

DROGAS ALCALOÍDICAS

CLASSIFICAÇÃO FARMACOLÓGICA

DROGAS OU PRINCÍPIOS ATIVOS QUE ATUAM NO SNC

ANALGÉSICOS E NARCÓTICOS

- ÓPIO

ANESTÉSICOS LOCAIS E ESTIMULANTES

- COCAÍNA, CAFEÍNA
- TEOFILINA

DROGAS OU PRINCÍPIOS ATIVOS QUE ATUAM NO SNA PARASSIMPÁTICO

- COLINÉRGICO

PILOCARPINA

- ANTICOLINÉRGICO

ALCALÓIDES TROPÂNICOS

ATROPINA, ESCOPOLAMINA

DROGAS OU PRINCÍPIOS ATIVOS QUE ATUAM NO SNA SIMPÁTICO

- ADRENÉRGICO

EFEDRINA

- ANTIADRENÉRGICO

ALCALÓIDES DO ESPORÃO DE CENTEIO
RESERPINA

DROGAS OU PRINCÍPIOS ATIVOS COM EFEITOS DIVERSOS

- TRATO GASTROINTESTINAL

EMETINA

BOLDINA

- CORAÇÃO

QUINIDINA

- ANTI-INFLAMATÓRIO

COLCHICINA

- ANTIMALÁRICO

QUININA

- ANTINEOPLÁSICO

VINCRISTINA

VIMBLASTINA

TAXOL

DROGAS OU PRINCÍPIOS ATIVOS QUE ATUAM NO SNC

- ANALGÉSICOS E NARCÓTICOS

- ÓPIO

- ANESTÉSICOS LOCAIS E ESTIMULANTES

- COCAÍNA

- CAFEÍNA

- TEOFILINA

ÓPIO

Papaver somniferum L.



elfriede marianne bacchi FCF-USP

ÓPIO

Papaver somniferum L.

FAMÍLIA ☒ Papaveraceae

CULTIVO ☒ Índia, Turquia, China

VEGETAL ☒ arbusto de 1 a 1,5m de altura

PARTE USADA: látex seco obtido das cápsulas imaturas

Papaver somniferum L.

PRINCÍPIOS ATIVOS

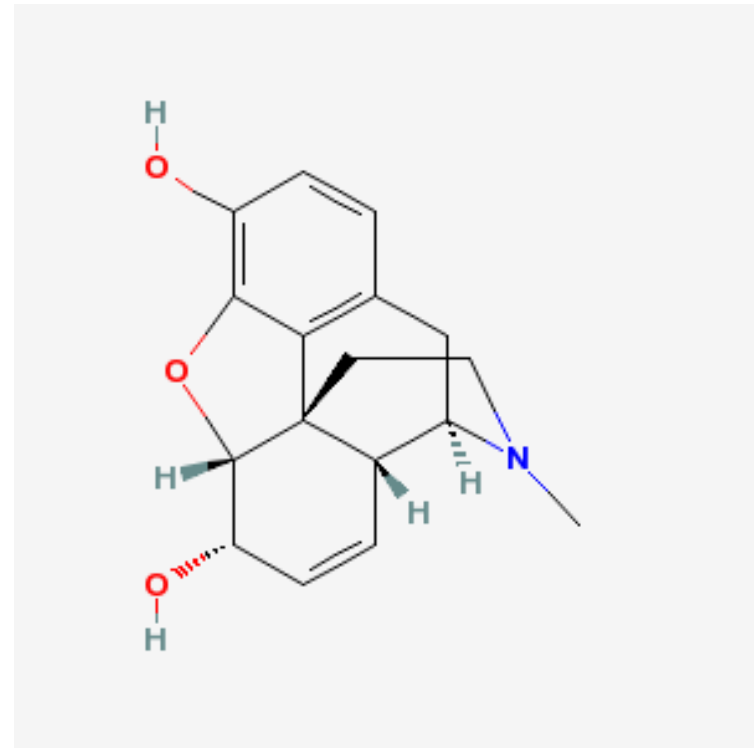
aproximadamente 40 alcalóides

MORFINANO

BENZILISOQUINOLINA

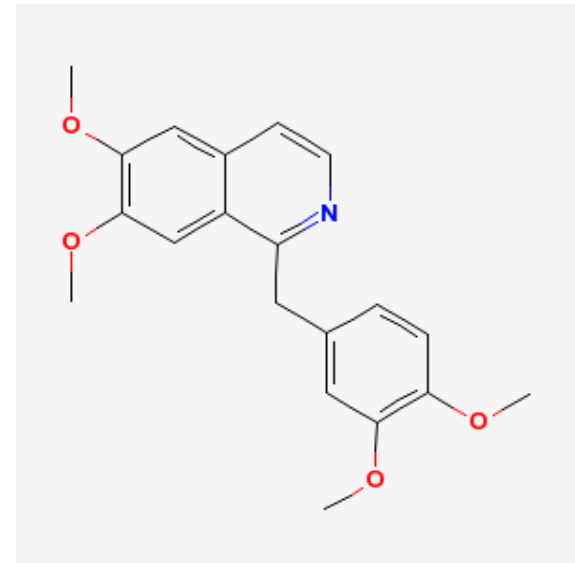
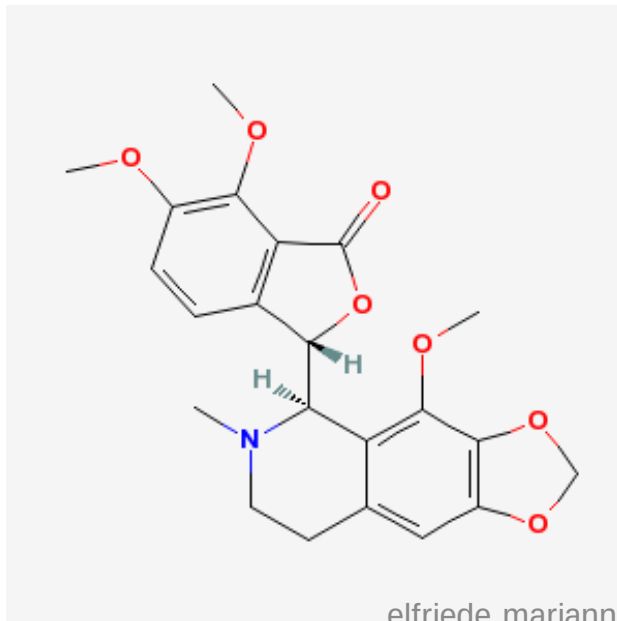
Papaver somniferum L.

- Morfina [1](#)
- Codeína [1](#) [2](#)
- tebaína



Papaver somniferum L.

- Papaverina [1](#)
- Noscapina



Papaver somniferum L.

- MORFINA
- Isolada por Sertürner, em 1806
- Analgésico narcótico
- Deprime:
 - centro respiratório
 - Centro da tosse
 - Peristaltismo intestinal

Papaver somniferum L.

