



A(ceite) - (a)Z(elaico)

Desde su papel ancestral en el tratamiento de la hiperpigmentación hasta su eficacia como agente despigmentante, bactericida y antiinflamatorio en el tratamiento del acné y la rosácea, el ácido azelaico en sinergia con otros ingredientes activos se ha convertido también en un elemento clave en productos para el crecimiento capilar. Aunque su obtención a partir de fuentes botánicas no es viable comercialmente, hoy en día se encuentra disponible un grado derivado naturalmente, con una pureza excepcionalmente alta, que garantiza su eficacia sin efectos colaterales.

POR AZECO COSMECEUTICALS

El ácido azelaico, un ácido dicarboxílico saturado con una cadena lineal de 9 carbonos,

está naturalmente presente en trigo, cebada y centeno, a menudo aislado de cultivos de *Pityrosporum*

Ovale. Aunque su mecanismo de acción completo aún no ha sido del todo elucidado, la literatura

científica ha identificado múltiples beneficios dérmicos asociados a este compuesto. Entre ellos, se destacan sus propiedades antiinflamatorias, antibacterianas y comedolíticas, además de su capacidad para inhibir competitivamente la enzima tirosinasa, implicada en la conversión de tirosina a melanina. Estas características permiten su aplicación en el tratamiento de diversas afecciones cutáneas, incluyendo el acné, la hiperpigmentación y la rosácea.

Demostrada su efectividad en el tratamiento de trastornos de hiperpigmentación como el cloasma y el melanoma lentigo maligno, gracias a su acción citotóxica sobre melanocitos malignos humanos, el ácido azelaico tiene, además, la capacidad para reducir la hiperqueratinización en la epidermis, lo que lo convierte en una opción prometedora para mejorar la apariencia de la piel dañada por el sol y otras afecciones relacionadas con la queratinización anormal.

En el contexto del acné, el ácido azelaico muestra eficacia al atacar los poros infectados, reduciendo la inflamación y la producción de queratina, lo que contribuye a prevenir la formación de nuevas

lesiones. Aunque inicialmente se utilizaba principalmente para tratar problemas relacionados con el acné, los doctores notaron efectos secundarios relacionados con el aclaramiento de la piel y en 1978 se demostró por primera vez mediante estudios *in vitro* la actividad inhibidora de la tirosinasa de ciertas fracciones de lípidos, principalmente para ácidos dicarboxílicos C9-C11. A partir de ahí, su aplicación se amplió a otras condiciones dérmicas debido a sus múltiples beneficios terapéuticos.

En el ámbito de la alopecia androgénica, por ejemplo, el ácido azelaico destaca como un potente inhibidor de la enzima 5- α -reductasa tipo 1, lo que lo convierte en un componente clave de combinaciones cosméticas {ácido azelaico + Sulfato de zinc + vitamina B6} destinadas a estimular el crecimiento capilar y diferentes de los tratamientos farmacéuticos que pueden contener o no esteroides, presentes en el mercado para tratar este tipo de enfermedades.

Hoy en día existe un acuerdo unánime con respecto a la eficacia del ácido azelaico y su ausencia de efectos no deseados.

De hecho, la seguridad y la ausencia de estos efectos secundarios adversos (incluidas las propiedades citotóxicas o propiedades CMR (Cancerígenos, mutágenos y reprotóxicos)) hacen de él un ingrediente cosmético y farmacéutico atractivo y ampliamente utilizado en todo el mundo. Su disponibilidad en diferentes grados de pureza, como el desarrollado por Azeco Cosmeceuticals (con alta pureza, micronizado, de origen vegetal y con aprobación de COSMOS/ Ecocert y Natrue), garantiza su versatilidad y eficacia en una variedad de formulaciones de productos de cuidado personal.

En la tabla 1 se muestra una breve descripción.

EL ÁCIDO AZELAICO EN PRODUCTOS COSMÉTICOS PARA PADECIMIENTOS DE LA PIEL

El papel del ácido azelaico en la formulación de productos cosméticos destinados al tratamiento de diversas afecciones cutáneas ha cobrado notable relevancia en los últimos años. Este compuesto, gracias a sus propiedades antibacterianas, ejerce efectos perjudiciales sobre organismos específicos como

TABLA 1

Beneficios/Claims	Aplicaciones
Tratamiento efectivo en piel grasa y con tendencia al acné.	Crema hidratantes, sueros, lociones, limpiadores y tónicos. Productos para el cuidado de la piel masculina
Proporciona un efecto aclarante progresivo para obtener un tono más uniforme.	Crema hidratantes, sueros, lociones, limpiadores y tónicos. Productos para el cuidado de la piel masculina
Disminuye la pigmentación de la piel e irregularidades de tono, como manchas de la edad, revelando una piel más suave, brillante y más uniforme.	Crema hidratantes, sueros, lociones, limpiadores y tónicos para reducir signos de envejecimiento. Productos aclarantes, exfoliantes para la piel. Productos de cuidado de la piel masculina (se incluye productos para después del afeitado).
Mejora la apariencia de la piel dañada por el sol con propiedades anti-edad.	Crema hidratantes, sueros, lociones, limpiadores y tónicos. Productos para el cuidado de la piel masculina.
Mejora el rendimiento de medicamentos de libre venta, cuasi medicamentos y productos recetados.	Tratamientos de acné, iluminadores y aclarantes de la piel, protectores solares. Productos para el cuidado de la piel masculina.



