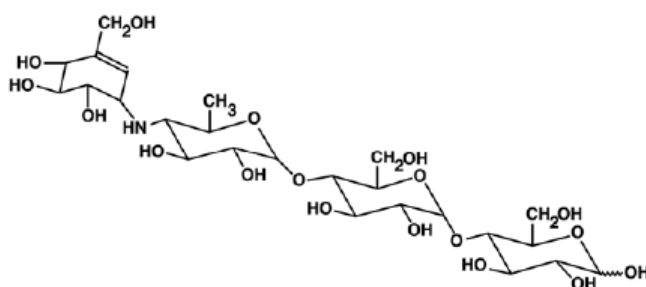


ACARBOSE

Hipoglicemiante



Acarbose

INCI NAME

4",6"-Dideoxy-4"-([1S]-[1,4,6/5]-4,5,6-trihydroxy-3-maltotriose

Uso Interno

INTRODUÇÃO

Conforme a Sociedade Brasileira de Endocrinologia e Metabologia (SBEM) a síndrome metabólica corresponde a um conjunto de doenças cuja base é a resistência insulínica. Pela dificuldade de ação da insulina, decorrem as manifestações que podem fazer parte da síndrome. Segundo os critérios brasileiros descritos por essa sociedade, a síndrome metabólica ocorre quando estão presentes três dos cinco critérios abaixo:

- Obesidade central
- Hipertensão Arterial
- Glicemia alterada
- Triglicerídeos
- HDL colesterol

A síndrome metabólica é caracterizada por dificuldade em captar glicose resultando em alto estresse oxidativo e inflamação vascular. Segundo a Sociedade Brasileira de Diabetes (SBD), estima-se que 73% dos diabéticos tipo 2 estão fora de controle, e não realizam dieta e exercícios, e dessa forma contribuem para o avanço da doença. Sendo assim, os hipoglicemiantes orais estão se tornando cada vez mais importantes. Estes agentes terapêuticos têm como alvo as fases iniciais da DM2. Dentre as diversas possibilidades de tratamentos

com anti-hipoglicemiantes orais, a Acarbose, um inibidor da enzima α -glicosidase, é capaz de reduzir a hiperglicemia pós-prandial e hiperinsulinemia além de evitar complicações inerentes a essa doença.

DESCRIÇÃO

Vantagens:

- Não causa hipoglicemia/hiperinsulinemia;
- Reduz a glicemia quando administrado como monoterapia ou em combinação;
- Diminui de forma confiável os níveis de hemoglobina glicada (HbA1c);
- Aumenta a sensibilidade à insulina;
- Ao contrário da insulina e das sulfonilureias como por exemplo a metformina, a **Acarbose** não tem sido associada com o ganho de peso corporal;
- Reduz risco de eventos cardiovasculares;
- Administração segura em cardiopatas;
- Segurança e eficácia comprovadas em estudos clínicos.

PROPRIEDADES

Os hipoglicemiantes orais são medicamentos que provocam uma diminuição da glicemia plasmática por diferentes mecanismos de ação dependendo de sua classe. Dessa forma, são largamente utilizados no manejo do Diabetes Mellitus Tipo 2. Permitem seu controle e evitam complicações inerentes a doença (Consenso Brasileiro Diabetes, 2002).

A Acarbose é capaz de inibir competitivamente as enzimas alfa-glicosidases. Atua no intestino, onde retarda a digestão e a absorção dos carboidratos ingeridos na dieta; dessa forma, ameniza o aumento da glicose sanguínea que se segue a alimentação. Inibe também a alfa-amilase pancreática, que é responsável pela hidrólise do amido para oligossacarídeos no lúmen do intestino delgado.

Este medicamento é considerado como um tratamento de primeira linha para pacientes recém-diagnosticados com DM2, ou seja, aqueles que têm altos níveis de glicose pós-prandial no sangue. Este ativo reduz a glicemia quando administrado como monoterapia ou em combinação com outros fármacos anti-diabéticos orais.

Além disso, a Acarbose também reduz de forma confiável os níveis de hemoglobina glicada (HbA1c) e aumenta a sensibilidade à insulina; A hemoglobina glicada (HbA1c), é um diagnóstico fundamental na identificação de altos níveis de glicemia durante períodos prolongados. Em pacientes com DM2, o risco de complicações está associado ao estado hiperglicêmico prévio. Portanto qualquer redução nos níveis da HbA1c

promove diminuição nos riscos de complicações microvasculares, de morte associada ao diabetes e de morte por qualquer outra causa (Stratton et al., 2000; Chiasson et al., 2003; Hanefeld et al., 2004).

ESTUDOS

1. Estudo clínico, prospectivo, controlado por placebo (Hanefeld et al., 2004).

Nesse estudo os pesquisadores demonstram que a **Acarbose** consegue prevenir a diabetes mellitus insulino não dependente, além disso, consegue retardar a progressão da espessura média interior (EMI) das artérias carótidas em indivíduos com intolerância à glicose.