- CODEÍNA
 - Deprime o centro da tosse
 - Dependência física < que morfina
- PAPAVERINA
 - Antiespasmódico, por ação direta na musculatura lisa
 - Sem ação analgésica

COCA

Erythroxylon coca Lamarck

- FAMÍLIA ☒ Erythroxylaceae
- Vegetal ☒ arbusto de 2m de altura
- Cultivo ☒ Peru e Bolívia
- Parte usada ☒ folhas (coletadas 3x ao ano)
- Princípios ativos ☒ 0,2 a 0,8% de alcalóides

COCA

Erythroxylon coca Lamarck

A planta divina dos Incas

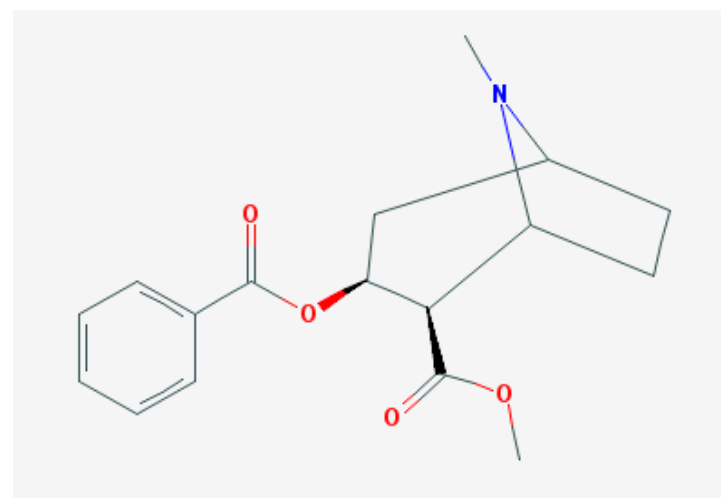


elfriede marianne bacchi FCF-USP



Erythroxylon coca Lamarck

- Cocaína
 ☒ isolada em 1860
- 1884 ☒ anestésica local



COCAÍNA

- ATIVIDADE FARMACOLÓGICA (0,06-0,1g)
- Bloqueia a recaptura de catecolaminas (NE) e 5-HT
 - ⊗ euforia, vasoconstrição, taquicardia, midríase
- Bloqueia condução nervosa
 - ⊗ anestésico local (interfere nos canais de Na^+)

COCAÍNA

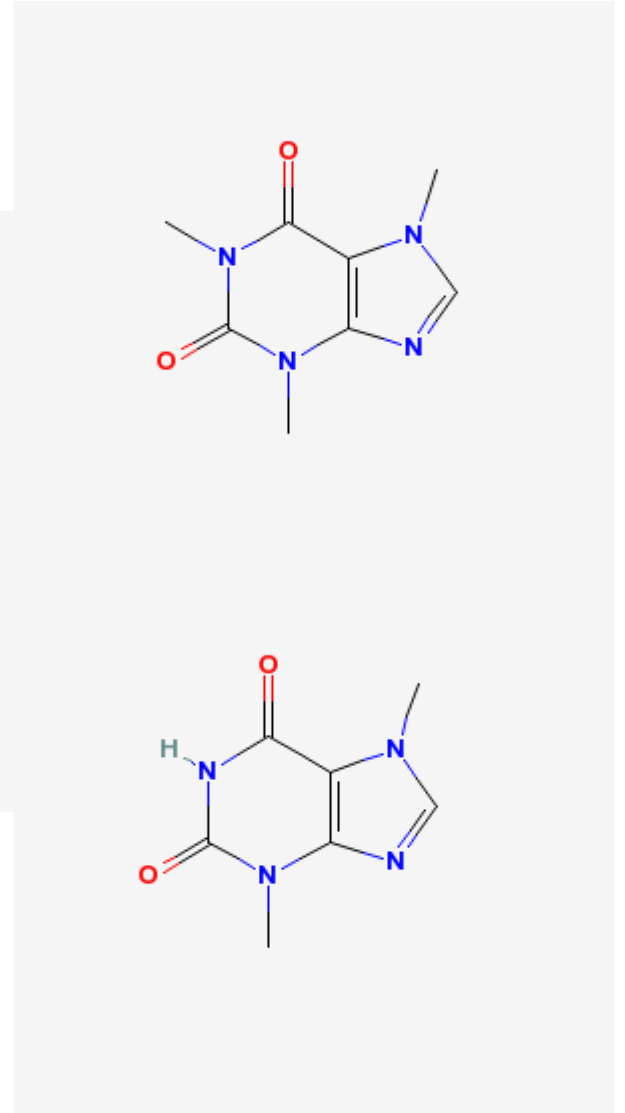
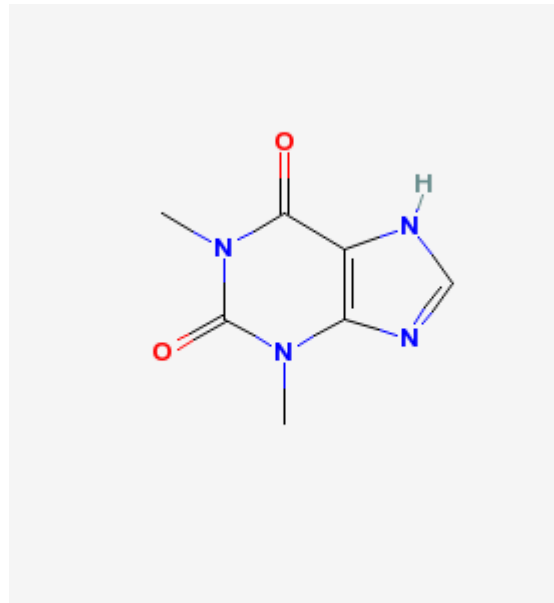
- DOSES TÓXICAS
- Convulsão
- Perda de consciência
- Alucinações

METILXANTINAS

- Cafeína

- Teofilina

- Teobromina



Coffea arabica L.

- Parte usada ☒ semente
- Família ☒ Rubiaceae



Photo Henriette Kress
<http://www.henriettesherbal.com>

elfriede marianne bacchi FCF-USP

Camellia sinensis (L.) O. Kuntze

- Família ☒ Theaceae
- Parte usada ☒ folha



Tea Bush

www.eatingchina.com / Copyright © 2005 Stephen Jack

Ilex paraguariensis St.Hilaire

- Família
Aquifoliaceae
- Parte usada
folha



Ilex paraguariensis St.Hilaire

- Família
Aquifoliaceae
- Parte usada
folha



elfriede marianne bacchi FCF-USP

Paullinia *cupana* Kunth.

- Família
Sapindaceae
- Parte usada
semente



Cola nitida (Vent.) Schott et Endl.

- Família
Sterculiaceae
- Parte usada
semente



Theobroma cacao L.

- Família
Sterculiaceae
- Parte usada
semente



METILXANTINAS

DROGA	CAFEÍNA %	TEOFILINA%	TEOBROMINA%	OUTROS %
Café	0,3-2,5	vestígios	Vestígios	Ácido clorogênico 3,0-5,0%
Chá preto	2,5-5,0	0,02-0,04	0,05	Taninos 10,0- 25,0
Cacau	0,2-0,3	Vestígios	1,0-2,0	Taninos 5,0
Noz de cola	0,6-3,0		0,1	Taninos 2,0- 4,0
Mate	0,5-1,5	0,05	0,45	Ácido clorogênico Taninos 12,0
Guaraná	2,5-5,0			Taninos 25,0

