

# LITERATURA

тітило: Ácido Tranexâmico + Ácido Kójico + Lidocaína

Página 1 de 3

#### SUGESTÃO DE FÓRMULA

Ácido Tranexâm	ico	8mg
Ácido Kójico		20mg
Lidocaína		8mg
		2ml
pH = 7.0		

#### **FARMACOLOGIA**

As hiperpigmentações são, em geral, distúrbios caracterizados pelo aumento de melanina e outros pigmentantes na pele. Os principais desencadeadores são as radiações solares, os hormônios sexuais e agentes externos, fontes de radicais livres.

O ácido tranexâmico (AT) é um princípio ativo obtido por síntese química, é uma substância hidrofílica inibidora da plasmina, classicamente utilizada como agente antifibrinolítico. Entretanto tem sido estudado como alternativa para o tratamento do melasma. Estudos recentes revelaram que seu uso tópico previne a pigmentação induzida por UV em cobaias e que seu uso intradérmico intralesional produz clareamento rápido.

O Ácido Kójico é um dos despigmentantes naturais mais eficientes do mercado (é produzido por um cogumelo japonês chamado Koji) tendo sido muito utilizado com excelentes resultados. Tem ocupado uma posição de destaque entre as substâncias usadas para o clareamento de vários tipos de hipercromias cutâneas.

### MECANISMO DE AÇÃO

O ácido tranexâmico (AT) bloqueia a conversão do plasminogênio (presente nas células basais epidérmicas) em plasmina, por meio da inibição do ativador de plasminogênio. A plasmina ativa a secreção de precursores da fosfolipase A2, que atuam na produção do ácido araquidônico e induzem a liberação de fator de crescimento de fibroblasto (bFGF), esse último trata-se de um potente fator de crescimento de melanócito. Já o ácido araquidônico é precursor de fatores melanogênicos, como, por exemplo, prostaglandinas e leucotrienos.

O ativador de plasminogênio é gerado pelos queratinócitos e é responsável por aumentar a atividade dos melanócitos, ele apresenta níveis séricos aumentados com o uso de anticoncepcionais orais e durante a gravidez. O bloqueio dessa substância pode ser por mecanismo parácrino, por meio do qual o ácido tranexâmico (AT) reduz a hiperpigmentação do melasma de forma eficiente e rápida.

O Ácido Kójico é um potente despigmentante natural. Ele age como um quelante de íons cobre e inibe a ação da tirosinase (que precisa do íon cobre para ser ativada), promovendo a diminuição da formação de melanina, acabando com as manchas. Esse efeito ocorrerá após



# LITERATURA

TÍTULO: Ácido Tranexâmico + Ácido Kójico + Lidocaína

Página 2 de 3

duas a quatro semanas de uso contínuo, podendo demorar um pouco mais em algumas pessoas que tenham a pele oleosa e/ou muito espessa.

Associar essas duas substâncias: ácido tranexâmico e ácido kójico é muito mais interessante do que utilizá-los sozinhos porque ambos atuam na diminuição de hipercromias cutâneas, mas por mecanismos de ação diferentes, ou seja, agem em sinergismo; promovendo um resultado mais eficiente.

### **INDICAÇÕES**

Como proposta é indicado para redução da pigmentação de vários tipos de hipercromias cutâneas como melasma, manchas senis, hormonais, medicamentosas e por exposição solar.

#### **POSOLOGIA**

Aplicação intradérmica de 0,1ml ponto a ponto a cada cm² uma vez por semana.

### **CONTRA INDICAÇÕES E PRECAUÇÕES**

O medicamento é contra indicado para pacientes que tenham hipersensibilidade a qualquer componente da fórmula.

Não aplicar a formulação em crianças com idade inferior a 12 anos ou durante a gravidez ou amamentação. Não aplicar o despigmentante sobre a pele irritada ou inflamada e em queimaduras solares. Cumprir o tempo de tratamento, pois o resultado não é imediato, os sinais de melhora são percebidos gradativamente.

#### **EFEITOS ADVERSOS**

Os efeitos colaterais são mínimos, como eritema, equimose e ardência local; e as pacientes toleraram bem o tratamento, cuja realização mostra-se segura.

#### REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

- 1.Steiner D, Feola C, Bialeski N, Silva FAM. Tratamento do Melasma: revisão sistemática. Surg & cosmetic dermat 2009; 1:87-94.
- 2. Kroumpouzos G, Cohen LM. Dermatoses of pregnancy. J Am Acad Dermatol 2001; 45:1-19.
- 3. Pathak MA, Fitzpatrick TB, Kraus EW. Usefulness of retinoic acid in the treatment of melasma. J Am Acad Dermatol 1986; 15:894-9.
- 4. Hassun KM, Bagatin E, Ventura KF. Melasma. Rev Bras Med 2008; 65:11-6.



# LITERATURA

### TÍTULO: Ácido Tranexâmico + Ácido Kójico + Lidocaína

Página 3 de 3

- 5. Bolanca I, Bolanca Z, Kuna K et al. Chloasma the mask of pregnancy. Coll Antropol 2008; 32(2):139-41.
- Kim EH, Kim YC, Lee ES, Kang HY. The vascular characteristics of melasma. J Dermatol Sci 2007; 46(2):111
- 7. Grimes PE. Melasma. Etiologic and therapeutic considerations. Arch Dermatol 1995; 1453-7.
- 8. Kauh YC, Zachian TF. Melasma. Adv Exp Med Biol 1999; 455:491-9.
- 9. Manosroi A, Podjanasoonthon K, Manosroi J. Development of novel topical tranexamic acid liposome formulations. Internat J Pharmaceutics 2002; 235:61-70.
- 10. Maeda K, Naganuma M. Topical trans-4-aminomethylcyclohexanecarboxylic acid prevents ultraviolet radiation induced pigmentation. J Photochem Photobiol 1998; 47:130-41.
- 11. Lee JH, Park JG, Lim SH *et al.* Localized Intradermal Microinjection of Tranexamic Acid for Treatment of Melasma in Asian Patients: A Preliminary Clinical Trial. Dermatol Surg 2006; 32:626-31.
- 12. Maeda K, Tomita Y. Mechanism of the inhibitory effect of tranexamic acido n melanogenesis in cultured human melanocytes in the presence of keratinocyte-conditioned médium. J Health Sci 2007; 53(4):389-96.
- 13. Rev. Bras. Cienc. Farm. vol.43 no.2 São Paulo Apr./June 2007.
- 14. Roca, A.R. (2006). Despigmentantes. Acofar. 1(457), 28-30 2009 através de http://www.acofarma.com.
- 15. Soler, C. (2004). Despigmentantes. Acofar. 1(433), 27-29 2009 através de http://www.acofarma.com.
- 16. Informe técnico fornecedor galena.
- 17. Cosmetics & Toiletries (Edição em Português) Vol. 14, mai-jun 2002.
- 18. BATISTUZZO, J.A.O.; ITAYA, M.; ETO, Yukiko. Formulário Médico Farmacêutico, 2ª edição, São Paulo, Tecnopress, 2002.