Propionibacterium acnes y *Staphylococcus epidermidis*, microorganismos residentes en las glándulas sebáceas dérmicas y responsables del desarrollo del *acne vulgaris*.

La capacidad del ácido azelaico para reducir la producción de queratina, esencial para el crecimiento de *P. acnes* al destruir la pared de las glándulas sebáceas para obtener los nutrientes requeridos, en particular las proteínas que serán hidrolizadas en sus correspondientes aminoácidos, lo posiciona, además, como un agente terapéutico prometedor en el tratamiento del acné y otras afecciones dermatológicas relacionadas.

Aunque existen diversos tratamientos disponibles para el acné, como el peróxido de benzoilo, ácido salicílico, antibióticos (doxiciclina, clindamicina), nicotinamida (vitamina B3), tratamientos queratolíticos y retinoides, el ácido azelaico emerge como una opción segura y efectiva, especialmente en aquellos casos en los que otros tratamientos presentan riesgos de reacciones alérgicas o irritación severa. En este sentido, la FDA advirtió recientemente: “La Administración de Alimentos y Medicamentos (FDA) advierte acerca

del uso de ciertos productos para el acné que contienen de ingrediente activo peróxido de benzoilo y ácido salicílico, los cuales pueden causar de manera ocasional pero potencial reacciones alérgicas serias o una irritación severa. Un ingrediente activo es el componente presente en medicinas responsables de la eficacia para el tratamiento de una condición o enfermedad”.

En la Unión Europea, el ácido azelaico es considerado un ingrediente cosmético seguro, sin restricciones de concentración, mientras que en Estados Unidos está aprobado por la FDA para el tratamiento del acné y la rosácea, lo que respalda su uso en una variedad de productos comerciales con concentraciones que oscilan entre el 10% y el 25%.

Los estudios han demostrado que el ácido azelaico no solo ejerce efectos antibacterianos significativos, sino que también normaliza el proceso de queratinización, lo que contribuye a su eficacia en el tratamiento del acné y otras afecciones de la piel.

Entrando en detalle, el efecto de un tratamiento tópico para el acné elaborado con ácido azelaico sobre el gradiente de pH

transmembranal (ΔpH) de *P. acnes* y *S. epidermidis* se estudió *in vitro* a valores de pH externos encontrados en la piel humana (pH 4-6). Los resultados de los estudios indicaron que la actividad antibacteriana se asocia con la perturbación del pH intracelular de los organismos. Los efectos de aplicación tópica de ácido azelaico a una concentración del 20% se estudiaron en 47 individuos (12 con piel normal, 15 con piel grasa y 20 con acné) y los resultados mostraron una disminución significativa de las lesiones en los pacientes con acné, pero sin cambios clínicos detectables en aquellos que tenían piel normal y grasa.

En estudios *in vitro* de células de queratinocitos presentaron efectos anti-proliferativos citostáticos dependientes del tiempo y de la dosis, con una inhibición del 50% a 20 mM. Los resultados indicaron propiedades anti-queratinizantes con efectos citostáticos antiproliferativos sobre los queratinocitos al modular las fases temprana y terminal de la diferenciación epidérmica.

Sin embargo, en el caso de la rosácea, una condición crónica que afecta principalmente a personas de ascendencia noroccidental, el ácido azelaico ha demostrado ser

efectivo en la reducción de lesiones inflamatorias y eritemas. Aunque las causas de su aparición son todavía desconocidas, se le asocian condiciones climáticas extremas (alta intensidad del sol, clima frío/caliente, viento, heladas), así como alteración del equilibrio de la flora intestinal como motivos de su surgimiento.

Su falta de tratamiento ha demostrado ser un indicativo de empeoramiento, pero su control o cuidado mediante antibióticos también ha resultado no recomendable. Es por eso que el ácido azelaico, que inhibe las especies reactivas de oxígeno (ERO) neutrofílicas, y está disponible al 20% en cremas o al 15% en hidrogel, es una alternativa válida para reducir lesiones inflamatorias y eritemas en pacientes con rosácea.

