

AKBA 30% BOSWELLIA

Tratamento da osteoartrite

Uso em atletas, nas dores e
inchaço no músculo
esquelético

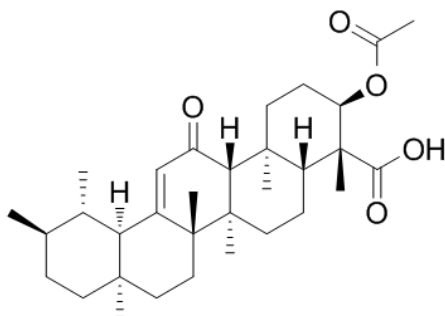
O ácido acetil-11-ceto-β-boswellico (**AKBA**) é um triterpeno pentacíclico de ocorrência **natural** isolado a partir da resina de goma da árvore *Boswellia serrata* (incenso). Amplamente utilizado na medicina ayurvédica indiana, este extrato exibe ações no sistema imunológico e promove o tratamento de doenças inflamatórias.

Agomelatina

Ácidos boswellicos têm sido extensivamente estudados para uma série de atividades: anti-inflamatórias, antitumorais, antimicrobianas e imunomoduladoras.

Nosso produto é padronizado em 30% de **AKBA**, substância responsável por inibir potencialmente a produção da enzima 5-lipoxigenase- fundamental no processo inflamatório- bloqueando a biossíntese de leucotrienos.

Como a formação de leucotrienos e a liberação de HLE (elastase de leucócitos humanos) estão aumentadas simultaneamente pela estimulação de neutrófilos em uma variedade de doenças humanas baseadas em inflamação e hipersensibilidade, o bloqueio relatado de duas enzimas pró-inflamatórias pelos ácidos boswellicos pode ser a razão para a atividade antiflogística do **ácido acetil-11-ceto-β-boswellico** e seus derivados.



Nome científico

Ácido acetil-11-ceto-β-boswellico

Sinônimos

AKBA; Salai guggal;

3-O-Acetyl-11-keto-beta-Boswellic Acid

Peso molecular

512.731 g/mol

Classe terapêutica

Inibição da enzima 5-lipoxigenase

Fórmula Molecular

C32H48O5

Indicações farmacológicas

- Tratamento da artrite e osteoartrite, doença articular degenerativa
- Efeitos antiinflamatórios na DII
- Uso em atletas, nas dores e inchaço no músculo esquelético
- Melhora da qualidade de vida dos pacientes com alterações crônicas das articulações

Posologia sugerida

100 mg por dia. A dose pode ser dividida em duas vezes ao dia. Duração do tratamento fica a critério médico.



MECANISMO DE AÇÃO

O **ácido acetil-11-ceto-beta-boswellic** age diretamente inibindo a enzima 5-lipoxigenase (5-lox) em um sítio seletivo para triterpenos pentacíclicos. 5-lox está envolvida com a síntese de mediadores inflamatórios, tais como leucotrienos, agentes ativos no processo inflamatório. **AKBA** atua como um agente anti-inflamatório não esteroide.

Inibe também TNF- α (Fatores de Necrose Tumoral Alfa), uma citocina pró-inflamatória presente na osteoartrite, responsável pela ativação de linfócitos, estimulação da liberação de enzimas proteolíticas pelos macrófagos e produção de outras citocinas inflamatórias como a IL-6 e IL-13.

AKBA previne significativamente a expressão de metaloproteinases de matriz e moléculas de adesão induzidas por TNF α (ICAM-1 e VCAM-1) e a expressão indutível dos mediadores da apoptose.

ESTUDOS CIENTÍFICOS

O ácido acetil-11-ceto- β -boswellico, um componente de um fitoterápico da resina *Boswellia serrata* (BS), atenua a ileíte experimental.

Este estudo examinou o efeito do extrato de *Boswellia* e seu ácido acetil-11-ceto- β -boswellico (**AKBA**) nas interações leucócito-células endoteliais em um modelo experimental de doença inflamatória intestinal (DII).

Ileíte foi induzida por duas injeções subcutâneas de indometacina (7,5 mg / kg) em ratos Sprague-Dawley com 24 h de intervalo. Os ratos também receberam tratamento oral de extrato de *Boswellia* (H15) ou AKBA em duas doses diferentes (baixa e alta) equivalentes a recomendações em doença humana ao longo de 2 dias.

Os controles receberam apenas os transportadores de NaHCO₃ (subcutaneamente) e tilose (por via oral).

O tratamento com **AKBA** resultou numa diminuição dependente da dose nos leucócitos rolantes (até 90%) e aderentes (até 98%). Tanto o extrato como as doses baixa e alta de AKBA atenuaram significativamente os escores de lesão tecidual.

A terapia oral com o extrato de *Boswellia* ou **AKBA** reduz significativamente as características inflamatórias macroscópicas e microcirculatórias normalmente associadas à administração de indometacina, indicando que as ações anti-inflamatórias do extrato de *Boswellia* na DII podem ser devidas em parte aos ácidos boswellicos como o AKBA.