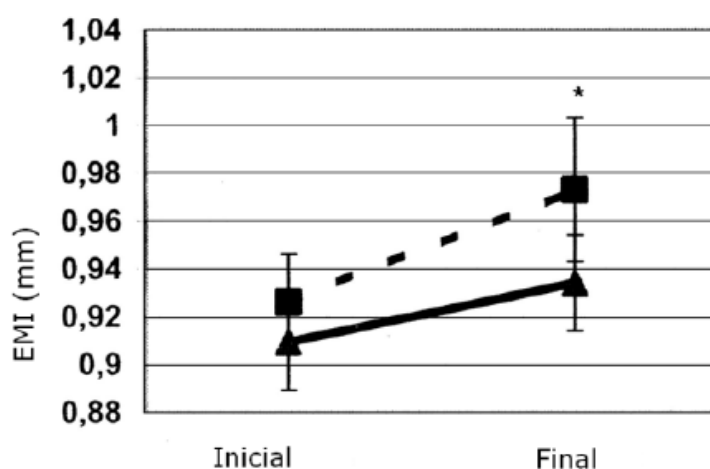


Figura 1: Espessura Média Interior (EMI) no início do estudo e no final do estudo no grupo **acarbose** (triângulo fechado) e grupo placebo (quadrado fechado) Média. * $P < 0,05$

Os autores concluíram que **Acarbose** retarda a progressão da EMI das artérias em indivíduos com intolerância à glicose, demonstrando um contrabalanço da hiperglicemia pós-prandial.

2. Estudo clínico, prospectivo, multicêntrico. (Saboo et al., 2015)

Foram incluídos 9.364 pacientes com idade ≥ 18 anos portadores de DM2 utilizando doses fixas de **Acarbose** e metformina. Os parâmetros glicêmicos foram medidos ao longo do estudo.

— FGB	— PPG
-------	-------

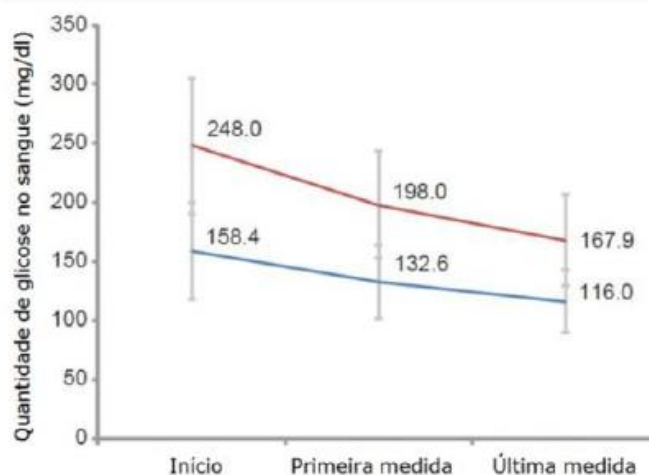


Figura 2: Os parâmetros glicêmicos médios de glicose pós-prandial (PPG), e controle de glicose no sangue em jejum (FBG), diminuíram durante o período de observação. A média FBG reduziu de 158,4 mg/dl para 116,0 mg/dl na última visita de acompanhamento. A média FBG reduziu significativamente para -42,4 mg / dl no final da última visita de acompanhamento em 13 semanas ($p < 0,0001$)

O estudo concluiu que a associação **Acarbose**/metformina foi eficaz, segura e bem aceita na prática clínica rotineira. Além disso, foi bem tolerado sem risco significativo de hipoglicemia e pode ser usado em tratamento precoce DM2.

INDICAÇÕES

- Hipoglicemiante oral para DM2;
- Hiperglicemia pós-prandial;
- Em casos de glicemia de jejum próximo aos valores aceitáveis, porém HbA1c aumentada;
- Diminuição da intolerância à glicose (IG):estágio pré-diabético e importante fator de risco para aterosclerose;
- Resistência à insulina;
- Obesidade.

Acarbose pode ser associado com outros hipoglicemiantes orais, fitoterápicos, nutracêuticos como o DM-II e suplementos.

CONCENTRAÇÃO RECOMENDADA

A dose inicial recomendada é de 25mg à 100mg diários, de 2 a 3 vezes por dia. Não exceder à 300mg.



REFERÊNCIAS BIBLIOGRÁFICAS

1. M. Hanefeld , M. Cagatay , T. Petrowitsch , D. Neuser , D. Petzinna , M. Rupp. Acarbose reduces the risk for myocardial infarction in type 2 diabetic patients: meta-analysis of seven long-term studies. *European Heart Journal* 25, 10–16. 2004.

2. Jean-Louis Chiasson, MD; Robert G. Josse, MBBS; Ramon Gomis, MD; Markolf Hanefeld, DSC; Avraham Karasik, MD; Markku Laakso, Acarbose Treatment and the Risk of Cardiovascular Disease and Hypertension in Patients With Impaired Glucose ToleranceThe STOP-NIDDM Trial. *JAMA.* ;290(4):486-494. 2003

3. Saboo, Banshi et al., behalf of GLOBE Investigators. “Effectiveness and Safety of Fixed Dose Combination of Acarbose/metformin in Indian Type 2 Diabetes Patients: Results from Observational GLOBE Study.” *Indian Journal of Endocrinology and Metabolism* 19.1 (2015): 129–135. *PMC.* Web. 10 Feb. 2015.

4. SBD: <http://www.diabetes.org.br/> < consultada em 11 de fevereiro de 2015>

Stratton IM, Adler AI, Neil HA, Matthews DR, Manley SE, Cull CA, et al. Association of glycaemia with macrovascular and microvascular complications of type 2 diabetes (UKPDS 35): prospective observational study. *BMJ*;321:405-12. 2000.

5. Consenso Brasileiro Sobre Diabetes – 2002
http://www.anad.org.br/institucional/hipoglicemiantes_orais.asp < consultada em 11 de fevereiro de 2015.

