

RIVASTIGMINA

Nome científico: Rivastigmina Bitartarato

Sinonímia Científica: N/A

Formula molecular: $C_{14}H_{22}N_2O_2 \cdot C_4H_6O_6$

Família: N/A

Parte Utilizada: N/A

Composição Química: N/A

CAS: 129101-54-8 **DCB:** 09456

A rivastigmina bitartarato é um composto químico conhecido por ser um inibidor seletivo da colinesterase cerebral, utilizada principalmente para o tratamento de indivíduos que apresentam situações de demência leve a moderada grave do tipo Alzheimer, ou como também é conhecida, doença do Alzheimer. Além disso, o composto também é indicado para o tratamento de pessoas com a doença de Parkinson, o produto é de vigilância e é classificado como psicotrópico pela portaria nº 344, de 12 de maio de 1988 sendo considerado um medicamento controlado.

INDICAÇÕES E AÇÕES FARMACOLÓGICAS

Vendas

(19) 3429 1199
Estrada Vicente Bellini, 175

vendas@florien.com.br
www.florien.com.br

Rivastigmina como coadjuvante em distúrbios neurodegenerativos progressivo

A doença de Alzheimer (DA) é um distúrbio neurodegenerativo que ocorre progressivamente ao longo dos anos e é considerado como uma doença crônica, caracterizado por uma deteriorização global e não reversível do funcionamento completo do cérebro. Esse distúrbio implica na perda de memória e déficit motor e discursivo do indivíduo, dificultando sua habilidade de entendimento, processamento de informações e conversação com outras pessoas. No Brasil, a taxa de prevalência da doença encontrada na população com mais de 65 anos é de 7,1% sendo a DA responsável por mais de 55% dos casos. Dessa forma, verificando-se que mais da metade dessa população sofre com algum grau da doença, assim sendo necessário a utilização de medicamentos que auxiliem na diminuição da degradação de neurotransmissores, diminuindo o avanço progressivo da patologia. Os fármacos considerados de primeira escolha para esses tipos de casos são os inibidores da colinesterase, e dentre essa classe se encontra a rivastigmina, uma substância ativa que age aumentando a quantidade de acetilcolina no cérebro. Essa substância é necessária para que ocorra o bom funcionamento cognitivo, como por exemplo, o aprendizado, a memória, compreensão, orientação e a habilidade do paciente em lidar com situações cotidianas (ENGELBORGHS, et al. 1997).

Diversas alterações patológicas decorrentes na doença de Alzheimer, envolvem diversas vias neuronais colinérgicas que se projetam da base do cérebro até o córtex do hipocampo. Tais vias estão intrinsecamente envolvidas na atenção, memória e diversos outros processos cognitivos, demonstrando por estudo a possibilidade de que a rivastigmina facilita a neurotransmissão colinérgica pela diminuição da degradação da acetilcolina que é liberada por neurônios colinérgicos. Estudos com a substância ativa demonstraram que a rivastigmina aumenta seletivamente a disponibilidade de acetilcolina dentro do córtex e

