

VENLAFAXINA

Ações terapêuticas

Antidepressivo.

Propriedades

Venlafaxina é um novo fármaco antidepressivo com uma estrutura química totalmente diferente da dos tricíclicos clássicos, tetracíclicos e outros agentes antidepressivos conhecidos. Quimicamente denomina-se 1-2 dimetilamino-1-4-metoxifeniletil-ciclohexano. Seu mecanismo de ação lembra o de outros antidepressivos conhecidos (fluoxetina, sertralina e paroxetina), já que está diretamente associado à potenciação da atividade neurotransmissora no sistema nervoso central. É um potente e ativo inibidor da recaptação de aminas no neurônio pré-sináptico e, à diferença dos acima mencionados, além de inibir a recaptação da serotonina (5-hidroxitriptamina) age sobre a noradrenalina e a dopamina; mesmo assim, não exerce esta ação sobre os receptores muscarínicos, histaminérgicos ou alfa-adrenérgicos. Por esta razão não seriam gerados efeitos significativos no nível autônomo, nem anticolinérgicos, hipnosedativos ou cardiovasculares, como ocorre com os antidepressivos tricíclicos clássicos. A venlafaxina é absorvida sem inconvenientes no trato digestivo (92%) nas doses habituais (25-100mg/dia); sofre uma ativa e ampla biotransformação hepática da qual surge um único e ativo metabólito denominado O-desmetilvenlafaxina (ODV). Estima-se que aproximadamente 87% da dose administrada por via oral são excretados na urina dos pacientes nas primeiras 48 horas, e desta 5% correspondem ao fármaco não metabolizado, 26% ao metabólito ativo (ODV) e 27% a outros metabólitos inativos; isto faz com que a excreção renal seja a principal via de eliminação da venlafaxina. O processo de absorção gastrointestinal não é afetado pela presença de alimentos. A fração que se liga às proteínas plasmáticas é de 27% para uma concentração sérica de 2,5 a 2.215ng/ml. O perfil farmacocinético da venlafaxina administrada a cada 8 ou 12 horas não é alterado pela idade nem pelo sexo dos indivíduos em tratamento. Em indivíduos com transtornos renais, a meia-vida de eliminação prolongou-se aproximadamente 50% e o clearance de creatinina em 24%; enquanto que em pacientes com nefropatias crônicas em processo de diálise a meia-vida prolongou-se em torno de 180%. A meia-vida plasmática do fármaco é similar à da fluoxetina (3 a 5 dias).

Indicações

Síndromes depressivas de grau variável. Transtornos obsessivo-compulsivos.

Posologia

A dose habitual para iniciar o tratamento é de 75mg/dia, a cada 8 a 12 horas, com as principais refeições. Segundo a resposta clínica, a dose poderá ser aumentada até 150 a 225mg/dia em pacientes com patologias depressivas severas. Após a remissão do transtorno, deve-se utilizar uma dose efetiva mínima de manutenção. Não é necessário ajustar a dose em indivíduos depressivos idosos, diferentemente dos antidepressivos tricíclicos.

Reações adversas

Foram relatados náuseas, diarreia, erupções cutâneas, anorexia, ansiedade, insônia, nervosismo,

confusão mental, cefaléia, secura da boca e astenia. Em geral, a tolerância clínica ao fármaco é boa e a incidência destes efeitos é baixa (3%).

Precauções

Os indivíduos que requerem um grau de reflexos e alerta, ou trabalham com máquinas ou veículos, deverão ser advertidos do risco de desenvolver sonolência. Em indivíduos com insuficiência renal recomenda-se reduzir a dose diária. A suspensão do tratamento deverá ser lenta e gradual, devendo-se evitar a suspensão repentina. Quando se deseja substituir a venlafaxina por um antidepressivo inibidor da monoamino oxidase (IMAO), observar um intervalo de 7 a 14 dias. As patologias depressivas severas requerem tratamentos prolongados (3 a 6 meses), para se conseguir a eutimia. Em indivíduos hipertensos deverá ser usada com precaução e controle tensional periódico.

Interações

A venlafaxina é um antidepressivo que, pela sua reduzida fração ligada às proteínas plasmáticas e sua mínima interação com o sistema citocromo P450, possui uma leve tendência a gerar interações medicamentosas com diversos fármacos (lítio, diazepam, cimetidina).

Contra-indicações

Gravidez e lactação. Hipersensibilidade ou alergia à venlafaxina. Desaconselha-se o consumo de bebidas alcoólicas durante o tratamento, a administração a crianças menores de 18 anos ou em presença de insuficiência hepática ou renal graves.

Referência Bibliográfica

P.R. Vade-mécum 2004/2005