EL POTENCIAL DEL ÁCIDO AZELAICO COMO AGENTE ILUMINADOR O ACLARANTE DE LA PIEL

Desde su descubrimiento en 1978 como un inhibidor efectivo de la tirosinasa de ciertas fracciones lipídicas (principalmente ácidos dicarboxílicos C9-C11), lo cual fue demostrado por primera vez en estudios *in vitro*, el ácido azelaico ha emergido como un agente prometedor para el tratamiento de lesiones hiperpigmentadas. Este ácido dicarboxílico de cadena C9 ha sido objeto de un creciente interés debido a su capacidad para inhibir la activación mitocondrial oxidoreductasa y la síntesis de ADN, además de actuar como un inhibidor competitivo y reversible de la tirosinasa. Su efecto aclarante de la piel se manifiesta de manera

‘DESDE SU DESCUBRIMIENTO EN 1978, EL ÁCIDO AZELAICO HA EMERGIDO COMO UN AGENTE PROMETEDOR PARA EL TRATAMIENTO DE LESIONES HIPERPIGMENTADAS’

selectiva, con una mayor eficacia en melanocitos altamente pigmentados y efectos mínimos en la piel normalmente pigmentada.

La eficacia y la seguridad del ácido azelaico han sido objeto de un acuerdo unánime, convirtiéndolo en un agente aclarante natural y un efectivo iluminador de la piel. Numerosos estudios respaldan su capacidad para mejorar la apariencia de la piel pigmentada y para tratar afecciones dermatológicas como el melasma, la rosácea y el acné.

Por un lado, en un estudio clínico placebo realizado en 52 mujeres con piel pigmentada u oscura (fototipos IV a VI) que padecían melasma, se observaron resultados positivos con el uso de cremas que contenían un 20% de ácido azelaico. Estas mujeres experimentaron una notable suavización de la piel y manifestaron su satisfacción general con los resultados. Además, la actividad antiinflamatoria, antiqueratinizante y bacteriostática del ácido azelaico justifica su aplicación en el tratamiento de otras afecciones cutáneas, como la rosácea y el acné.

Por otro lado, en investigaciones realizadas en poblaciones asiáticas y caucásicas, se ha demostrado que el tratamiento con ácido azelaico conduce a una mejoría significativa en la pigmentación cutánea y una reducción en el tamaño de las áreas hiperpigmentadas. Este compuesto

ha mostrado ser eficaz en la resolución de lesiones cutáneas como el lentigo maligno facial, la queratosis solar y la hiperpigmentación asociada a quemaduras y herpes labial.

Además, se ha encontrado que el ácido azelaico es seguro para su uso a largo plazo y presenta una buena tolerancia cutánea, lo que lo convierte en una opción atractiva para el tratamiento continuado de la hiperpigmentación. Su capacidad para unificar el tono facial y mejorar la apariencia de la piel envejecida lo posiciona como un ingrediente valioso en la formulación de productos cosméticos destinados a la iluminación y el aclarado de la piel.

Dada la variedad de rutas terapéuticas disponibles para combatir la hiperpigmentación, es importante considerar la posibilidad de combinar diferentes activos iluminadores y aclarantes en una misma formulación cosmética. Esto fue demostrado en un estudio patrocinado por Pierre Fabre Dermocosmetique, basado en el uso de una combinación de ácido azelaico con oligopéptido-68 y ácido glicólico, donde se evaluó la eficacia de esta combinación de activos en un serum dermocosmético para la reducción del lentigo actínico y la mejora de signos de la fotoenvejecimiento. El objetivo de este estudio clínico fue monocéntrico y abierto fue evaluar la eficacia clínica e instrumental, y la tolerancia uso de un suero con el 2% de oligopéptido-68, 85% de ácido azelaico y 3% de ácido glicólico para pieles con signos de

fotoenvejecimiento durante 12 semanas. Esta asociación demostró eficacia de antiedad en explantes cutáneos, donde fueron incluidos voluntarios caucásicos (45-70 años) para su evaluación. Al inicio del estudio (D0), los sujetos presentaron arrugas periorbitarias graduales de 3 a 6 (en una escala del 1 al 9) y al menos un lentigo facial. El suero fue aplicado en cara y cuello dos veces al día (mañana y noche) y se realizaron evaluaciones clínicas e instrumentales de los signos del fotoenvejecimiento. Los lentigos localizados presentaron mejoras significativas después de 4, 8 y 12 semanas de aplicación del suero (una mejora de 42%). La evaluación AEVA demostró una mejora significativa de estructuras rugosas (arrugas profundas) después de 4 semanas ($p=0.008$).

Por estas razones, el ácido azelaico representa una opción segura, efectiva y versátil para el tratamiento de la hiperpigmentación y el aclaramiento de la piel. Su capacidad para abordar múltiples afecciones cutáneas, su buen perfil de tolerancia y su acción iluminadora lo convierten en un ingrediente destacado en la industria cosmética.