DROGAS OU PRINCÍPIOS ATIVOS QUE ATUAM NO SNA PARASSIMPÁTICO

- ANTICOLINÉRGICO

ALCALÓIDES TROPÂNICOS

ATROPINA, ESCOPOLAMINA

- COLINÉRGICO

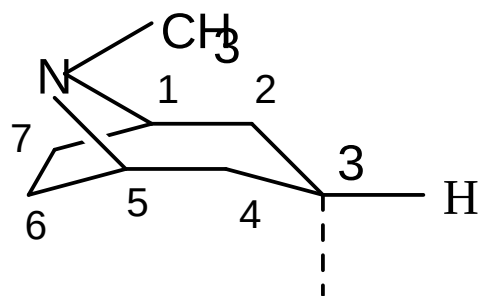
PILOCARPINA

ALCALÓIDES

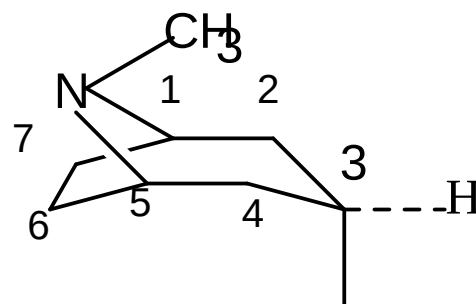
TROPÂNICOS

ANTICOLINÉRGICOS

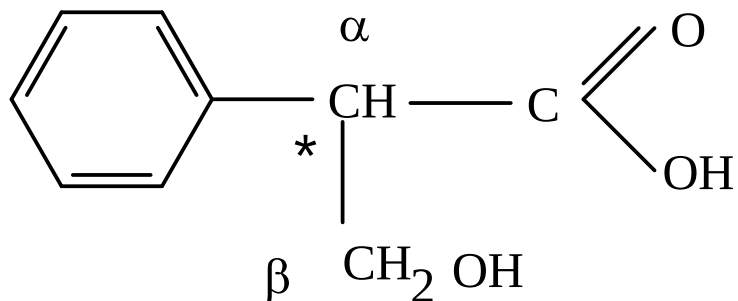
ALCALÓIDES TROPÂNICOS



tropan-3- α -ol OH

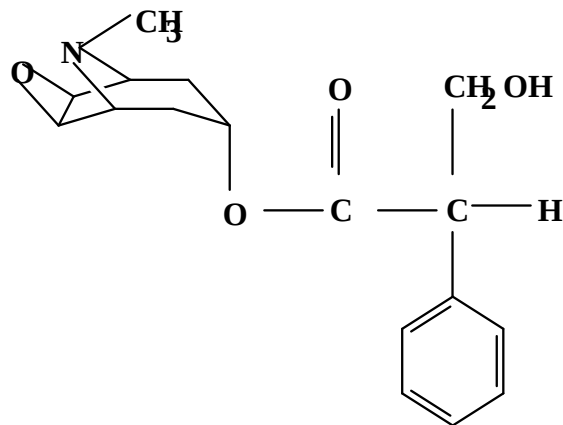


tropan-3- β -ol OH



ácido trópico
(ácido α -fenil- β -hidroxipropiônico)

ALCALÓIDES TROPÂNICOS

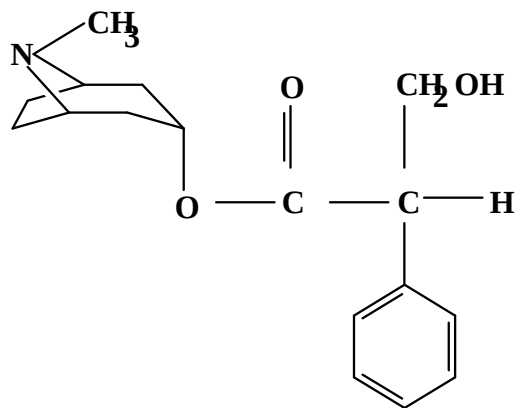


L-escopolamina = hioscina

racemização

DL -escopolamina=atrocina

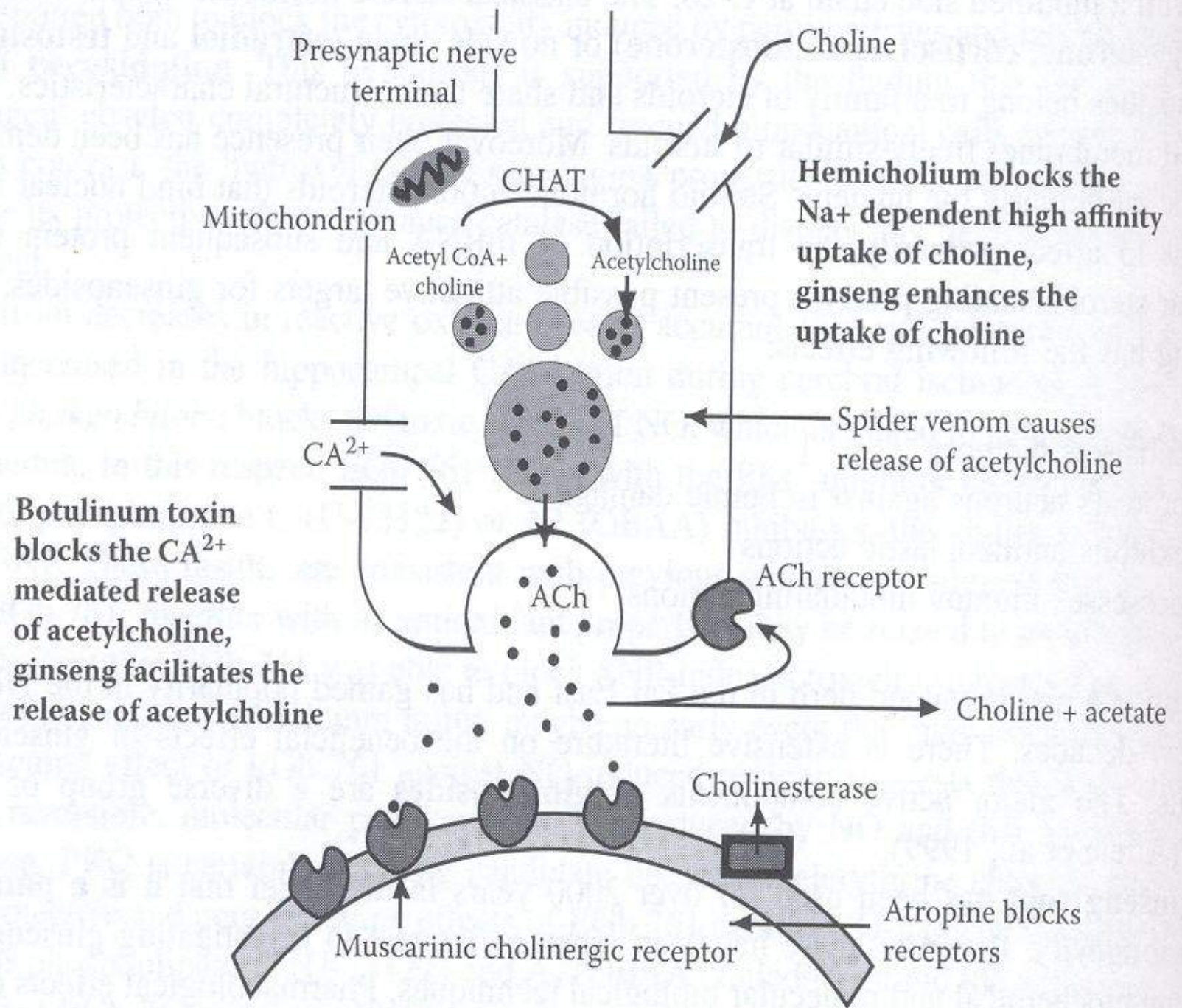
↑
epoxidação



L-hiosciamina

racemização

DL- hiosciamina = atropina



ATROPINA

- EM ASMA BRÔNQUICA
- ADJUVANTE DA ANESTESIA
 - REDUÇÃO DAS SECREÇÕES
 - Salivares
 - Brônquicas ⇨ medicação pré-anestésica
 - BRONCODILATAÇÃO
- SISTEMA DIGESTÓRIO
 - Deprime
 - Motilidade do trato gastrointestinal
 - Secreção ácida
- VISÃO
 - Midríase ⇨ bloqueio do esfíncter da íris

TABLE 14.3
The Pharmacological Actions of Atropine

Doses (mg)	Effects
0.5	Slight cardiac slowing; some dryness of mouth; inhibition of sweating
1.0	Definite dryness of mouth; thirst; acceleration of heart, sometimes preceded by slowing; mild dilatation of pupil
2.0	Rapid heart rate; palpitation; marked dryness of mouth; dilated pupils; some blurring of near vision
5.0	All the preceding symptoms are more marked; difficulty in speaking and swallowing; restlessness and fatigue; headache; dry, hot skin; difficulty in micturition; reduced intestinal peristalsis
10.0 and more	Preceding symptoms are more marked; pulse rapid and weak; iris practically obliterated; vision very blurred; skin flushed, hot, dry, and scarlet; ataxia, restlessness, and excitement; hallucinations and delirium; coma

Note: The best-known antimuscarinic or anticholinergic drugs are the belladonna alkaloids. The major drugs in this class are atropine, hyoscyamine, and scopolamine. A number of plants belonging to the potato family (*Solanaceae*) contain similar alkaloids. *Atropa belladonna* (deadly nightshade), *Hyoscyamus niger* (henbane), *Datura stramonium* (jimsonweed or thorn apple), and several species of *Scopolia* also contain belladonna alkaloids.

