

## 抗炎症素材の代名詞：ボスウェリアセラータ樹脂

### ボスウェリア セラータとは？

インドの乾燥高地に自生する落葉樹で、約5000年もの歴史があるインドの伝承医学アユルヴェーダにおいて、関節炎・リウマチ・高脂血症などの治療に用いられてきた。インドの先住民は、ボスウェリアセラータの種子をスープとして食し、樹脂はミルクや柑橘ジュースなどと一緒につまみ、また古くから食用のガムベースとしても利用されてきた。

### ファイブ・ロキシン®とは？

ファイブ・ロキシン®は、ボスウェリアセラータの樹脂から抽出し、その樹脂に含まれる6種類のボスウェリア酸のうち、AKBA(3-O-アセチル-11-ケト-βボスウェリア酸)が炎症の元となる5-リポキシゲナーゼというアラキドン酸から合成される酵素に対し、最も高い阻害効果を示した。そのAKBAを指標成分として30.0%以上含有させることで、他のボスウェリアセラータ樹脂エキスよりも高い阻害効果と即効性に期待が持てる素材として、2006年から世界的に発売されている。

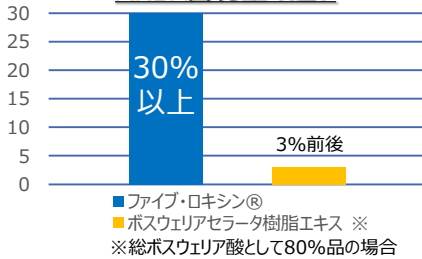
### 最優秀技術開発賞受賞

ライラ ニュートラ社は、インド政府科学技術省科学産業研究院よりファイブ・ロキシンの開発と商業化に対し、2007年に最優秀技術開発賞が贈られた。



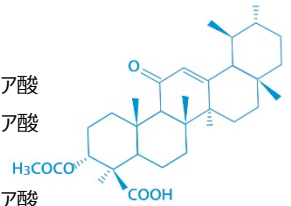
### 有効成分

#### AKBA含有量の違い



#### 6種類のボスウェリア酸

1. AKBA (※)
2. βボスウェリア酸
3. アセチル-βボスウェリア酸
4. 11-ケト-βボスウェリア酸
5. αボスウェリア酸
6. アセチル-αボスウェリア酸



※ 3-O-アセチル-11-ケト-βボスウェリア酸

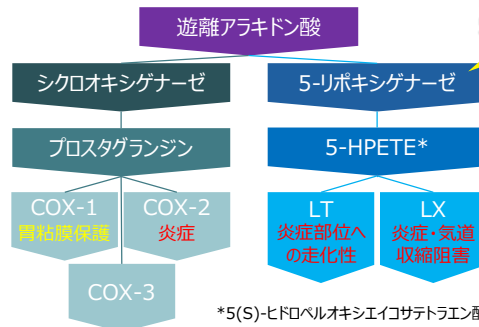
### ボスウェリアセラータ/ファイブ・ロキシン®の研究

- 1978：Pardhy氏らによる、ボスウェリア酸の解析。
- 1986：Singh氏らによる、抗炎症効果を目的とした動物実験の実施。
- 1995：Lohokare氏らによる、変形性関節患者を対象とした臨床試験の実施。
- 2005：Sashwati氏らによる、**ファイブ・ロキシン®**を用いた微小血管内皮細胞での抗炎症効果の確認。
- 2005：Lalithakumari氏らによる、**ファイブ・ロキシン®**を用いた安全性、毒性評価を実施。
- 2006：Sengupta氏らによる、**ファイブ・ロキシン®**を用いたヒト試験の実施。
- 2008：Sengupta氏らによる、**ファイブ・ロキシン®**も用いたヒト試験の実施。
- 2009：E/S/C/O/P Monograph 第2版追補に『Olibanum Indicum (Indian Frankincense；インディアン フランキンセンス)』として記載された。
- 2017：LGC社(ドーピング検査機関)において、**ファイブ・ロキシン®**(Lot N17040076)のカスタム分析を実施。10項目の禁止物質に関して分析不可。他項目非検出。



### ファイブ・ロキシン®の抗炎症作用メカニズム

炎症反応が起こると、ホスホリパーゼA<sub>2</sub>という酵素が活性化され、肥満細胞・血小板などの細胞膜からアラキドン酸が遊離する。



\*5(S)-ヒドロペルオキシエイコサテトラエン酸

\*マトリックスメタロプロテアーゼ3



安全性試験

- 急性経口毒性試験
- 90日間反復投与毒性試験
- 急性真皮毒性試験
- 本源的皮膚炎症
- 本源的眼球炎症
- Ames試験
- 小核試験
- 染色体異常試験