ESTUDOS CIENTÍFICOS

Ensaio clínico aberto, randomizado e controlado do extrato de *Boswellia serrata* (BS) comparado ao valdecoxibe (inibidor seletivo da COX-2) na osteoartrite de joelho.

Em um estudo prospectivo, randomizado, aberto e comparativo, a eficácia, segurança e tolerabilidade da BSE foram comparadas com o valdecoxibe em 66 pacientes (com idade entre 40 e 70 anos de qualquer gênero) com osteoartrite (OA) de joelho por seis meses. Os pacientes foram avaliados pela escala WOMAC no início do estudo e, posteriormente, no intervalo mensal até 1 mês após a descontinuação do medicamento. Radiografias antero-posteriores da articulação do joelho afetada foram tomadas no início e após 6 meses.

Os pacientes foram aleatoriamente alocados pelo sistema SAS para Windows para dois grupos de 33 cada para receber ou *Boswellia serrata* extrato (BSE) (Cap Wokvel™, fabricado pela Pharmanza India) contendo 333 mg de BSE três vezes por dia (Grupo BSE) ou 10 mg de valdecoxibe (Tab Valdona, Cadila Pharmaceuticals Limited) uma vez ao dia (Grupo Valdecoxibe) por seis meses. Os medicamentos foram administrados por via oral e os pacientes foram aconselhados a tomá-los após as refeições. A cápsula de BSE continha o extrato padronizado de goma BS com um mínimo de 40% de ácidos boswellicos totais (BA). Os principais componentes da BA na BSE utilizados foram 11-ceto-beta BA - 6,44%, 3-O-acetil-beta BA-8,58%, alfa BA-6,93% e 3-O-acetil alfa BA-1,857%.

RESULTADOS

Os escores WOMAC basais para dor, rigidez e dificuldade na realização de atividades diárias foram comparados com os escores ao final de cada mês. No grupo BSE, a diferença nos escores do WOMAC não foi estatisticamente significativa no final do primeiro mês de intervenção quando comparado ao valor basal ($P > 0,05$). Porém, a partir do segundo mês, a diminuição foi altamente significativa ($P < 0,001$) em relação à linha de base e permaneceu assim durante toda a intervenção e até mesmo um mês após a parada do tratamento [Tabela - 1, abaixo].

Comparison of WOMAC scores in the two treatment groups at different time intervals

Time	Pain		Stiffness		Difficulty in performing daily activities	
	<i>Boswellia serrata</i> extract	Valdecoxib	<i>Boswellia serrata</i> extract	Valdecoxib	<i>Boswellia serrata</i> extract	Valdecoxib
Base-line	245.3±77.57	246.0±71.38	87.67±36.30	91.45±22.87	893.3±220.7	877.8±156.6
After 1 month	225.5±85.94*	140.2±74.12*	78.55±38.29*	47.76±27.79*	824.7±269.6*	434.2±271.8*
After 2 months	159.5±96.58*	152.2±193.4*	57.91±34.24*	39.55±23.18*	582.7±296.2	348.7±207.5*
After 3 months	128.6±84.56*	105.2±59.61*	47.48±31.05*	33.70±21.10*	483.6±274.7	330.5±205.3*
After 4 months	107.8±79.57*	101.9±71.04*	41.06±29.10*	34.58±24.15*	408.7±262.1	335.9±229.7*
After 5 months	88.3±65.36*	82.12±63.39*	33.73±23.58*	27.61±22.05*	348.7±219.7	269.6±212.3*
After 6 months	82.85±62.31*	85.42±68.85*	30.45±21.84*	29.18±24.14*	325.2±207.9	282.8±225.3*
After 7 months	81.67±63.29***	197.7±111.3	29.82±21.55***	81.15±41.49	322.6±207.8***	775.5±392.4

Repeated Measures ANOVA followed by Dunnett's multiple comparison test showed as * $P < 0.05$ and ** $P < 0.001$ when BSE compared to Valdecoxib in each symptom group. *** $P < 0.001$ when compared to base-line

ESTUDOS CIENTÍFICOS

Ensaio clínico aberto, randomizado e controlado do extrato de *Boswellia serrata* comparado ao valdecoxibe (inibidor seletivo da COX-2) na osteoartrite de joelho.

RESULTADOS

No grupo do valdecoxibe, a diminuição nos escores do WOMAC foi estatisticamente significativa no final de um mês de tratamento em comparação com o valor basal ($P < 0,001$) e persistiu enquanto o tratamento foi continuado. Os escores WOMAC com BSE foram significativamente menores ($P < 0,001$) do que com valdecoxibe no final de 7 meses para todos os três parâmetros.