ATROPINA

- ENVENENAMENTO POR ANTICOLINESTERÁSICOS
 - DEGRADAM ACETILCOLINESTERASE ⇨
ACETILCOLINA NÃO É DEGRADADA ⇨
ATROPINA INIBIDOR COMPETITIVO DA
ACETILCOLINA

ATROPINA

- USO EXTERNO → anestésico local por dessensibilização das terminações nervosas
- REDUÇÃO DAS SECREÇÕES NASAIS, EM RINITE ALÉRGICA

ATROPINA 12

- Absorção oral
- Atravessa a barreira placentária ⇒ taquicardia fetal

SOLANACEAE

- Espécies mais abundantes na região tropical
- Família: 85 gêneros e 1800 espécies
- Batata, tomate, tabaco
- Idade média: para provocar alucinações

BELADONA

Atropa belladonna L.

- FAMÍLIA ⇒
Solanaceae
- PARTE USADA ⇒
partes aéreas e raízes
- PRINCÍPIOS ATIVOS
Atropina
hiosciamina **20**
Escopolamina **1**



BELADONA

Atropa belladonna L.



BELADONA

Atropa belladonna L.

- TEOR DE ALCALÓIDES
 - FOLHA $\Rightarrow$ 0,2 - 0,6%
 - RAIZ $\Rightarrow$ 0,3 – 0,7%
- AÇÃO FARMACOLÓGICA
 - ANTICOLINÉRGICO
 - ANTIESPASMÓDICO
 - MIDRIÁTICO
 - DIMINUIÇÃO DA ATIVIDADE GLANDULAR
 - ESTIMULANTE DO SNC

ESTRAMÔNIO

Datura stramonium L.

- Figueira do inferno
- Erva do diabo
- Figueira brava
- FAMÍLIA $\Rightarrow$ Solanaceae
- ORIGEM $\Rightarrow$ América Central
- PARTE USADA $\Rightarrow$ folhas e ramos floridos
- TEOR DE ALCALÓIDES $\Rightarrow$ 0,1 – 0,6%
- HIOSCIAMINA:ESCOPOLAMINA 5:1



ESTRAMÔNIO

Datura stramonium L.

- AÇÃO FARMACOLÓGICA
 - ANTICOLINÉRGICO
 - ANTIESPASMÓDICO
 - MIDRIÁTICO
 - DIMINUIÇÃO DA ATIVIDADE GLANDULAR
 - ESTIMULANTE DO SNC



MEIMENDRO

Hyoscyamus niger L.

- FAMÍLIA $\Rightarrow$ Solanaceae
- ORIGEM $\Rightarrow$ Europa
- PARTE USADA $\Rightarrow$ folhas e ramos floridos
- PRINCÍPIOS ATIVOS
 - Atropina
 - Hiosciamina **1**
 - Escopolamina **1,2**
- TEOR DE ALCALÓIDES
 - 0,02 – 0,08%



MEIMENDRO

Hyoscyamus niger L.

- AÇÃO FARMACOLÓGICA
 - ANTICOLINÉRGICO
 - ANTIESPASMÓDICO
 - MIDRIÁTICO
 - DIMINUIÇÃO DA ATIVIDADE GLANDULAR
 - DEPRESSOR DO SNC



elfriede marianne bacchi FCF-USP

MEIMENDRO

Hyoscyamus niger L.



elfriede marianne bacchi FCF-USP

TROMBETEIRA

Brugmansia suaveolens (Humb.et Bonpl.ex Willd.) Bercht.et J.Presl

■ FAMÍLIA

Solanaceae

■ PARTE USADA

folhas



TROMBETEIRA

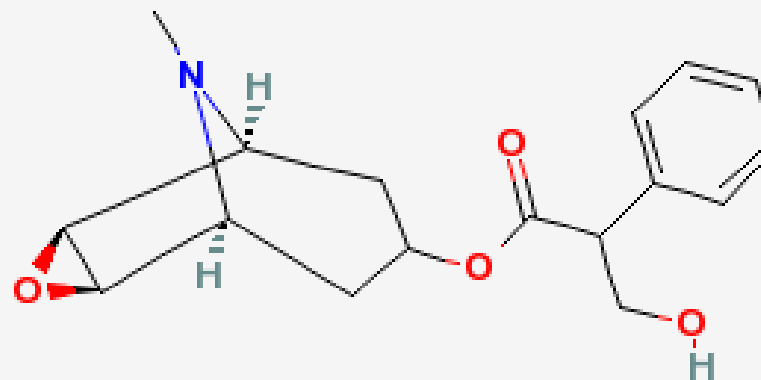
PRINCÍPIOS ATIVOS:

escopolamina

hiosciamina

TEOR DE ALCALÓIDES:

0,33-0,56%



TROMBETEIRA

Brugmansia suaveolens (Humb.et Bonpl.ex Willd.)
Bercht. Et J.Presl

- AÇÃO FARMACOLÓGICA

- anticolinérgico

- antiespasmódico
- midriático
- diminuição de secreções

- depressor do SNC



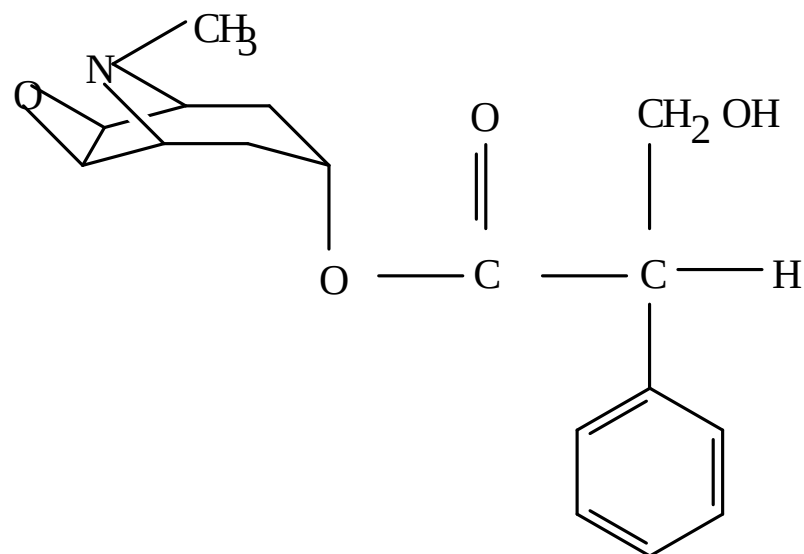
TROMBETEIRA

Brugmansia suaveolens (Humb. & Bonpl. ex Willd.) Bercht. & J. Presl

PRINCÍPIOS ATIVOS:

escopolamina

hiosciamina

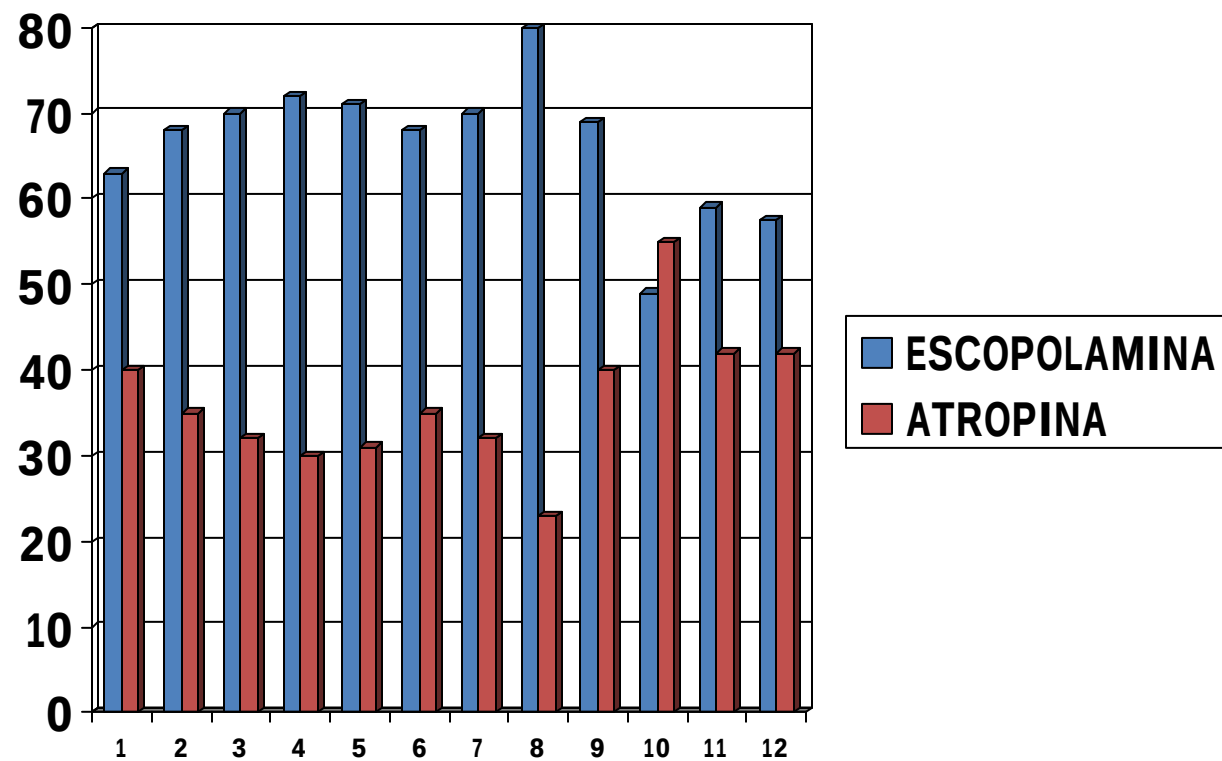


TEOR DE ALCALÓIDES:

0,33-0,56%

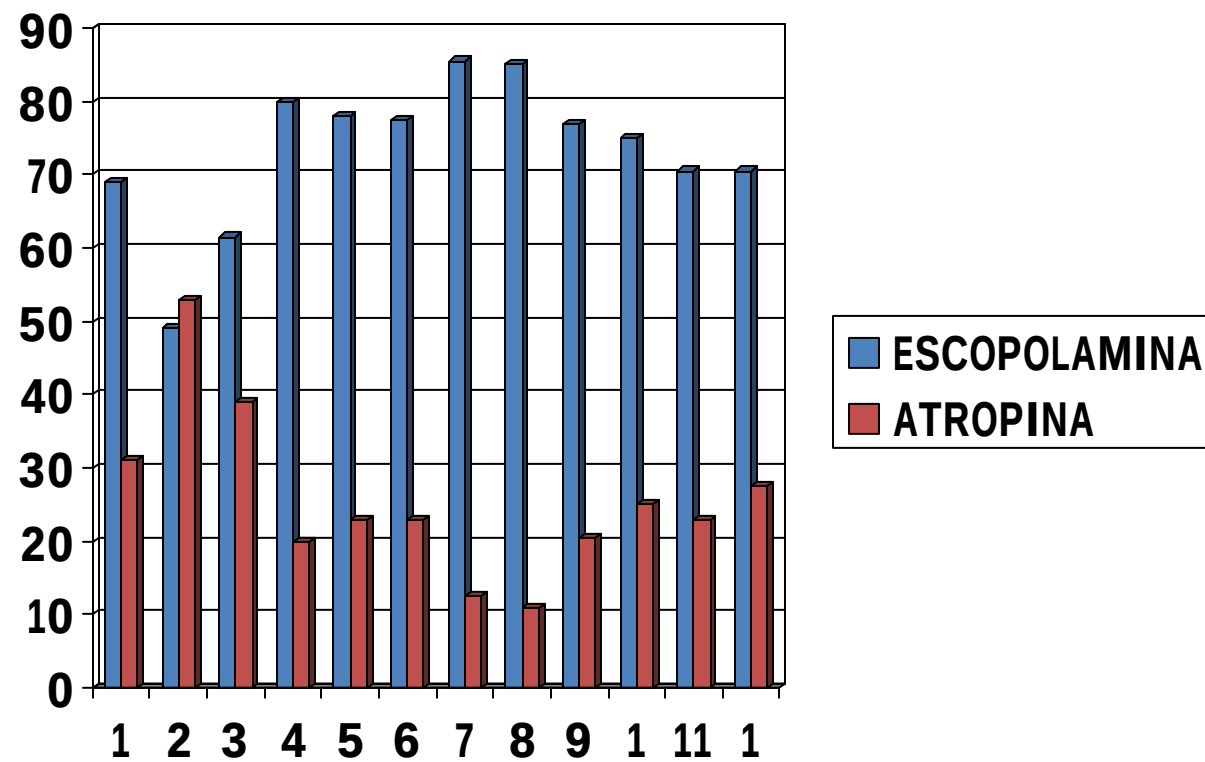
VARIAÇÃO DOS TEORES

FOLHA



VARIAÇÃO DOS TEORES

CAULE



COLINÉRGICOS

JABORANDI

Pilocarpus jaborandi Holmes

Pilocarpus microphyllus Stapf ex Wardleworth

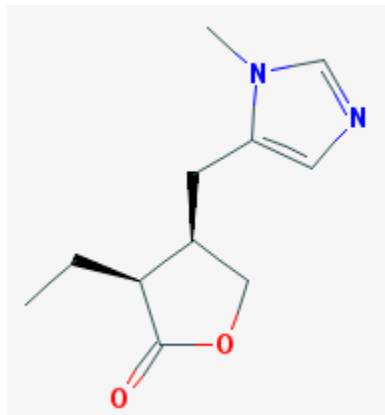
Pilocarpus pennatifolius Lem.

- FAMÍLIA: Rutaceae
- ORIGEM E CULTIVO
Brasil e Paraguai
- PARTE USADA: folha



JABORANDI

- PRINCÍPIOS ATIVOS
 - alcalóides (07-08%)
 - óleo essencial



pilocarpina



JABORANDI



- AÇÃO FARMACOLÓGICA
 - colinérgico
 - não degradada pela acetilcolinesterase
- USO: glaucoma
 - (diminuição da pressão intraocular)

JABORANDI



elfriede marianne bacchi FCF-USP

PILOCARPINA

- Agonista muscarínico
- Estímulo da secreção das glândulas
 - Sudoríparas
 - Lacrimais
 - Salivares
 - Brônquicas

DROGAS OU PRINCÍPIOS ATIVOS QUE ATUAM NO SNA SIMPÁTICO

■ADRENÉRGICO

EFEDRINA

■ANTIADRENÉRGICO

ALCALÓIDES DO ESPORÃO DE CENTEIO

RESERPINA

ESPORÃO DE CENTEIO

Claviceps purpurea (Fries) Tulasne

■ ESCLERÓCIO DE FUNGO QUE CRESCE SOBRE O CENTEIO

■ HISTÓRICO

ASTECAS UTILIZAVAM EM CERIMÔNIAS RELIGIOSAS

IDADE MÉDIA

MORTES POR PÃO CONTAMINADO (ERGOTISMO)

SÉCULO XVII ⇒ CAUSA DO ERGOTISMO

ESPORÃO DE CENTEIO

■ HISTÓRICO

1580 ⇒ UTILIZADO PARA ACELERAR O PARTO

1820 ⇒ TETANIA ⇒ UTILIZADO EM HEMORRAGIAS
PÓS-PARTO



elriede marianne bacchi FCF-USP

ESPORÃO DE CENTEIO

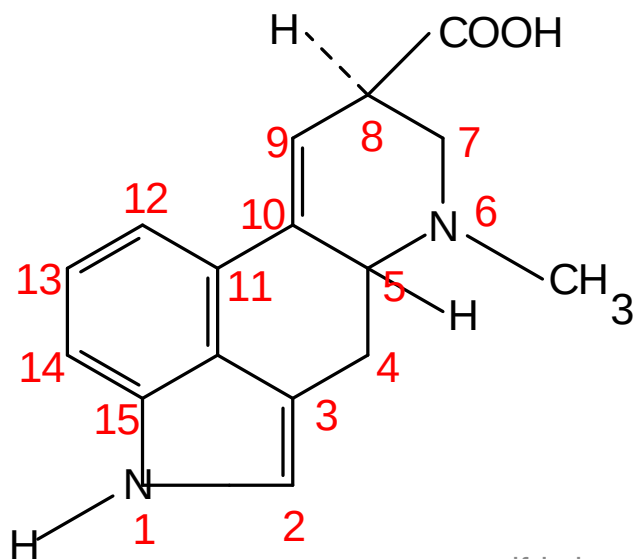
■ CULTIVO

EM CENTEIO DE FLORAÇÃO TARDIA

CULTURA DE CÉLULAS

SÍNTESE PARCIAL

■ TEOR DE ALCALÓIDES 0,1 A 1%



ÁCIDO LISÉRGICO

ALCALÓIDES DO ESPORÃO DE CENTEIO

Tabela 12.2 Propriedades dos alcalóides do esporão do centeio (*ergot*)

Substância	Receptor de 5-HT	Receptor α -adrenérgico	Receptor de dopamina	Contração uterina	Principais usos	Efeitos colaterais etc.
Ergotamina	Antagonista/agonista parcial (5-HT ₁)	Agonista parcial (vasos sangüíneos) Antagonista (outros locais)	Inativa	++	Enxaqueca	Êmese Vasoconstrição (evitar na presença de doença vascular periférica) Evitar durante a gravidez
Diidroergotamina	Antagonista/agonista parcial (5-HT ₁)	Antagonista	Inativa	+	Enxaqueca (em grande parte obsoleta)	Menos êmese do que a ergotamina
Ergometrina	Antagonista/agonista parcial (5-HT ₁) (fraco)	Antagonista fraco/agonista parcial	Fraca	+++	Prevenção da hemorragia pós-parto	

ESPORÃO DE CENTEIO INTOXICAÇÃO

■ AGUDA

VÔMITO
CÓLICA
VERTIGEM
MORTE

ESPORÃO DE CENTEIO INTOXICAÇÃO

■ CRÔNICA

ERGOTISMO CONVULSIVO
CONTRAÇÃO DAS EXTREMIDADES
SENSAÇÃO DE ARDOR
SINTOMAS TETÂNICOS E ASFIXIA
AGITAÇÃO
DELÍRIO
COMA
MORTE

ESPORÃO DE CENTEIO INTOXICAÇÃO

■ CRÔNICA

ERGOTISMO GANGRENOSO

DOR

INTUMESCIMENTO DAS EXTREMIDADES

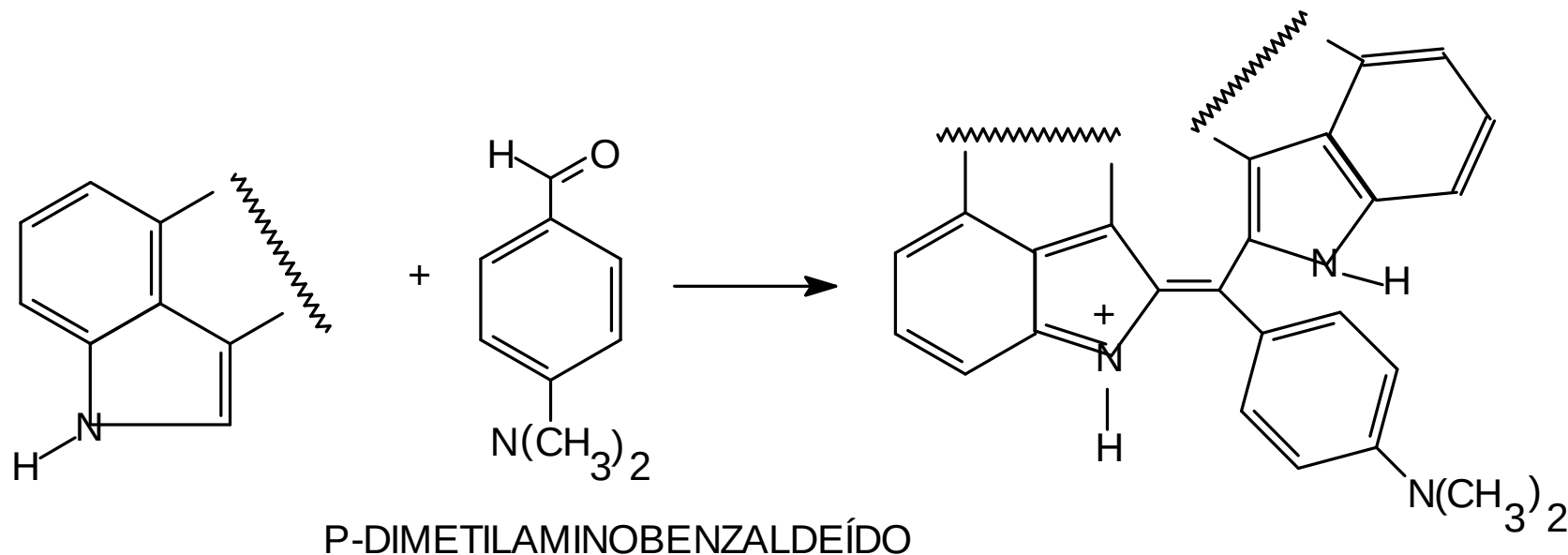
GANGRENA DAS PERNAS

LESÕES DA MEDULA

MORTE

ESPORÃO DE CENTEIO

IDENTIFICAÇÃO



■ REAÇÃO DE VAN URK

ALCALÓIDES INDÓLICOS

elfriede marianne bacchi FCF-USP

DROGAS OU PRINCÍPIOS ATIVOS COM EFEITOS DIVERSOS

■ SISTEMA DIGESTÓRIO

EMETINA

BOLDINA

■ CORAÇÃO

QUINIDINA

■ ANTI-INFLAMATÓRIO

COLCHICINA

■ ANTIMALÁRICO

QUININA

■ ANTINEOPLÁSICO

VINCRISTINA

VIMBLASTINA

TAXOL

IPECA

Carapichea ipecacuanha (Brot.) L.Andersson

Cephaelis ipecacuanha (Brotero)A.Richard

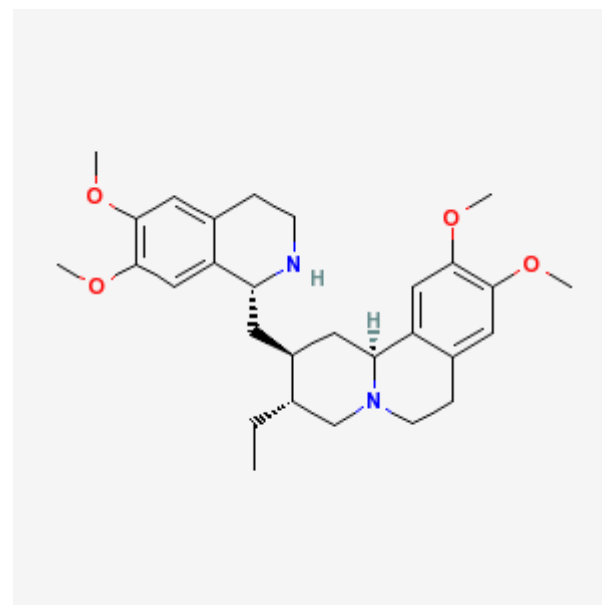
Cephaelis acuminata H.Karst.

- Família
Rubiaceae
- Origem
Brasil, Colômbia
- Parte usada
Raíz e rizoma



IPECA

- Vegetal ☒ erva de 40cm de altura
- Alcalóides ☒ 2-6%
 - Emetina
 - Cefelina
 - Psicotrina
 - O-metilpsicotrina



IPECA

AÇÃO FARMACOLÓGICA

- Expectorante (0,03-0,13g)
- Emético (1,0-2,0g)
 - Receptores 5-HT podem estar envolvidos na atividade emética 1

TOXICIDADE

- Hepatotóxico

BOLDO

Peumus boldus Molina

- FAMÍLIA Monimiaceae
- ORIGEM Chile, Peru
- PARTE USADA folhas



BOLDO

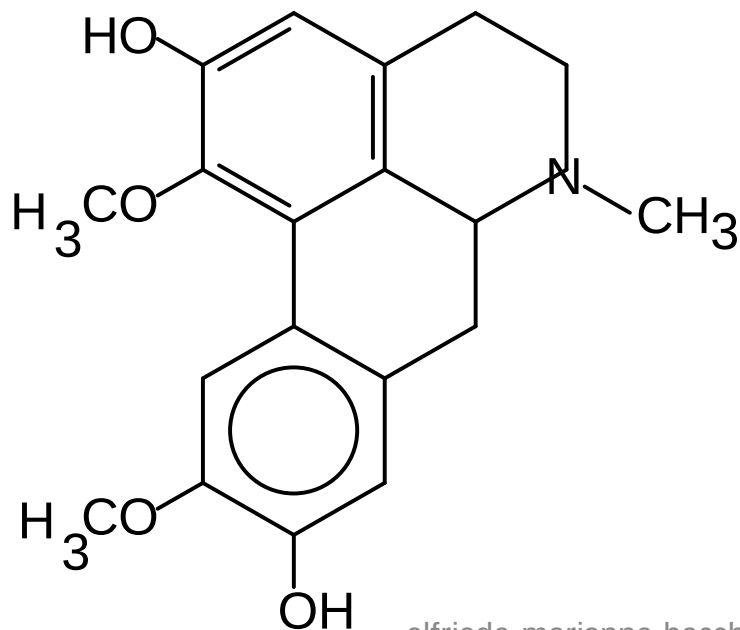
■ PRINCÍPIOS ATIVOS

ALCALÓIDES (~20)

1 - 3% DE BOLDINA

ÓLEO ESSENCIAL (2%)

ASCARIDOL, CINEOL, P-CIMOL



BOLDINA

BOLDO

■ AÇÃO FARMACOLÓGICA
COLERÉTICO E COLAGOGO

■ USO
EM PROBLEMAS DIGESTIVOS



BOLDO



elfriede marianne



Falso boldo

Plectranthus
barbatus Andr.

elfriede



QUINA

Cinchona pubescens Vahl

Cinchona calisaya Wedd.



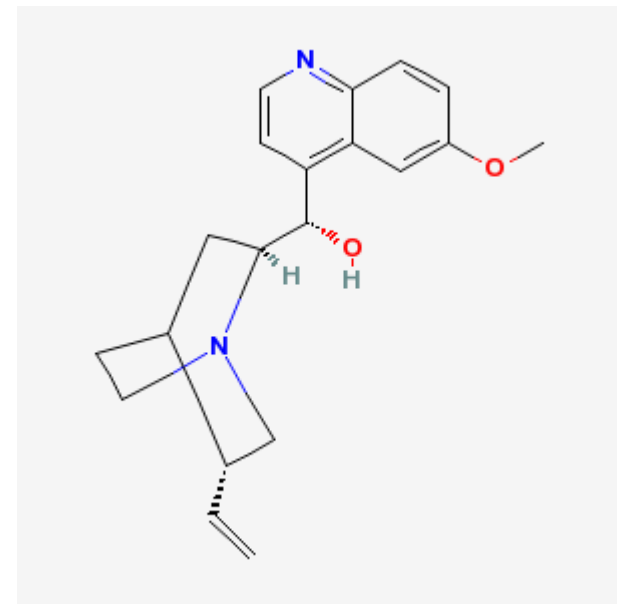
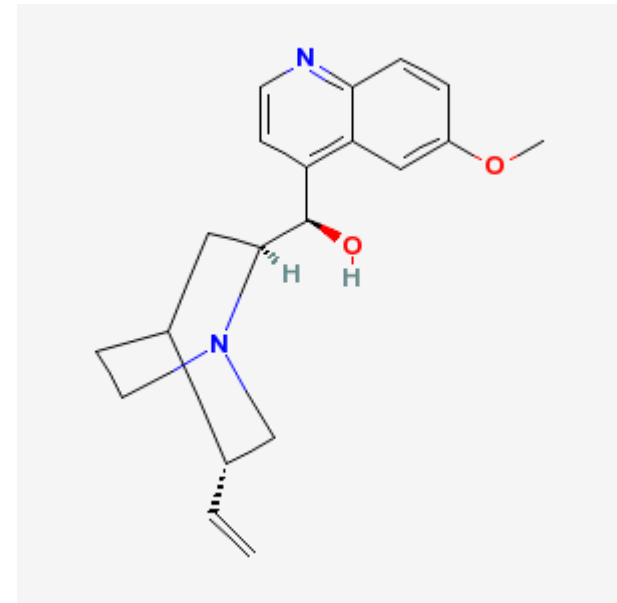
elfriede marianne bacchi FCF-USP

QUINA

- Família ☒ Rubiaceae
- Parte usada ☒ casca
- Origem ☒ Equador, Guatemala
- Cultivo ☒ Java, Ceilão
- Vegetal ☒ árvore de 30m de altura

QUINA

- Princípios ativos
- Alcaloides (4-12%)
- Quinina
- Quinidina
- Cinchonina
- Cinchonidina



QUINA

Quinidina

– Antiarritmico

- Atua nos canais de Ca^{2+} $\boxtimes$ diminui influxo de K^+ , retardando a repolarização

Catharanthus roseus (L.) G. Don

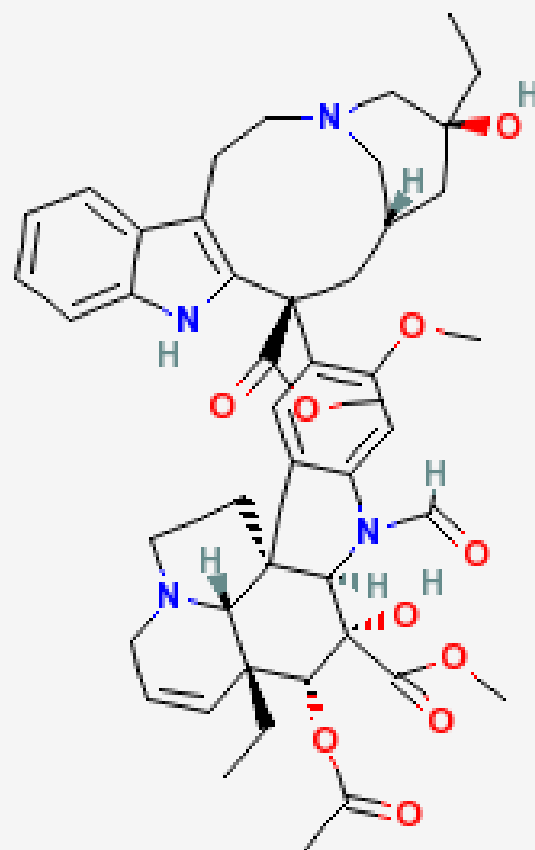
- Sinônimo
Vinca rosea L.
- Família
Apocynaceae
- Origem
Madagascar
- Parte usada
planta inteira



