



El bromuro de metilnaltrexona es un antagonista selectivo de la unión de los opioides a los receptores  $\mu$ . Como amina cuaternaria, la capacidad de la metilnaltrexona para atravesar la barrera hematoencefálica es reducida; esto permite que la metilnaltrexona actúe como antagonista de los receptores opioides más periféricos, en tejidos como el tubo digestivo, sin alterar el efecto analgésico de los opioides en el sistema nervioso central.

## **USO CLÍNICO**

Tratamiento del estreñimiento inducido por opioides cuando la respuesta a la terapia laxante no ha resultado efectiva (**E:** *off-label*).

## **DOSIS Y PAUTAS DE ADMINISTRACIÓN**

- **1 mes-12 años:** 0,15 mg/kg (máximo 8 mg) dosis única.
- **>12 años:**
  - Peso <38 kg: 0,15 mg/kg dosis única.
  - Pesos entre 38-61 kg: 8 mg dosis única.
  - Pesos entre 62-114 kg: 12 mg dosis única.

Por lo general, con una sola dosis es suficiente. Entre el 30-50% de los pacientes que reciben metilnaltrexona tienen evacuaciones antes de las 4 horas de la administración, sin pérdida de analgesia ni desarrollo de síntomas de abstinencia a opioides. El inicio de acción oscila entre 15-60 minutos. En caso de ser necesario (falta de respuesta), se puede administrar dosis adicionales en días alternos (intervalo mínimo de 24 horas) o incluso en intervalos más largos, pero en ningún caso se debe administrar más de una vez al día.

### **Insuficiencia renal:**

En Clcr <30 ml/min se reduce la dosis:

- Peso 62-114 kg se reduce a 8 mg.
- Peso < 62 kg se reduce en un 50%.

### **Insuficiencia hepática:**

No se recomienda su administración en insuficiencia hepática grave.

### **Administración:**

- Subcutáneo (vía de administración preferente) o vía intravenosa en bolo.
- En la administración subcutánea se recomienda rotar de zona de inyección. Las zonas de administración recomendadas son: muslo, abdomen o parte superior de los brazos.
- Debido a la fotosensibilidad del principio activo, una vez reconstituido, la solución debe administrarse dentro de las primeras 24 horas.

## **CONTRAINDICACIONES**

- En caso de hipersensibilidad al principio activo o alguno de sus excipientes.
- En casos que presenten o que puedan presentar obstrucción intestinal mecánica, pacientes de alto riesgo de obstrucción recurrente o pacientes con abdomen agudo quirúrgico, debido al riesgo potencial de perforación gastrointestinal. En casos de obstrucción intestinal por sospecha de otra causa distinta al estreñimiento inducido por opioides.

## **PRECAUCIONES**

- El estreñimiento de enfermedades avanzadas con cuidados paliativos puede tener un origen multifactorial, por lo que en ocasiones será necesario utilizar laxantes concomitantemente.
- Se recomienda tener precaución en pacientes con factores predisponentes de presentar perforaciones (cáncer gástrico, úlcera péptica, enfermedad diverticular, pseudobstrucción colónica).
- Aquellos pacientes que sufran alteraciones en la barrera hematoencefálica pueden sufrir un mayor riesgo de síndrome de abstinencia o reducción de la analgesia.
- Se debe monitorizar:
  - **Dolor abdominal intenso**, persistente o empeoramiento de dicho dolor. Si estos síntomas ocurriesen, se debe interrumpir el tratamiento con metilnaltrexona.
  - **Síntomas de abstinencia a opioides**: hiperhidrosis, escalofríos, vómitos, dolor abdominal, palpitaciones y rubor.
  - Asegurar una **analgesia adecuada**.

## **EFFECTOS SECUNDARIOS**

- Los efectos adversos más frecuentes son dolor abdominal, náuseas, diarrea y flatulencia.
- También puede aparecer de manera frecuente, mareos, vómitos y síntomas similares a los del síndrome de abstinencia a opioides como escalofríos, temblor, sofocos, hiperhidrosis, piloerección y palpitaciones. En ocasiones puede observarse hipotensión postural.
- Raramente puede presentar síncope, diarrea grave, colapso cardiovascular, perforación gastrointestinal.

## **INTERACCIONES FARMACOLÓGICAS**

- No presenta interacciones clínicamente relevantes.
- Evitar la combinación con otros antagonistas de opioide por aumentar los efectos tóxicos y el riesgo de abstinencia.

## **DATOS FARMACÉUTICOS**

**Presentaciones comerciales:** las presentaciones disponibles en España pueden consultarse *online* en el Centro de Información de Medicamentos de la AEMPS (CIMA), <http://www.aemps.gob.es/cima>

## **BIBLIOGRAFÍA**

- Fichas técnicas del Centro de Información *online* de Medicamentos de la AEMPS-CIMA [base de datos en Internet]. Madrid, España: Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios

(AEMPS) [consultado el 12/06/2020]. Disponible en:

<https://cima.aemps.es/cima/publico/home.html>

- European public assessment report (EPAR) de Relistor® [base de datos en Internet]. Londres, Reino Unido: European Medicines Agency (EMA) [consultado el 12/06/2020]. Disponible en: <https://www.ema.europa.eu/en/medicines/human/EPAR/relistor>
- Jassal SS. Basic Symptom Control in Paediatric Palliative Care The Rainbows Children's Hospice Guidelines. 9.ª edición. Bristol, Reino Unido: Together for Short Lives; 2013.
- Jassal SS. The Association of Paediatric Palliative Medicine Master Formulary. 5.ª edición. 2020.
- Twycross R, Wilcock A, Howard P. Palliative Care Formulary (PCF5). 5.ª edición. Nottingham, Reino Unido: Palliativedrugs.com Ltd; 2014.
- UpToDate (Pediatric drug information) [base de datos en Internet]. Waltham, MA: Wolters Kluwer Health Clinical Solutions 2020 [consultado el 13/06/2020]. Disponible en: [www.uptodate.com](http://www.uptodate.com)

**Fecha de actualización:** septiembre de 2020.

**La información disponible en cada una de las fichas del Pediamécum ha sido revisada por el Comité de Medicamentos de la Asociación Española de Pediatría y se sustenta en la bibliografía citada. Estas fichas no deben sustituir en ningún caso a las aprobadas para cada medicamento por la Agencia Española del Medicamento y Productos Sanitarios (AEMPS) o la Agencia Europea del Medicamento (EMA).**