

NALTREXONA^

^nerevizuit

1. Denumire științifică
Naltrexonum
Naltrexonă-hidroclorid : morphinan-6, 17-[ciclopropilmetil]-4,5-epoxi-3,14dihidroxi-[5 α]
2. Clasa de medicamente de care aparține:
Medicamente folosite în tratamentul dependenței la etanol
Blocant al efectelor opioizilor exogeni
3. Antagonist al receptorilor opioizi- μ (1)
Există evidențe că naltrexona blochează activarea d către alcool a căilor dopaminergice implicate în recompensă.
4. Farmacocinetică
Este absorbită rapid și aproape integral (96%) (2) după administrarea orală și este metabolizată hepatic (prin dihidridiol dehidrogenază și nu prin enzimele CYP 450) (3) la metabolitul activ 6- β -naltrexol.
Vârful de concentrație plasmatică este atins la cca. 1 oră după adminstrare.
Efectele tardive ale naltrexonei sunt sigurate de către 6- β -naltrexol, care are un timp de înjumătățire de 13 ore.
Eliminare predominant renală
5. Mecanism de acțiune
Scade consumul de alcool prin blocarea receptorilor opioizi
Blochează receptorii opioizi astfel încât opiozii exogeni nu mai au receptori disponibili pentru legare
Dozare: 50 mg/zi
6. Indicații principale
Dependența la etanol
Dependența la opiacee
Se asociază cu programe psihoterapeutice
7. Alte indicații
În combinație cu bupropionul (8 mg naltrexonă și 90 mg bupropion) este indicat, ca terapie adjuvantă (asociat cu scăderea aportului caloric și exerciții fizice), în managementul obezității la pacienții adulți
8. Efecte secundare frecvente
Anxietate, iritabilitate, schimbări de dispoziție, nervozitate, cefalee, tulburări ale somnului, agitație, insomnie, iritabilitate, oboseală, vertij, transpirații abundente, lăcrimare excesivă, greață, vomă, dureri abdominale, spasm, apetit scăzut, diaree, constipație, erupții cutanate tranzitorii, dureri musculare și de articulații, retenție urinară, ejaculare întârziată, tulburări de potență, constricție toracică, lipsă de energie, apetit scăzut, amețală, sete, energie crescută (4)

9. Supradoză

Experiența supradozajului de naltrexonă la pacienți este limitată. Nu au existat semne de intoxicație la voluntarii care au primit 800 mg/zi timp de șapte zile. (5)

10. Contraindicații

Pacienți în tratament cu analgezice opioide. Pacienți cu dependență de opioide, inclusive cei cu tratament de substituție cu agoniști opioizi (metadonă) sau agoniști parțiali (buprenorfină). Pacienți cu sevraj la opioide. Pacienți al căror test de toleranță la analoxonă a fost pozitiv sau au test urinar pozitiv la opiacee. Sensibilitate anterioară la naltrexonă.

11. Utilizare la grupe de pacienți cu risc crescut

- afectare hepatică: poate cauza citoliză hepatică în doze excesive. Nu este necesară ajustarea dozei în afectările heparice ușoare și moderate. (3)
- afectare renală: precauție la grupa aceasta de pacienți având în vedere excrețarea renală a naltrexonei și a metabolitului activ
- vârstnici: se evită administrarea la persoanele peste 65 de ani
- sarcină și alăptare: categorie de teratogenitate- C; se evită administrarea în sarcină. În studiile pe șobolani s-a evidențiat prezența naltrexonei în lapte; la oameni nu sunt date clinice.
- copii: nu sunt date suficiente pentru administrarea la copii. Unele studii indică administrarea de la vârsta de 15 ani iar altele indică vârsta minimă de 18 ani.

12. Interacțiuni

Nu interacționează cu inhibitorii sau inductoarele CYP450
Poate bloca efectul medicamentelor ce conțin opioide.

1. Goodman & Gilman's The Pharmacological Basis of Therapeutics, 12 th edition,
2. <https://www.drugs.com/pro/naltrexone.html>
3. Stephen M. Stahl, The Prescriber's Guide, fourth edition
4. https://www.anm.ro/_/_RCP/rcp_7011_27.11.06.pdf?anmPage=912&ID=18227
5. https://www.anm.ro/_/_RCP/RCP_6028_11.12.14.pdf