

TEHNIČKI LIST

Capsaicin

Naziv sirovine: Kapsaicin

INCI ime: Capsaicin

CAS: 404-86-4

Sinonimi: trans-8-Methyl-N-vanillyl-6-nonenamide; 8-Methyl-N-vanillyl-6-nonenamide; N-Vanillylnonanamide; Capsicin

Hemijska klasifikacija: Alkaloidni amid (vaniloid); fenolni derivat sa amidnom funkcionalnom grupom

Funkcionalna kategorija: Rubefacijens; lokalni iritans; sredstvo za stimulaciju mikrocirkulacije; aktivna komponenta za proizvode sa efektom zagrevanja

IUPAC naziv: (6E)-N-(4-hydroxy-3-methoxybenzyl)-8-methylnon-6-enamide

Opis: Capsaicin je bioaktivno jedinjenje prirodnog porekla izolovano iz plodova biljaka roda Capsicum, hemijski klasifikovano kao vaniloidni alkaloid sa izraženim farmakološkim dejstvom na periferne nervne završetke. Reč je o lipofilnoj, kristalnoj supstanci slabo rastvorljivoj u vodi, ali dobro rastvorljivoj u alkoholima, glikolima, estarskim i uljnim rastvaračima, što određuje način njegove formulacije u kozmetičkim sistemima. Zbog svoje hemijske strukture poseduje fenolnu i amidnu funkcionalnu grupu, koje su odgovorne za njegovu biološku aktivnost i specifičan senzorički profil. Mehanizam delovanja zasniva se na aktivaciji TRPV1 receptora (transient receptor potential vanilloid 1), koji su prisutni na senzornim neuronima kože. Vezivanjem za ove receptore capsaicin inicira osećaj toplote i peckanja, što dovodi do lokalne vazodilatacije i povećanja mikrocirkulacije. Produžena ili kontrolisana primena dovodi do funkcionalne desenzitizacije nervnih završetaka usled smanjenja nivoa supstance P, čime se postiže analgetski efekat. Ovaj mehanizam je osnova njegove primene u preparatima za masažu, proizvodima za sportsku regeneraciju, formulacijama za stimulaciju rasta kose i anticelulitnim proizvodima. U kozmetici se koristi u veoma niskim koncentracijama zbog izražene biološke aktivnosti. Njegova

TEHNIČKI LIST

primena zahteva pažljivo doziranje i pravilnu disperziju u masnoj ili glikolnoj fazi kako bi se obezbedila ujednačena raspodela i kontrolisan efekat zagrevanja. U formulacijama se često kombinuje sa umirujućim i hidratantnim komponentama kako bi se ublažio inicijalni iritativni potencijal. Stabilan je u širokom rasponu pH vrednosti, ali je osetljiv na oksidaciju pri produženom izlaganju svetlosti i vazduhu, zbog čega se preporučuje skladištenje u tamnim, hermetički zatvorenim ambalažama. Bezbednosni profil capsaicina u kozmetičkoj primeni zavisi od koncentracije i površine aplikacije. Pri pravilnoj upotrebi deluje kao funkcionalna aktivna komponenta sa jasno definisanim fiziološkim efektom, ali u višim dozama može izazvati intenzivnu iritaciju, eritem i osećaj pečenja. Ne preporučuje se za primenu na osetljivim regijama, poput područja oko očiju, niti na oštećenoj ili iritiranoj koži. Profesionalna formulacija i kontrola koncentracije ključni su za postizanje željenog efekta uz očuvanje bezbednosti krajnjeg korisnika.

Mehanizam delovanja: Mehanizam delovanja capsaicina zasniva se na njegovoj sposobnosti da selektivno aktivira TRPV1 receptor (Transient Receptor Potential Vanilloid 1), koji se nalazi na perifernim senzornim neuronima kože. Ovaj receptor je fiziološki odgovoran za percepciju toplote i bola izazvanog visokim temperaturama ili hemijskim nadražajima. Kada se capsaicin veže za TRPV1 receptor, dolazi do otvaranja jonskih kanala i naglog ulaska kalcijumovih i natrijumovih jona u nervnu ćeliju. To izaziva depolarizaciju neurona i generisanje nervnog impulsa koji se u centralnom nervnom sistemu registruje kao osećaj toplote, peckanja ili žarenja. Istovremeno dolazi do lokalnog oslobađanja neuropeptida, pre svega supstance P, što dovodi do vazodilatacije i povećane mikrocirkulacije u tretiranom području. Kod produžene ili ponavljane primene nastupa funkcionalna desenzitizacija. Kontinuirana stimulacija TRPV1 receptora dovodi do iscrpljivanja supstance P i smanjenja reaktivnosti nervnih završetaka. Kao rezultat toga, intenzitet percepcije bola se smanjuje, što objašnjava analgetski efekat capsaicina u preparatima za masažu i sportsku regeneraciju. U kozmetičkim formulacijama ovaj mehanizam se koristi za postizanje efekta zagrevanja, stimulacije lokalne cirkulacije i povećane prokrvljenosti kože, dok kontrolisana koncentracija omogućava da se iritativni potencijal drži u granicama bezbedne primene.