A continuación se resumen sus cualidades:

- En primer lugar, presenta una mayor seguridad que la mayoría de los productos alternativos disponibles.
- Su habilidad de aclarar la piel es gracias a su capacidad antiinflamatoria en el tratamiento de varias formas de acné. Es decir, que tiene dos ventajas en un mismo ingrediente activo.



- Es seguro para todo tipo de piel, especialmente en pieles de tonos más oscuros.
- Es efectivo en la iluminación de pieles envejecidas y apagadas mediante su efecto aclarante y la unificación del tono facial.
- A diferencia de las hidroquinonas, el ácido azelaico no afecta los pigmentos de la piel, sino que ataca a los melanocitos anormales (células de melanina pequeñas) que se tengan presentes.

EL PAPEL DEL ÁCIDO AZELAICO EN PRODUCTOS DE CRECIMIENTO CAPILAR

El ácido azelaico emerge también como un agente prometedor en la lucha contra la pérdida de cabello gracias a su capacidad para inhibir la enzima 5 α -reductasa, responsable de la conversión de la testosterona en 5 α -dihidrotestosterona, un factor determinante en la alopecia areata y la caída del cabello. Al reducir la presencia de 5 α -dihidrotestosterona, el ácido azelaico induce una regresión en el folículo piloso (fase

catágena), seguida de una fase de regeneración capilar (fase anágena), lo que lo convierte en un ingrediente de interés para los productos destinados al crecimiento capilar.

A pesar de su potencial, la investigación clínica sobre el ácido azelaico en este contexto ha sido limitada. El estudio pionero data del año 2005, cuando se evaluó la eficacia y seguridad del ácido azelaico en pacientes con alopecia y/o alopecia areata. Los resultados al usar ácido azelaico se compararon con los obtenidos mediante el uso de antralina, un fármaco prescrito para tratar la psoriasis y que también se emplea con frecuencia en el tratamiento de la alopecia areata. La conclusión fue que el rendimiento del ácido azelaico era comparable al de la antralina en el estímulo del crecimiento capilar.

Además de esto, se ha observado que las sales de zinc (Zn²⁺) también actúan como inhibidores de la 5 α -reductasa. La eficacia del sulfato de zinc se ha visto potenciada significativamente cuando se combina con piridoxina

hidrocloruro (Vitamina B6). Aunque la piridoxina hidrocloruro no mejora directamente la eficacia del ácido azelaico, la combinación de ácido azelaico, sulfato de zinc y vitamina B6 se revela como una poderosa opción en el tratamiento cosmético de la alopecia androgénica, en contraposición a los tratamientos farmacéuticos disponibles en el mercado, que pueden incluir esteroides.

No obstante, a pesar de la necesidad de más investigaciones clínicas para profundizar en su eficacia y seguridad, el ácido azelaico se ha posicionado como un candidato prometedor en la búsqueda de soluciones para el crecimiento capilar, ofreciendo una

alternativa potencialmente efectiva y segura para aquellos que luchan contra la pérdida de cabello.

CONCLUSIONES

El ácido azelaico puede definirse como un ingrediente “cosmecéutico”, ya que muestra propiedades cosméticas y farmacéuticas. Este activo presenta buen desempeño para el tratamiento de *acne vulgaris*, rosácea y melasma. Y mediante la inhibición enzimática actúa como aclarante y ayuda al crecimiento del cabello.

Asimismo, el ácido azelaico ha demostrado presentar un mejor perfil toxicológico comparado con los ingredientes activos utilizados en la industria farmacéutica para

el tratamiento de *acne vulgaris* o rosácea, ya que sus efectos secundarios son mínimos y pueden minimizarse de manera sencilla al utilizar AZEPUR®99, el producto comercial de pureza más alta dentro del mercado.

Y es que, AZEPUR® 99 es un ingrediente sustentable, 100% de origen vegetal y libre de aceite de palma, obtenido a través de un proceso sustentable proveniente de una fuente vegetal definida (aceite de girasol con alto contenido oleico), y la elección perfecta para obtener un alto rendimiento (con múltiples mecanismos de acción) y soluciones cosméticas sustentables para el cuidado de la piel y del cabello 🌿

BergaCare FG Gel

La nueva solución para espesar aceites

- + Apto para leave-on y rinse-off
- + Oleo geles transparentes
- + Procesable en frío
- + Comportamiento tixotrópico natural



www.solutions.berg-schmidt.com

Berg+Schmidt
Care Ingredients

Our knowledge. Your formulations.

**Distribuidor oficial
para España
y Portugal.**

OXI•MED
EXPRES

Follow us on:

