

ORFENADRINA

Ações terapêuticas

Miorrelaxante.

Propriedades

É um antagonista dos receptores colinérgicos muscarínicos, tanto centrais como periféricos. Exerce outra atividade farmacológica sobre os receptores histaminérgicos, uma vez que possui uma débil ação anti-histamínica. Desenvolve uma notável atividade relaxante muscular; diminui o tônus aumentado do músculo esquelético e a função motora, sem perturbar a consciência nem a força muscular, como ocorre com os fármacos que atuam sobre a placa neuromuscular. No Mal de Parkinson, a orfenadrina pode ser incluída entre os recursos terapêuticos (levodopa, biperideno, triexifenidilo), já que por seu efeito anticolinérgico reduz a rigidez e o tremor dos pacientes com Parkinson idiopático, pós-encefalítico ou medicamentoso. Estudos farmacodinâmicos em animais mostraram que a orfenadrina aumenta as concentrações de serotonina e norepinefrina e inibe a captação de dopamina em preparados de sinaptossomas estriatais do SNC. Após sua administração oral, apresenta um efeito metabólico de primeiro passo - pré-sistêmico - de 30%. Sua distribuição tissular é ampla, tem uma longa meia-vida plasmática, de 13 horas pela via oral e 16 horas pela intramuscular. Seu grau de união às proteínas é elevado (95%), sua principal metabolização é desenvolvida no fígado e é eliminada pela urina (70%). Seu principal metabólito reconhecido é a N-desmetilorfenadrina. Não há evidência de que a droga tenha circulação entero-hepática e foi detectada uma eliminação inalterada de 8%.

Indicações

Associada com outros antiinflamatórios não esteróides, em afecções musculoesqueléticas que ocorrem com hipertonia e contração muscular (fibrosite, lombalgia, periartrite escapuloumeral, contração muscular).

Posologia

Ingestões de 5-100mg ao dia, repartidos em 2 ou 3 vezes. Conforme a resposta terapêutica, pode-se aumentar mais 50mg a cada semana. Em pacientes parkinsonianos, indicam-se 250 a 300mg diários, mas não devem superar 400mg/dia como dose máxima.

Reações adversas

De acordo com a dose administrada, apresentam-se ocasionalmente constipação, secura na boca, distúrbios da micção, astenia, fadiga, sonolência. No aparelho cardiovascular: hipotensão ortostática, taquicardia sinusal. Também foi assinalada visão turva. Em indivíduos de idade avançada com Parkinson, foram assinaladas algumas alterações no SNC, como alucinações e estados confusionais.

Precauções

Empregar com cautela em pacientes idosos, para os quais se recomendam doses iniciais baixas, com o objetivo de avaliar a tolerância ao fármaco e a resposta terapêutica. Na gravidez e lactação,

a relação risco-benefício deverá ser avaliada conforme critério médico.

Interações

O uso concomitante de álcool gera um aumento da biotransformação hepática do fármaco, com o que sua atividade terapêutica é deteriorada. Associada com levodopa, mostrou um efeito sinérgico em pacientes parkinsonianos. No parkinsonismo medicamentoso ou efeitos extrapiramidais gerados pelos neurolépticos, a orfenadrina seria um recurso complementar efetivo e útil.

Contra-indicações

Como todos os fármacos com atividade anticolinérgica, não deve ser empregado em pacientes com glaucoma, hipertrofia prostática ou síndrome pilórica. Não usar em crianças menores de 12 anos. Não ingerir bebidas alcoólicas durante o tratamento.

Referência Bibliográfica

P.R. Vade-mécum 2004/2005