HUPERZINE A

Nome científico: *Huperzia serrata.*
Sinonímia científica: N/A
Nome popular: Huperzine A (HUP A).
Família: Lycopodiaceae.
Parte Utilizada: Planta inteira (musgo).
Composição Química: 1% Huperzina A (alcalóide).
Formula molecular: N/A **Peso molecular:** N/A

CAS: N/A
DCB: N/A
DCI: N/A

Huperzine A (HUP A) é um alcalóide isolado da *Huperzia serrata*, um musgo aplicado há séculos pela medicina chinesa no tratamento da demência, febre e inflamação. HUP A é inibidor seletivo da acetilcolinesterase (AchE) – enzima que cataliza a hidrólise da acetilcolina, e tem sido tem sido considerado o mais favorável dentre os agentes anti-AChE usuais (fitostigmina, tacrine e donepezil) para tratar demência causada pela deficiência de acetilcolina, incluindo doença de Alzheimer, miastenia grave e deficiência da memória associada à idade.

Indicações e Ação Farmacológica

Huperzine A é indicado na Doença de Alzheimer (melhora sintomas, ação protetora neuronal); demência senil; e aumento da memória e aprendizado.

Huperzine A possui um perfil propício para melhorar os sintomas da doença de Alzheimer e o declínio da memória associado à idade. Livre dos efeitos colaterais severos dos anti-AChE mais prescritos, tem demonstrado capacidade inibitória reversível sobre a AchE tanto central quanto perifericamente sem influenciar a síntese ou liberação de acetilcolina. HUP A não possui afinidade significativa pelos receptores muscarínicos nem nicotínicos, através dos quais a acetilcolina modula os processos cognitivos e de desenvolvimento no sistema nervoso central (SNC).

Ele também é destituído de atividade pré e pós-sináptica. Estudos em roedores descobriram que o Huperzine A atravessa facilmente a barreira hematoencefálica e inibe a AChE no córtex frontal, hipocampo, hipotálamo e estriado mais efetivamente do que outras drogas conhecidas.

Um estudo in vitro envolvendo o tecido cerebral de ratos embriônicos demonstrou potencial neuroprotetor do Huperzine A sobre células neuronais expostas a níveis tóxicos de glutamato. Em concentrações normais, este neurotransmissor medeia grande parte da transmissão sináptica excitatória do cérebro de mamíferos. Contudo, sua presença em quantidades excessivas pode causar a morte celular excitotóxica. HUP A protegeu eficientemente as células nervosas dos efeitos nocivos do glutamato, bloqueando o influxo excessivo de cálcio induzido pela substância. A partir destes resultados, os autores do estudo especularam que a efetividade do HUP A no tratamento da demência pode resultar, em parte, da sua habilidade em atenuar a toxicidade mediada pelo glutamato.

Toxicidade/Contraindicações

Contraindicado para pacientes hipertensos, com doença hepática ou renal, com distúrbios convulsivos, arritmias cardíacas, asma, doença inflamatória intestinal, síndrome do intestino irritável e síndrome da má absorção. Crianças, gestantes e lactantes.

Dados disponíveis indicam que, quando administrado nas doses terapêuticas, os efeitos colaterais do Huperzine A são principalmente colinérgicos e tendem a ser suaves. Incluem náusea, vômito, diarreia, hiperatividade, vertigem e anorexia.

Dosagem e Modo de Usar

- Extrato padronizado (1%): 50 a 200 mcg de HUP A duas vezes ao dia. Huperzine A corresponde a um extrato da *Huperzia serrata* contendo aproximadamente 1% de HUP A. Portanto, será necessário fazer conversão com base no laudo do lote recebido.

Referências Bibliográficas

Pepping, A. et a., J Am J Health-Syst Pharm, 57: 530-534, 2000.

Yacov, A. et al. Molec Pharm, 45: 555-560, 1993.

Jianxim, S. et al. J Bio Chem, 278 (33): 30905-30911, 2003.

Pelayo, C. et al. Molec Pharmacol, 57: 409-417, 2000.

Dmitriy, F. and Jerrel, L. Y. Molec Pharmacol, 66: 658-666, 2004.

Jia, W. Y. et al. J Pharm Experm Therap, 288 (2): 814-819, 1999.

Jeffrey, L. C. Am J Phsychiatric, 157 (1): 4-15, 2000.

Goodman&Gilman, As Bases Farm. da Terap, 9a edição, 1996.