

TIZANIDINA

Ações terapêuticas

Relaxante muscular. Antiespasmódico.

Propriedades

É um derivado imidazolínico que desenvolve atividade relaxante muscular central por sua ação, principalmente, sobre a medula espinhal. Integra, junto ao baclofeno, dantroleno e diazepam, o grupo de drogas antiespasmódicas que diminuem o tônus muscular excessivo causado por diferentes patologias músculo-esqueléticas (lombalgia, torcicolo, cervicobraquialgia, fibrose muscular). Seu mecanismo de ação desenvolve-se sobre as vias neuronais polisinápticas, que participam da ativação dos motoneurônios e unidades motoras (tanto do sistema a como d) com diminuição do tônus muscular patologicamente elevado. O efeito miotonolítico poderia ser atribuído a seu efeito agonista sobre os receptores α -noradrenérgicos, dado que mostra uma alta afinidade pelos pontos de união da clonidina no córtex de ratos e uma diminuição ao nível do metabólito MOPEG da NA no SNC. No nível espinhal, a droga causa inibição da liberação induzida por K^+ do neurotransmissor putativo aspartato, a partir dos interneurônios excitativos. Recentemente foi salientado que a tizanidina poderia atuar também sobre centros supraespinhais através de mecanismos locais α_2 (agonista central). Este agente miotonolítico é absorvido de forma rápida e quase completa após sua administração oral; após sua absorção no trato digestivo alcança-se um pico plasmático entre 1 e 2 horas. Possui uma baixa união às proteínas plasmáticas (30%), sua meia-vida de eliminação é de 3 a 5 horas e sua biometabolização é na maior parte hepática. Aproximadamente 70% do fármaco são eliminados pela urina, tanto como droga inalterada e metabólitos de escassa atividade biológica.

Indicações

Patologias espasmódicas e dolorosas músculo-esqueléticas. Esclerose múltipla; afecções neurológicas que ocorrem com espasmos musculares. Espasmos musculares dolorosos pós-cirúrgicos. Doenças da medula espinhal devidas a processos degenerativos, traumáticos, infecciosos ou tumorais.

Posologia

No tratamento da espasmodicidade, a dose deverá ser ajustada às necessidades individuais. Aconselha-se iniciar com doses baixas: 2 a 6mg por dia, divididos a cada 8 horas. Esta posologia pode ser aumentada de forma progressiva em 2 a 4mg cada semana, até atingir a dose ótima, que oscila entre 12 e 24mg diários divididas em 3 a 4 doses. Em terapias prolongadas a dose ótima é de 4mg, 3 vezes ao dia. A dose máxima diária total não deve ultrapassar os 36mg. No espasmo muscular doloroso músculo-esquelético, a dose recomendada é de 2 a 4mg, 3 vezes ao dia, com dependência da gravidade da sintomatologia. Se for necessário, pode-se agregar uma dose noturna, ao deitar, de 2 a 4mg.

Reações adversas

A tolerância à tizanidina depende basicamente da dose administrada e da patologia em questão.

Entre os fenômenos secundários mais freqüentes encontram-se astenia, cansaço, sonolência, enjôos, cefaléia, secura na boca, náuseas, vômitos, constipação, insônia. Nos estudos a longo prazo, os efeitos indesejáveis que foram mais freqüentes nos primeiros três meses diminuíram com a continuidade do tratamento. A maioria destes fenômenos foi transitória, leve e raramente motivaram a suspensão do tratamento.

Precauções

A posologia deverá ser adequada cuidadosamente em pacientes com insuficiência cardíaca, hepática ou renal. Os pacientes que conduzem veículos ou manejam maquinário devem ser prevenidos ao iniciar o tratamento, pois podem apresentar enjôos e sonolência. Embora não tenha sido estabelecida sua inocuidade durante a gravidez e a lactação, não foram detectados, até o momento, efeitos teratogênicos nos estudos pré-clínicos.

Interações

Não administrar de forma concomitante com bebidas alcoólicas devido ao risco de seu efeito aditivo sobre o SNC. O emprego de agentes anti-hipertensivos ou diuréticos pode potencializar a hipotensão arterial. Não foram informadas interações com psicofármacos (antidepressivos, neurolépticos, sedativos, hipnóticos), vasodilatadores, antibióticos, antidiabéticos, anticoagulantes e hormônios.

Contra-indicações

Miastenia, choque, crianças menores de 12 anos, hipersensibilidade ao fármaco. Pós-operatório. Insuficiência respiratória obstrutiva ou restritiva grave. Asma brônquica. DPOC. Pacientes submetidos a assistência respiratória mecânica.

Referência Bibliográfica

P.R. Vade-mécum 2004/2005