TEHNIČKI LIST

Benefiti:

- Podstiče lokalnu mikrocirkulaciju povećavajući dotok krvi u tretirano područje.
- Stvara kontrolisani efekat zagrevanja koji poboljšava subjektivni osećaj opuštenosti mišića.
- Doprinosi privremenom smanjenju osećaja bola kroz desenzitizaciju nervnih završetaka.
- Poboljšava penetraciju drugih aktivnih komponenti usled pojačane prokrvljenosti kože.
- Podržava anticelulitne formulacije stimulacijom lokalne cirkulacije.
- Može doprineti stimulaciji vlasišta i poboljšanju uslova za rast kose.
- Pojačava senzornu percepciju proizvoda stvarajući izražen termalni efekat.

Način upotrebe: Capsaicin se u kozmetičkim formulacijama koristi u veoma niskim koncentracijama i prethodno se rastvara u odgovarajućem lipofilnom ili glikolnom rastvaraču, kao što su etanol, propilen-glikol, dipropilen-glikol, izopropil-miristat ili biljna ulja. Direktno dodavanje praha u gotovu formulaciju nije preporučljivo jer može dovesti do neujednačene distribucije i lokalne iritacije. Aktivna supstanca se najčešće uvodi u masnu fazu emulzije ili se prethodno rastvara, a zatim dodaje pre homogenizacije, uz kontrolisano mešanje radi postizanja ravnomerne disperzije. U anticelulitnim kremama, gelovima i serumima koncentracije se obično kreću u rasponu od 0,01% do 0,1%, pri čemu se niže vrednosti koriste za blagi termalni efekat, a više za izraženiji stimulatívni efekat. U preparatima za masažu i sportsku regeneraciju primenjuju se koncentracije od približno 0,025% do 0,075%, uz kombinovanje sa emolijentima i umirujućim komponentama radi bolje podnošljivosti. U formulacijama za negu vlasišta i stimulaciju rasta kose tipične koncentracije su od 0,005% do 0,02%, jer je koža glave osetljivija i zahteva blaži pristup. U specijalizovanim proizvodima sa intenzivnim efektom zagrevanja koncentracija može dostići 0,1%, ali takve formulacije zahtevaju prethodnu procenu bezbednosti i testove tolerancije. Proizvodi sa capsaicinom namenjeni su isključivo za spoljašnju upotrebu; ne primenjuju se na

TEHNIČKI LIST

oštećenoj koži niti na osetljivim regijama, poput područja oko očiju. Pre redovne upotrebe preporučuje se test osetljivosti na maloj površini kože. Kontrola koncentracije i pravilna formulacija ključni su za postizanje efikasnog i bezbednog efekta.

Mere opreza pri radu i primeni capsaicina: Capsaicin je visoko biološki aktivna supstanca i zahteva pažljivo rukovanje tokom formulacije i primene. Zbog izraženog iritativnog potencijala ne sme doći u kontakt sa očima, sluzokožom niti osetljivim regijama, poput područja oko očiju. Direktni kontakt sa kožom u koncentrisanom obliku može izazvati intenzivno peckanje, crvenilo i osećaj žarenja. Tokom rada sa sirovinom preporučuje se upotreba zaštitnih rukavica, zaštitnih naočara i rad u dobro provetrenom prostoru. U slučaju prosipanja ili kontakta sa kožom, zahvaćeno mesto ne treba ispirati toplom vodom jer toplota pojačava senzaciju; preporučuje se upotreba ulja ili blagih surfaktanata radi uklanjanja ostataka, a zatim ispiranje mlakom vodom. Ne primenjivati na oštećenoj, iritiranoj ili inflamatornoj koži. Proizvodi sa capsaicinom namenjeni su isključivo za spoljašnju upotrebu. Nakon aplikacije potrebno je temeljno oprati ruke kako bi se sprečio nehotičan prenos na lice ili sluzokožu. Pre komercijalne upotrebe preporučuje se test osetljivosti na maloj površini kože. Formulacije moraju sadržati precizno kontrolisanu koncentraciju aktivne supstance kako bi se obezbedio željeni efekat zagrevanja bez prekomerne iritacije. Skladištiti u dobro zatvorenoj ambalaži, zaštićeno od svetlosti i izvora toplote.