Vendas

(19) 3429 1199
Estrada Vicente Bellini, 175

vendas@florien.com.br
www.florien.com.br

hipocampo, dessa forma, apresentando benefício nos déficits cognitivos que são mediados pelo sistema colinérgico, o qual é associado a DA e doença de Parkinson. Há também evidências de que a inibição de AChE poderia diminuir a formação de fragmentos proteicos de amiloidogênica que é precursora da beta-amilóide (APP) e placas amilóides, que são as principais características patogênicas encontrada na doença do Alzheimer. Para verificar a eficácia de um inibidor da colinesterase centralmente ativo como a rivastigmina em pacientes com DA, o composto foi avaliado em um estudo de 12 meses controlado por placebo. O objetivo principal foi investigar se havia alguma evidência para os benefícios da rivastigmina em pacientes com esse tipo de doença degenerativa grave. Os pacientes em teste foram comparados e pareados com grupos controles. No estudo, 24 pacientes com DA moderada avançada receberam rivastigmina por 12 meses, enquanto outros 20 pacientes receberam placebo. As doses médias diárias de rivastigmina no grupo de doses mais altas aos 3, 6, 9 e 12 meses foram $6,1 \pm 1,0$; $8,3 \pm 1,2$; $8,9 \pm 1,3$ e $10,7 \pm 1,6$ mg / dia, respectivamente. As habilidades cognitivas dos voluntários foram avaliadas usando uma subescala cognitiva de 11 itens da Alzheimer Disease Assessment Scale (ADAS-cog). Os resultados demonstraram que 45% dos pacientes tratados com placebo diminuiriam em pelo menos 4 pontos no ADAS-cog. Por outro lado, apenas 18,3% dos pacientes tratados com rivastigmina diminuiriam em 4 ou mais pontos. As deficiências funcionais, avaliadas usando a Escala de Avaliação de Incapacidade para Demência, permaneceram significativamente superiores em pacientes tratados com rivastigmina em comparação com pacientes tratados com placebo. Os pacientes se beneficiaram do tratamento com altas doses de rivastigmina em todas as medidas de desfecho, incluindo em um Mini Exame que avaliava o Estado Mental, a Escala de Deterioração Progressiva e a Escala Global de Deterioração. Os pacientes que receberam rivastigmina por 12 meses melhoraram significativamente em comparação com os pacientes tratados com placebo. Em 52 semanas, os pacientes tratados originalmente com 6 a 12 mg / dia de rivastigmina apresentaram uma melhora

Vendas

(19) 3429 1199
Estrada Vicente Bellini, 175

vendas@florien.com.br
www.florien.com.br

significativamente maior da função cognitiva do que os pacientes originalmente tratados com placebo. Dessa forma, o uso a longo prazo com rivastigmina pareceu ser bem tolerado em pacientes com DA moderada avançada, beneficiando-se significativamente dos sintomas cognitivos e funcionais da DA (KAMARAN, et al. 2004).

DOSAGEM E MODO DE USAR

A dosagem máxima recomendada para a rivastigmina é de 1,5 a 6 mg, duas vezes ao dia.

CONTRAINDICAÇÕES

Alguns sintomas adversos mais comum apresentados por quem faz uso do composto são náuseas e vômitos. Outras reações como agitação, tontura, sudorese, fadiga e perda de peso também são relativamente descritas. A rivastigmina bitartrato é contraindicada para pacientes que apresentam patologias hepáticas graves, crianças, gestantes e lactantes.

REFERÊNCIAS

Engelborghs S, Deyn PP: The neurochemistry of Alzheimer's disease. Acta Neurol Belg 1997; 97:67–84.

KARAMAN, Y, et al. A 12-Month Study of the Efficacy of Rivastigmine in patients with Advanced Moderate Alzheimer's Disease. Dement Geriatr Cogn Disord. 2005; 19:51-56.

Selkoe DJ: The molecular pathology of Alzheimer's disease. Neuron 1991; 6:487 – 498.

Sands LP, Katz I, Schneider L: Assessing individual patients for cognitive benefits from acetylcholinesterase inhibitors. Alzheimer Dis Assoc Disord 1999; 13:26–34.

Vendas

(19) 3429 1199
Estrada Vicente Bellini, 175

vendas@florien.com.br
www.florien.com.br

Taylor P: Development of acetylcholinesterase inhibitors in the therapy of Alzheimer's disease. *Neurology* 1998; 51 (suppl 1): S30–S35.

FARLOW, M.; ANAND, R.; MESSINA, J. A.; HARTMAN, R.; VEACH, J. A 52-week study of the efficacy of rivastigmine in patients with mild to moderately severe Alzheimer's disease. *Eur Neurol* 2001; 46:110.

Spencer CM, Noble S; Rivastigmine. *Drug Aging* 1998; 13: 391–411.

Vendas

(19) 3429 1199
Estrada Vicente Bellini, 175

vendas@florien.com.br
www.florien.com.br