

CLIMBAZOL: O mais novo e implacável anticaspas descoberto

SÍLVIA TORRES TEIXEIRA

Farmacêutica e encarregada técnica do SIAG - Galena

Ficha técnica:

Nome comum: *Climbazol*
DCB: 2477.01-7
Sinonímia: *não há referência*
Família Química: *Antifúngico e Anticaspas*
Fórmula Química: *C₁₅H₁₇ClN₂O₂*
Peso Molecular: 292,8
Ponto de Fusão: *94 a 98°C*
Dose usual: *0,1 a 2,0%*

A irritação do couro cabeludo é apontada como o principal motivo da manifestação da caspa. Acredita-se que um dos fatores desencadeantes dessa irritação é a ação do fungo *Malassezia furfur* sobre o couro cabeludo. Tem sido demonstrado que esse fungo é capaz de gerar lipídios livres, a partir do sebo humano. Supõe-se que a irritação do couro seja conseqüência da oxidação e peroxidação produzidas pela *Malassezia* sobre os lipídios da pele da cabeça (vide quadro esquemático).

O Climbazol é um agente anticaspas poderoso contra as diferentes cepas da *Malassezia furfur*. Ele atua especificamente sobre o possível fungo causador da caspa, enquanto os anticaspas comuns atuam com mais expressão sobre os microrganismos constituintes da flora epidérmica. Possui pouca atuação sobre a flora bacteriana do couro saudável, oferecendo melhores resultados no combate à caspa com menores prejuízos ao usuário. Age efetivamente na desestruturação da membrana do fungo, inibindo a 14-alfa-demetilase, uma enzima dependente do citocromo P-450. Essa inibição resulta no incremento da síntese de compostos 14-alfa-metilsteróis, como o lanesterol. Esta substância tem capacidade de alterar a estrutura da membrana celular, destruindo o microrganismo por um mecanismo semelhante ao Itraconazol e Ketoconazol.

Um estudo comparativo, realizado na Alemanha, em 1996, avaliou a concentração inibitória mínima (CIM) necessária para inibir o crescimento de 22 cepas diferentes de *Malassezia furfur*. A faixa de CIM encontrada foi de 0,03 a 2,0 µg/mL (ver tabela comparativa). O quadro de comparação contendo quatro diferentes anticaspas mostrou que a CIM de Climbazol está muito abaixo daquela encontrada para a Piroctone Olamina e o dissulfeto de selênio. O composto mostrou ainda ser mais ativo do que o Piritionato de Zinco, para o qual se encontrou uma faixa de CIM consideravelmente maior. Em outros estudos demonstrou-se que a faixa de concentração inibitória mínima obtida para o novo anticaspas é semelhante àquela obtida para o Ketoconazol, 0,06 a 0,5 µg/mL e 0,06 a 0,12 µg/mL respectivamente. A vantagem da relação custo/benefício oferecida pelo fármaco é superior a qualquer outro agente anticaspas confrontado em laboratório.

Recentemente, o Institute Derma Consult GmbH em Bonn, Alemanha, demonstrou a vantagem do Climbazol, em compara-

ção ao Piroctone Olamina. Ambos os compostos foram veiculados na mesma base de shampoo na concentração de 0,7%. O painel comparativo mostrou que os valores iniciais da caspa não apresentaram diferença significativa. Entretanto, após duas a quatro semanas de aplicação, obtiveram-se valores significativamente mais baixos de caspa com o shampoo contendo Climbazol, quando comparado com aquele contendo Piroctone Olamina (vide gráfico 1).

A eficácia do Climbazol também foi avaliada rigorosamente em pesquisas que assemelharam as condições de aplicação à realidade do dia-a-dia. Duas concentrações de Climbazol, uma de 0,5% e outra de 1,5%, foram incorporadas à mesma base de shampoo utilizada para o placebo, e aplicadas 3 vezes por semana. Após 28 dias, os resultados mostraram uma importante redução nos valores da caspa contra os efeitos do placebo (vide gráfico 2).

As concentrações recomendadas de Climbazol variam de acordo com o tipo de anticaspas a ser formulado. Para produtos leave-on a concentração recomendada é de 0,1 a 0,5%, preferencialmente a 0,3%. Para produtos rinse-off, concentrações maiores são utilizadas, sendo recomendado de 0,5 a 2,0%. Neste caso, para se obter efetividade a um custo mais baixo, Climbazol permite uma faixa de ação efetiva entre 0,7 a 1,0% em produtos rinse-off. Esse anticaspas pode ser acrescentado em veículos, como shampoos, condicionadores, cremes, loções e tônicos.

Climbazol é um pó quase branco ou de cor cinza, com odor característico facilmente mascarado pelas essências cosméticas. Não é uma substância higroscópica. Climbazol é solúvel em algumas óleos essenciais, fenoxietanol (Phenova), álcool etílico e álcool benzílico. É pouco solúvel em cocoamidas e betaínas e insolúvel em água.

Climbazol pode ser adicionado em formulações preparadas a frio sem trazer transtornos para o manipulador. Uma pré-dissolução pode ser executada em um ou mais solventes e esta mistura acrescentada ao tensoativo. Igualmente, formulações preparadas a quente não oferecem problemas técnicos.

Climbazol pode ser facilmente dissolvido na fase contendo o surfactante, aquecida a 70°C. A mistura quente deve ser vertida lentamente na fase aquosa sob constante agitação.

Climbazol permite criar um produto final de qualidade transparente, sem formação de complexos coloridos quando em contato com íons metálicos. Uma sugestão para manipular produtos desse tipo é dissolver Climbazol em etanol e acrescentá-lo à fase detergente. O quaternário de amônio deve ser dissolvido em água, juntamente com o ácido cítrico, e a mistura incorporada à fase surfactante até obter a completa homogeneização da fórmula.

Climbazol possui elevado grau de compatibilidade com surfactantes, essências e outros ingredientes comumente utilizados nos produtos capilares. A combinação de extratos glicólicos, como o Hamamélis, pode ser criada na formulação, a fim de

reduzir a produção de sebo que serviria de substrato para o desenvolvimento da *Malassezia furfur*. O Mentol pode ser recomendado para aqueles que desejam ação refrescante simultânea. Climbazol possui excelente estabilidade na presença de luz e calor e é igualmente estável nas faixas de pH ácido e neutro. Estas propriedades tornam possível dispensar o Climbazol em embalagens transparentes, agregando ao produto final valores atrativos de um hair care clean.

Climbazol é o único anticaspa que reúne elevada eficácia de ação, com reduzido custo e propriedades farmacotécnicas vantajosas.

Tabela Comparativa

<i>Anticaspa</i>	<i>MIC*</i> ($\mu\text{g/L}$)
Climbazol	0,03 a 0,2
Piroctone Olamina	16 a 64
Sulfeto de Selênio	2 a 64
Piritionato de Zinco	0,12 a 8

*CIM: Concentração Inibitória Mínima