a la formulación de los protectores solares, en los últimos años se han realizado investigaciones destinadas a encontrar maneras de aumentar su efectividad, sin aumentar su concentración, ya que las altas concentraciones de los principios activos solubles podrían constituirse en sensibilizantes potenciales. Así se ha determinado que el empleo de micropartículas de compuestos insolubles como el ZnO o el Tio₂ presentan muchas ventajas, como por ejemplo, no son irritantes, son atóxicos, y su espectro de protección contra las radiaciones ultravioleta es muy amplio, ya que absorben radiaciones desde 380 nm hasta las del rango UVC. Fig 4.

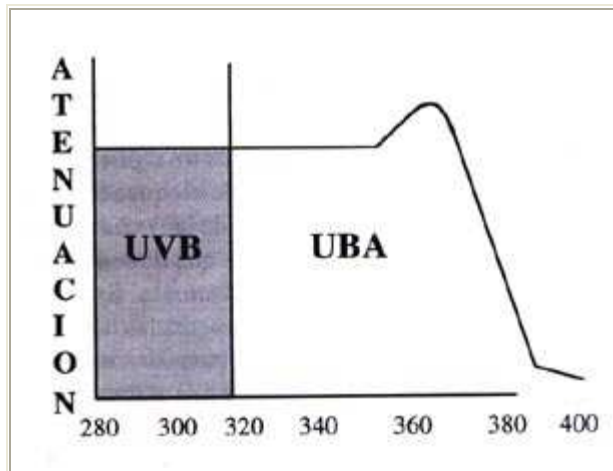


Fig. 4. Longitud de Onda en Nanómetros
Atenuación de la radiación por el óxido de zinc

Su mecanismo de acción es muy diferente al de otros protectores, ya que por ser insolubles forman un "microfilm" que da una protección muy efectiva y carente de efectos adversos. Pueden añadirse a las fórmulas de casi todos los cosméticos como emulsiones, barras, cremas y pomadas, así como a preparaciones de empleo en dermatología, en los que sea necesario incluir un protector solar o dotarlas de propiedades especiales, como es el caso de algunas cremas conteniendo retinoides.

Estas propiedades de ZnO micropulverizado se deben a su índice de refracción y al tamaño y distribución de sus partículas con radios de hasta 100 nm y con un índice de refracción de 1.9 en la zona visible, lo que comparado con los índices de refracción de los ingredientes empleados en la formulación de los cosméticos, que son menores de 1.5, hace que el ZnO añadido a cualquier preparación de empleo tópico no altere su aspecto ni modifique significativamente su consistencia. Fig 3.

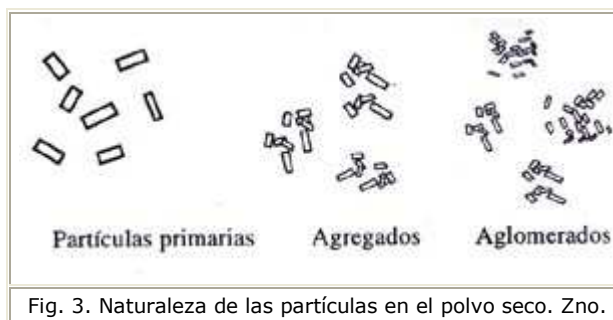


Fig. 3. Naturaleza de las partículas en el polvo seco. ZnO.

El TiO_2 es menos empleado ya que su índice de refracción es de 2.6, lo que hace que sea más difícil de enmascarar y sus partículas no son transparentes como las del ZnO micropulverizado.

Al presente, ya se encuentran en el comercio líneas de cosméticos, así como otros preparados de administración tópica, en los que se ha añadido un protector solar, siendo el más versátil e inocuo el ZnO, el cual para esta finalidad se obtiene por técnicas especiales que aseguran la constancia de su composición, así como sus características granulométricas y reológicas.

NOTA IMPORTANTE

Fé de erratas a Vol. 6 No. 3

p.5: Informaciones del CILAD (material informativo para los miembros del CILAD).

-4a línea dice José María Jiménez Camarosa, debe decir José María Jiménez Camarasa; dice Alberto Moscoso, debe decir Alberto Woscoff
-12ava línea dice: Miguel Armigo, debe decir Miguel Armijo.

p.42: 2da columna 4a y 5a línea, dice: los que necesariamente; debe decir: los que no necesariamente.

p.42: 2da columna, 12ava línea, dice: ese pigmento es el Betacaró, debe decir ese pigmento es el Betacaroteno

p.42: 2a columna, 18ava línea, dice: establecido por KERRER; debe decir establecido por KARRER

p.43: Figura: dice: Acido Retonoico, debe decir: Acido Retinoico

p.44: Fig. 3 (último gráfico) dice: Arotinoid-etl-sulfona, debe decir Arotinoid-etil-sulfona

p.45: Título: Plantas con aplicaciones farmacéuticas y cosméticas, 7a línea: dice: en el siglo puede verse, debe decir en el siglo I puede verse

p.46: la columna 32ava línea dice: azúcares reproductores, debe decir azúcares reductores.

p.46: Fig. dice: derivados antraquinicos, debe decir: derivados derivados antraquinónicos; dice: aloe barbarensis, debe decir aloe barbadense.