

Naltrexona HCl

Antagonista opióide

CAS: 16676-29-2

Peso molecular: 377,86

Fórmula Molecular: $C_{20}H_{23}NO_4 \cdot HCl$

Fator de correção: não é necessário.

Fator de equivalência: não é necessário.

USO ORAL – Portaria 344/98

A Naltrexona é um congênere sintético da oximorfina, diferindo na estrutura pelo fato de o grupo metila no átomo de nitrogênio ser substituído pelo grupo ciclopropilmetila.

A Naltrexona é um antagonista opióide puro que atenua ou bloqueia completamente, reversivelmente, os efeitos subjetivos dos opióides administrados intravenosamente.

É indicada como parte do tratamento do alcoolismo e como antagonista no tratamento da dependência de opióides administrados exogenamente. A Naltrexona é indicada para proporcionar efeito terapêutico benéfico no programa de tratamento direcionado a viciados.

Quando é co-administrado com a morfina, em situação crônica, o produto bloqueia a dependência física à morfina, heroína e outros opióides.

A Naltrexona tem poucas ações intrínsecas além de suas propriedades de bloqueio aos opióides. A administração da Naltrexona não está associada com o desenvolvimento de tolerância ou dependência. Em pacientes fisicamente dependentes de opióides, a Naltrexona precipita a sintomatologia de abstinência. Os estudos clínicos indicam que 50mg de Naltrexona bloqueiam os efeitos farmacológicos de 25mg de heroína administrada intravenosamente por períodos de até 24 horas. Outros dados sugerem que dobrando a dose de Naltrexona, ocorre bloqueio por 48 horas e triplicando a dose, ocorre bloqueio por cerca de 72 horas. A Naltrexona bloqueia os efeitos de opióides pela ligação competitiva (análoga à inibição competitiva de enzimas) aos receptores opióides. Isto faz com que o bloqueio produzido seja potencialmente superável, mas ocorrendo bloqueio cheio com Naltrexona, com a administração de doses muito altas de opióides, resultou em sintomas excessivos de liberação de histamina em pacientes experimentais.

Propriedades

- Antialcoolismo
- Tratamento de dependência aos opióides

Mecanismo de ação

A Naltrexona HCl age como antagonista de substâncias chamadas opióides, como por exemplo, a heroína e morfina, ou seja, atenua de forma acentuada ou bloqueia de forma reversível os efeitos destas substâncias no organismo. O mecanismo de ação deste medicamento no tratamento do alcoolismo não está completamente esclarecido, entretanto, informações obtidas de estudos realizados com a Naltrexona, sugerem que este diminui o consumo de álcool.

Farmacocinética: A Naltrexona é um antagonista receptor opióide puro. Embora bem absorvida oralmente, está sujeita a metabolismo significativo de primeiro passo com biodisponibilidade oral estimada em 5 a 40%. Atribui-se a atividade da Naltrexona à droga e seu metabólito 6-β-naltrexol. A droga e seus metabólitos são excretados primariamente pelo rim (53% a 79% da dose), contudo, a excreção urinária de Naltrexona não modificada é de menos de 2% de uma dose oral e a excreção fecal é um meio de eliminação menor. Os valores da meia-vida de eliminação $t_{1/2}$ para a Naltrexona e o 6-β-naltrexol são de 4 horas e 13 horas respectivamente. A Naltrexona e o 6-β-naltrexol são dose proporcionais em termos de AUC e $C_{máx}$ na faixa de 50 a 200mg e não acumulável após doses diárias de 100mg.

A terapia com Naltrexona não é adversa e não causa reação do tipo-dissulfiram mesmo como resultado do uso de opióide ou com a ingestão de álcool.

Posologia / Concentração usual

Na forma oral, um tratamento se inicia com uma dose de 25mg. Caso não apareçam sinais de abstinência, a dose deve ser aumentada para 50mg por dia. A dose de manutenção de Naltrexona é de 350mg por semana, sendo administrados 50mg diários.

Indicações e aplicações

Este medicamento foi prescrito como parte do programa de tratamento para alcoolismo ou dependência aos opióides.



Informações de Segurança

A utilização da Naltrexona pode provocar dificuldades para dormir, perda de energia, ansiedade, euforia, dor abdominal, náuseas, vômitos, perda de apetite, dor nas articulações e músculos e cefaléia. Doses elevadas de Naltrexona podem causar lesão hepatocelular.

Interações medicamentosas

Não foram realizados estudos para avaliar as possíveis interações medicamentosas da Naltrexona com outras substâncias que não os opióides. Consequentemente deve haver cuidado ao usar Naltrexona com outros medicamentos. A segurança e a eficácia do uso de Naltrexona e dissulfiram ao mesmo tempo são desconhecidas. Desaconselha-se o uso destes dois fármacos tóxicos para o fígado juntos, a não ser que os benefícios justifiquem os riscos. Letargia e sonolência foram relatadas após administração de tioridazina e Naltrexona. Os pacientes em tratamento com Naltrexona podem não se beneficiar de medicamentos contendo opióides, como os antitussígenos, preparações para gripes, antidiarreicos e analgésicos opióides. Em situações emergenciais quando houver necessidade de analgesia opióide em pacientes recebendo Naltrexona, a quantidade necessária do opióide pode ser maior que a usual, e a depressão respiratória resultante pode ser maior e mais prolongada.

Recomendações farmacotécnicas

Excipientes compatíveis: dióxido de silício, celulose microcristalina, lactose, estearato de magnésio vegetal, crospovidona, dióxido de titânio.

Insumo pertencente à Portaria 344/98 – ANVISA – Lista C1.

Informações de armazenamento

Verificar a informação no rótulo do produto.

Referências bibliográficas

http://www.2cristalia.com.br/arquivos_medicamentos/150/150_Revia_Bula_Paciente.pdf - último acesso: 18/07/2017.

Sweetman SC, et.al. Martindale – Guia Completo de Consulta farmacoterapeutica. Barcelona. 2ª Ed. 2005.

Última atualização: 18/07/2017