No grupo tratado com BSE, os escores do WOMAC não mostraram nenhuma diminuição significativa após o primeiro mês de intervenção, mas a partir do segundo mês tornou-se significativamente menor em relação ao valor basal e continuaram a ser significativamente menores até um mês após a interrupção do tratamento. Isso indica que a BSE tem um início de ação mais lento e leva mais de um mês para a ação se manifestar. Ao mesmo tempo, seu efeito foi persistente mesmo após um mês de paralisação do tratamento. Esse é um achado valioso, já que a maioria das drogas atualmente usadas na OA pela medicina moderna fornece alívio sintomático de curta duração, como também observado por nós no grupo do valdecoxibe, onde o início da ação foi rápido, mas diminuiu rapidamente com a interrupção do tratamento.

Estudos relatam que o BSE preveniu a degradação da cartilagem articular, que poderia ser um dos mecanismos para impedir a progressão da OA.

Uma avaliação clínica randomizada de 32 semanas, controlada por placebo, de uma combinação poli-herbal contendo BSE na OA do joelho relatou que ela é significativamente melhor do que o placebo, sem quaisquer efeitos adversos significativos. Em nosso estudo, também não foram relatados efeitos colaterais graves com a BSE.

Os relatórios mostram que a BSE inibiu a elastase leucocitária humana, o que poderia ser útil em distúrbios autoimunes, como a artrite reumatóide. A resina de goma da BS mostrou bloquear a biossíntese de leucotrienos devido à ação dos constituintes da BA. Os BAs inibiram a síntese de lipoxigenase (LO) via 5-LOX, mas não afetaram as atividades de 12-LOX e ciclo-oxigenase (CO). BAs especificamente diminuiu a síntese de produtos pró-inflamatórios 5-LOX como o ácido 5-hidroxi-eicosatetraenóico e LT-B4.

Assim, em termos de segurança, eficácia e duração de ação, o presente estudo mostra que a BSE foi superior ao valdecoxibe, exceto pelo início de ação mais lento que o valdecoxibe.





POSOLOGIA SUGERIDA

100 mg por dia de **BOSWELLIAAKBA 30%**, podendo ser divididas em duas vezes ao dia. Manipular preferencialmente sob a forma de cápsulas. Duração do tratamento fica a critério médico.

EFEITOS COLATERAIS

Os eventos relatados foram cólicas abdominais, desconfortos estomacais, náuseas, azia e diarreia. Urticária e dermatite também podem ocorrer com o uso de **BOSWELLIAAKBA 30%**.

CONTRAINDICAÇÕES

BOSWELLIA AKBA 30% é contraindicado em grávidas, lactantes, crianças ou mulheres que planejam engravidar.

Raja, A.F. et al. **Acetyl-11-keto- β -boswellic acid (AKBA); targeting oral cavity pathogens.** *BMC Research Notes*. 2011, (4) 406. Disponível em:

<<https://bmresnotes.biomedcentral.com/articles/10.1186/1756-0500-4-406>>. Acesso em: 06 jun.2019.

Safayhi, H. et al. **Inhibition by Boswellic Acids of Human Leukocyte Elastase.** *Ammon Journal of Pharmacology and Experimental Therapeutics*. 1997, 281 (1) 460-463. Disponível em:

<<http://jpet.aspetjournals.org/content/281/1/460.short>>. Acesso em: 06 jun.2019.

Lalithakumari, K. et al. **Safety and Toxicological Evaluation of a Novel, Standardized 3-O-Acetyl-11-keto- β -Boswellic Acid (AKBA)-Enriched *Boswellia serrata* Extract (5-Loxin®).** *Toxicology Mechanisms and Methods*, 2006, 16 (4). Disponível em: <<https://www.tandfonline.com/doi/abs/10.1080/15376520600620232>>. Acesso em 06 jun.2019.

AKBA: PUBCHEM. Disponível em: <<https://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compound/Acetyl-11-keto-beta-boswellic-acid#section=Depositor-Provided-PubMed-Citations>>. Acesso em 07 jun.2019.


Krieglstein, C.F. et al. **Acetyl-11-keto- β -boswellic acid, a constituent of a herbal medicine from *Boswellia serrata* resin, attenuates experimental ileitis.** *International Journal of Colorectal Disease*. 2001, 16, (2), 88-95. Disponível em: <<https://link.springer.com/article/10.1007/s003840100292>>. Acesso em 07 jun.2019.

Sontakke S, et al. **Ensaio clínico aberto, randomizado, controlado do extrato *Boswellia serrata* em comparação com valdecoxib na osteoartrite do joelho.** *Indian J Pharmacol* 2007; 39: 27-9

Alcântara - Rua Yolanda Saad Abuzaid, 150, lojas 118/119. Telefone (21) 2601-1130

Centro / Zé Garoto - Rua Coronel Serrado, 1630, lojas 102/103. Telefone (21) 2605-1349

 vendas@farmacam.com.br

 whatsapp (21) 98493-7033

 Facebook.com.br/farmacam

 Instagram.com.br/farmacam