

# INIBIDORES DE ACETILCOLINESTERASE

Estima-se que em 2050, 19 milhões de pessoas estejam com idade igual ou superior a 65 anos, somente nos países mais desenvolvidos. Ao menos 50% delas desenvolverão alguma forma de Doença de Alzheimer.



Fonte: www.sxc.hu

Pesquisa de  
alvos potenciais



Pesquisa pré-clínica

Pesquisa clínica

Registro

Mercado

► Fármaco

## Descrição

Derivados semi-sintéticos de extratos vegetais que atuam como inibidores da enzima Acetilcolinesterase (AChE). Podem ser utilizados no tratamento de neuropatias degenerativas, como Doença de Alzheimer e Parkinson, bem como outras desordens relativas à transmissão colinérgica como *Miastenia gravis*, paralisias musculares causadas por agentes químicos, intoxicação por escopolamina e outras patologias associadas à perda de memória.

## Problema

A Doença de Alzheimer (DA) é uma patologia de alto impacto sócio-econômico correspondendo por 1,70% das mortes em países desenvolvidos. Estima-se que 24,3 mi de pessoas sejam afetadas e que 4,6 mi de novos casos surjam a cada ano. (WHO, 2005). Em países desenvolvidos, a DA é 5ª maior causa de morte, o que corresponde a 168 mil pessoas / ano. (WHO, 2010) Nos EUA, 10,9 mi pessoas são cuidadores não-remunerados. Esses cuidadores são, em sua maioria, familiares próximos ao paciente, o que causa grande impacto emocional e financeiro às famílias à medida que a doença progride, levando ao óbito. Do aparecimento dos primeiros sintomas ao óbito, a progressão da doença é de 8,5 a 11 anos, sendo em média de 4 a 6 anos de vida. (Alzheimer's Assoc., 2010) Os custos estimados com tratamento de DA no mundo estão em US\$ 315bi (Pfizer®, Inc., 2009).

## Solução proposta

Inibir a enzima AChE para aumentar a atividade colinérgica do Sistema Nervoso Central, controlando os sintomas da Doença de Alzheimer nas áreas de memória e aprendizado. Através deste mecanismo também é possível controlar paralisias musculares causadas por agentes químicos ou biológicos, *Miastenia gravis* e envenenamento por escopolamina.

## Benefícios

A espécie vegetal em questão é endêmica da Mata Atlântica, e os compostos extraídos podem ter rendimento de 4% no extrato alcoólico. Os compostos foram capazes de inibir completamente (100%) a enzima AChE, em ensaios *in vivo*, em comparação com o inibidor reversível Galantamina. Também foram capazes de reverter a amnésia induzida experimentalmente por escopolamina em comparação com tacrina e galantamina. Os compostos não apresentam os efeitos tóxicos relatados para os dois fármacos comerciais utilizados nos testes pré-clínicos.

## Potencial de mercado

Em 2009, dois dos principais fármacos para o tratamento de DA, a rivastigmina e o donepezil, ambos inibidores de AChE, venderam US\$ 954mi e US\$ 432mi, respectivamente. A demanda por novos fármacos é alta visto que grandes multinacionais do ramo mantêm linhas de P&D para DA. O Programa de Medicamentos Excepcionais do Governo Federal e de alguns Governos Estaduais custeia medicamentos de patologias como a DA. O orçamento cresceu 345% de 2004 – 2008, movimentando R\$ 2,3bi no último ano.

## Contato

Agência UNESP de Inovação

E-mail : [auin@unesp.br](mailto:auin@unesp.br)

Site: [www.unesp.br/auin](http://www.unesp.br/auin)

Telefone: +55 (11) 3393-7901 / 7903 / 7904