VINCA

PRINCÍPIOS ATIVOS

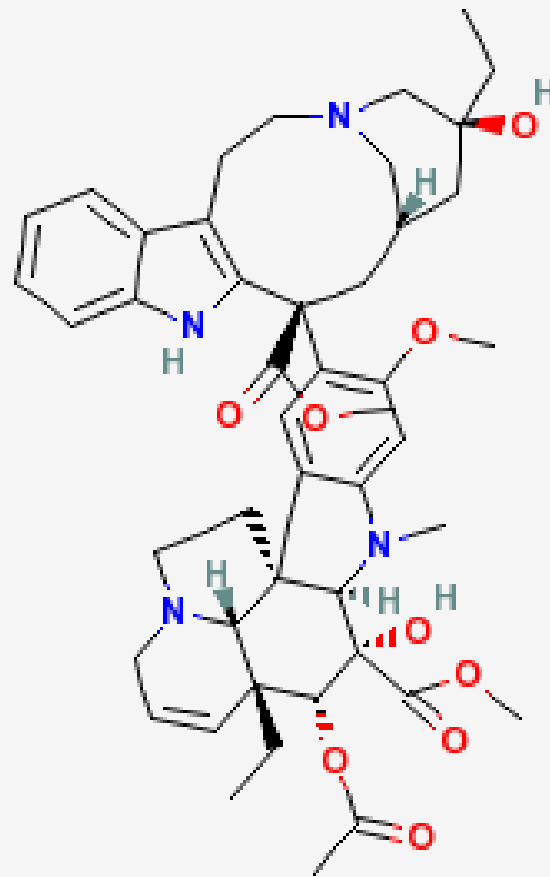
- Alcalóides
0,05%
 - Vincristina



VINCA

■ PRINCÍPIOS ATIVOS

Vimblastina



elfriede marianne bacchi FCF-USP

VINCA

AÇÃO FARMACOLÓGICA

- Citostático ☒ impede a mitose

USO

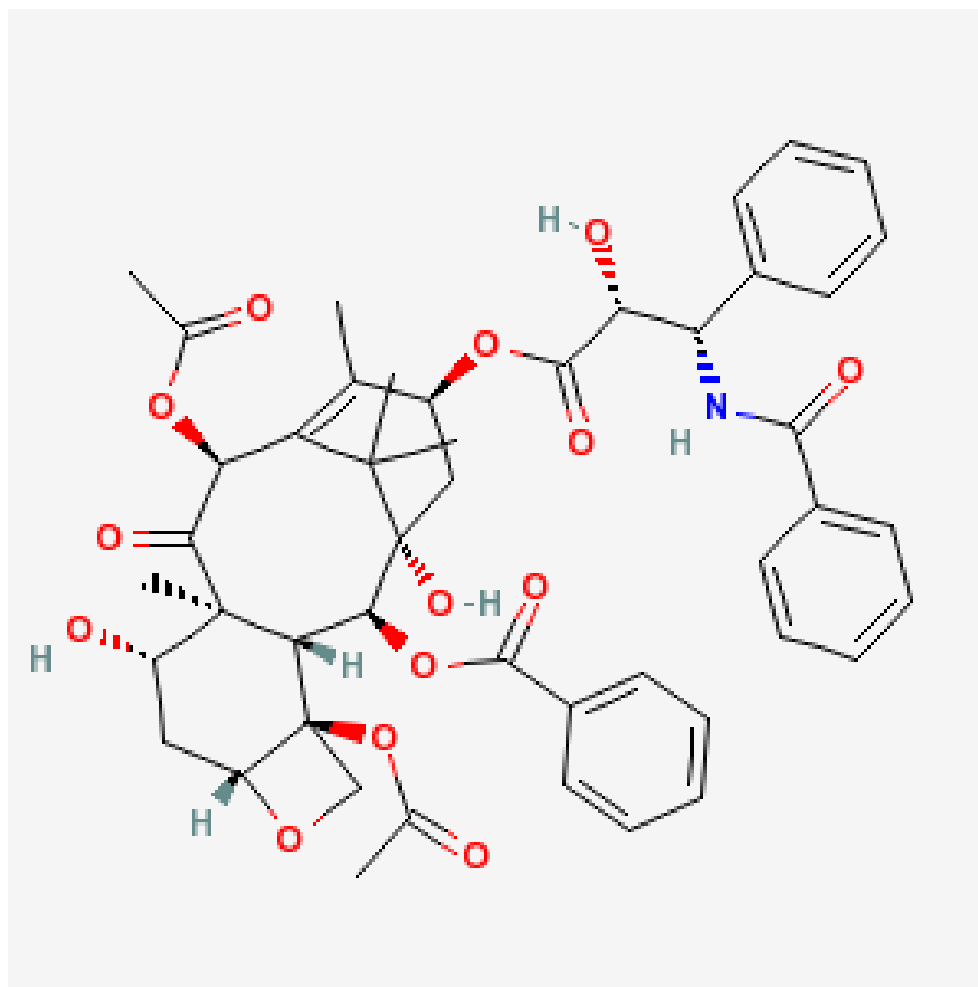
- Leucemia
- Mal de Hodgkin (tecido linfóide)

PACLITAXEL

- Origem *Taxus brevifolia* Nutt.
- Família
 - ☒ Taxaceae
- Árvore
 - crescimento de 60 a 100 anos
- Parte usada
 - ☒ casca



PACLITAXEL



eliriede marianne pacchi FCF-USP

PACLITAXEL

- AÇÃO FARMACOLÓGICA
- Inibidor de mitose
 - ⊠> favorece a polimerização da proteína tubulina nos microtúbulos
 - ⊠> inibe a despolimerização da tubulina nos microtúbulos ⊠> impede o desaparecimento do fuso ao fim da divisão celular
 - em câncer de
 - Ovário
 - Pulmão
 - Esôfago
 - Cabeça
 - Pescoço

Questões

- Considerando os diversos grupos de alcaloides presentes em *Papaver somniferum*, quais os principais, qual a sua atividade farmacológica e seu uso?
- *Erythroxylon coca* contém um alcaloide majoritário. Qual o principal uso terapêutico deste alcaloide? Quais os principais efeitos colaterais deste alcaloide?
- Quais as principais drogas contendo alcaloides tropânicos? É possível a substituição de uma droga ou seu extrato vegetal, por outra, visando a mesma atividade anticolinérgica? Justificar. Qual o uso dos extratos contendo alcaloides tropânicos?
- Folíolos de *Pilocarpus jaborandi* são utilizados terapêuticamente? Justificar.

Questões

- Comentar sobre a atividade farmacológica das drogas constantes no slide “metilxantinas”.
- Quais os principais alcaloides do esporão de centeio e suas atividades farmacológicas?
- Comentar sobre a atividade farmacológica de raiz de ipeca, considerando diferentes doses terapêuticas.
- Quais os principais grupos de fármacos responsáveis pela atividade farmacológica de extratos de folhas de *Peumus boldus*?
- Citar duas drogas vegetais e seus fármacos, com atividade antitumoral.