特許

- IN 205269
- AU 2242934CA

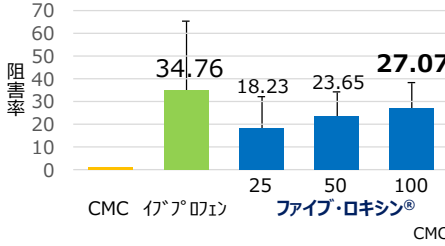
商標

- US 2886076
- US 3807044
- JP 5110722
- JP 5279777

動物試験

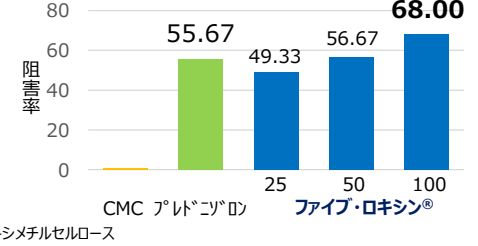
カラギーナン誘発ラット足浮腫

◆ ファイブ・ロキシ<sup>®</sup>を30日間25mg/kg, 50mg/kg, 100mg/kgをそれぞれ経口でラットに毎日投与。直接比較の為、コントロール群にはCMC、陽性対照群には50mg/kgのイブプロフェンを投与。投与後、最後の投与から1時間後に全てのラットに対し0.1mLの1%カラギーナン水溶液を左後脚の足底部に皮下注射。処置前と4時間後で足の容積(炎症度合)を比較。結果、ファイブ・ロキシ<sup>®</sup>100mg/kg群が炎症した足を27.07%阻害、イブプロフェンは34.76%の阻害を示した。



フロイド アジュバンド誘発関節炎

◆ ファイブ・ロキシ<sup>®</sup>を30日間25mg/kg, 50mg/kg, 100mg/kgをそれぞれ経口でラットに毎日投与。直接比較の為、コントロール群にはCMC、陽性対照群には10mg/kgのプレドニゾロンを投与。投与後、31日目に慢性リウマチを引き起こす、結核菌を加えた鉱物油・活性剤の混合液を皮下注射。処置前と処置後13日目を比較。結果、ファイブ・ロキシ<sup>®</sup>100mg/kg群が68.00%阻害、プレドニゾロンの55.67%を大きく上回った。

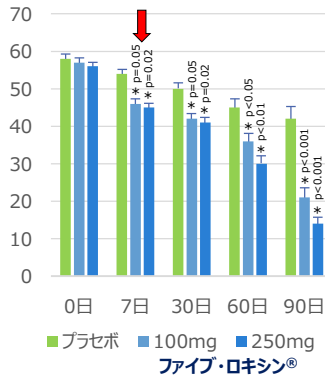


ヒト試験 1

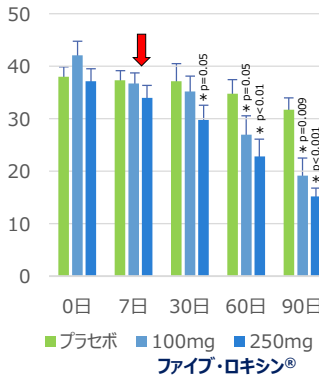
変形性膝関節症患者に対する二重盲検、無作為化、プラセボ比較による試験

被検者(数)	変形性膝関節症患者(75名)	治験期間	90日間
投与内容	プラセボ(25名)・ファイブ・ロキシ <sup>®</sup> 100mg/日(25名)・ファイブ・ロキシ <sup>®</sup> 250mg/日(25名)		
治験実施機関	ASRAM病院(インド)	治験登録番号	ISRCTN 05212803
検査項目	VAS, LFI, WOMAC, ヒザ滑液MMP3濃度, 血清(TNF-α, IL-1β)・血中検査, 尿検査		

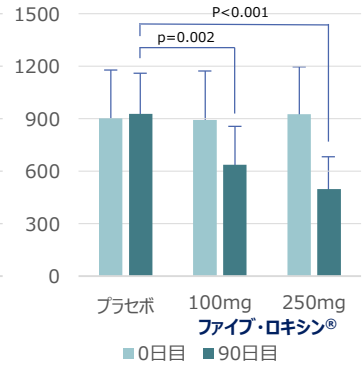
視覚的アナログ尺度(VAS)



疼痛値(WOMAC)



ヒザ滑液中MMP3濃度 (ng/ml)



国内総代理店

株式会社ティーエストレディング  
 〒104-0041  
 東京都中央区新富1-9-9  
 新富3Tビル 3F  
 TEL :03-3553-2201  
 FAX :03-3553-2202  
 MAIL :info@tsti.co.jp  
 URL :www.tsti.co.jp

取扱原料一覧	ファイブ ロキシ <sup>®</sup>	ファイブ ロキシ <sup>®</sup> WDP-20
性状・色	粉末・淡灰黄白色～淡褐色	粉末・単灰黄白色～淡褐色
原材料表示名	ボスウェリアセラータ(樹脂)抽出物	ボスウェリアセラータ(樹脂)抽出物、乳化剤、還元澱粉糖化物、アラビアガム
規格有効成分	AKBA 30.0%以上 (※ 3-O-アセチル-11-ケト-βボスウェリア酸)	AKBA 6.0%以上 (※ 3-O-アセチル-11-ケト-βボスウェリア酸)
使用部位	ボスウェリア セラータ樹脂	ボスウェリア セラータ樹脂
推奨摂取量(日)	100mg	500mg
賦型剤・添加物(加工助剤)	-	乳化剤、還元澱粉糖化物、アラビアガム
ヒト試験	2006(ヒト試験1), 2008(ヒト試験2)	-
荷姿	1Kg/10kg	5kg
賞味期限/保管方法	製造後3年間/ 直射日光を避け冷暗所保管	製造後3年間/ 直射日光を避け冷暗所保管
原料原産国/製造国	インド/インド(ライラ ニュートラ社)	最終加工: 日本(横浜油脂工業)