Bezbednost primene: Cosmetic Ingredient Review (CIR) je 2007. godine objavio bezbednosnu procenu capsaicina i srodnih kapsaicinoida koji se koriste u kozmetičkim proizvodima. Panel je analizirao dostupne toksikološke podatke, uključujući akutnu i subhroničnu toksičnost, dermalnu iritaciju, senzibilizaciju, genotoksičnost i podatke o sistemske apsorpciji. Rezultati ispitivanja pokazali su da capsaicin ima nizak nivo sistemske toksičnosti pri dermalnoj primeni u kozmetičkim koncentracijama. Studije akutne toksičnosti ukazale su na visoke LD50 vrednosti kod eksperimentalnih modela, što potvrđuje nizak rizik od sistemskih efekata pri spoljašnjoj primeni. Genotoksična ispitivanja (in vitro i in vivo) nisu pokazala relevantan mutageni potencijal u koncentracijama koje se koriste u kozmetici. Primarni bezbednosni aspekt odnosi se na lokalnu iritaciju i senzornu reakciju. Dermalne studije pokazale su da capsaicin izaziva prolazni eritem, peckanje i osećaj toplote, koji su doza-zavisni. U testovima senzibilizacije nije utvrđen značajan alergijski potencijal pri niskim koncentracijama, ali je naglašena potreba za kontrolom nivoa upotrebe zbog iritativnog mehanizma

TEHNIČKI LIST

delovanja. CIR je zaključio da je capsaicin bezbedan za upotrebu u kozmetičkim proizvodima u koncentracijama koje ne izazivaju prekomernu iritaciju i kada je formulisan tako da ograničava intenzitet senzorne reakcije. U praksi se to odnosi na tipične koncentracije do približno 0,1% u proizvodima za negu kože, dok su niže koncentracije preporučene za osetljivije formulacije. Zaključak panela naglašava da je bezbednost capsaicina primarno uslovljena pravilnom formulacijom, kontrolom koncentracije i jasnim uputstvima za spoljašnju upotrebu.

Prirodan ili sintetički sastojak: Capsaicin je prirodno jedinjenje koje se primarno dobija ekstrakcijom iz plodova biljaka roda *Capsicum* (najčešće *Capsicum annuum* i *Capsicum frutescens*). U tom obliku predstavlja prirodni bioaktivni sastojak prisutan u paprikama i čili sortama. Pored prirodnog izvora, capsaicin se može dobiti i hemijskom sintezom, pri čemu se proizvodi molekul identične hemijske strukture i biološke aktivnosti. Sintetički oblik se često koristi kada je potrebna visoka čistoća, standardizovan kvalitet i precizna kontrola koncentracije aktivne supstance. Sa regulatornog i funkcionalnog aspekta, prirodni i sintetički capsaicin su hemijski identični, a razlika se odnosi isključivo na način dobijanja.

Testiranje na životinjama: U skladu sa važećom evropskom regulativom (Regulativa (EZ) br. 1223/2009 o kozmetičkim proizvodima), supstanca nije testirana na životinjama. Bezbednosna procena sirovine zasniva se na dostupnim toksikološkim podacima, naučnoj literaturi i validiranim alternativnim metodama ispitivanja (in vitro i in silico). In silico je termin koji se koristi za metode testiranja i procene koje se sprovode pomoću kompjuterskih modela i simulacija, a ne u laboratoriji na živim organizmima (in vivo) ili na ćelijskim kulturama (in vitro). Ova napomena potvrđuje usklađenost sa zabranom testiranja na životinjama i služi isključivo u informativne svrhe za dalju upotrebu sirovine u kozmetičkim formulacijama.

GMO: Nije GMO

Vegan: Ne sadrži komponente životinjskog porekla

Poreklo sirovine: Kina