

METOCARBAMOL

DESCRIPCION

El metocarbamol es un relajante muscular, que se administra por vía oral y parenteral como adyuvante el tratamiento de condiciones musculoesqueléticas dolorosas y en el manejo del tétanos

Mecanismo de acción: el mecanismo exacto de la acción del metocarbamol no es conocida. A diferencia de otros bloqueantes neuromusculares, el metocarbamol no afecta la conducción nerviosa, ni a la transmisión neuromuscular ni a la excitabilidad muscular. Como ocurre en el caso del carisoprodol o de la ciclobenzaprina, tampoco tiene el metocarbamol un efecto directo sobre el músculo esquelético. Algunos autores suponen que la actividad relajante muscular del metocarbamol se debe a unos efectos depresores sobre el sistema nervioso central. En efecto la depresión del sistema nervioso en general origina una sedación y una reducción de los espasmos musculares, con una reducción del dolor y una mejoría de la movilidad de los músculos afectados. La reducción del dolor se debe, probablemente, a una alteración de la percepción del estímulo doloroso

Farmacocinética: el metocarbamol se puede administrar por vía oral, intramuscular e intravenosa. Después de su administración oral, se absorbe rápida y completamente produciendo unas concentraciones plasmáticas máximas a las 1-2 horas. Los efectos relajantes musculares se comienzan a observar a los 30 minutos después de la dosis oral. Cuando se administra intravenosamente, los efectos farmacológicos son observados inmediatamente. Una vez dentro de la circulación sistémica, el metocarbamol se distribuye ampliamente por todo el cuerpo. En los animales de laboratorio, las concentraciones más elevadas se detectan en el hígado y los riñones. Este fármaco es capaz de atravesar la barrera placentaria, si bien se desconoce si se excreta en la leche materna. En voluntarios sanos, el aclaramiento plasmático del metocarbamol oscila entre 0.2 y 0.8 L/h/kg, siendo la semi-vida de eliminación de 1 a 2 horas. En estos sujetos, el metocarbamol se une en un 46-50% a las proteínas del plasma El metocarbamol es extensamente metabolizado en el hígado por dealquilación e hidroxilación. El metocarbamol y sus metabolitos son extensa y completamente eliminados en la orina.

En los ancianos, la semi-vida de eliminación del metocarbamol aumenta ligeramente en comparación con los sujetos más jóvenes. Por otra parte, la unión a las proteínas del plasma se reduce ligeramente (41-43% frente a 46-50%). Sin embargo, no parece que sean necesarias reducciones en las dosis en estos pacientes

En los pacientes con insuficiencia renal, también se reduce el aclaramiento del metocarbamol. En 8 pacientes con insuficiencia hepática debida a una cirrosis alcohólica, la semi-vida de eliminación fue de 3.38 horas (± 1.62) en comparación con a 1.11 horas (± 0.27) en sujetos normales

El 8 pacientes con insuficiencia renal sometido a hemodiálisis de mantenimiento, el aclaramiento del metocarbamol se redujo en un 40% aunque la semi-vida de eliminación apenas fue alterada

Toxicidad: no se han llevado a cabo estudios de toxicidad a largo plazo para determinar el potencial carcinogénico del metocarbamol. Tampoco se han llevado a cabo estudios de mutagénesis

INDICACIONES

Tratamiento de los espasmos musculares asociados a condiciones musculoesqueléticas dolorosas

Administración oral

Adultos: se recomiendan inicialmente dosis de 1.5 g cuatro veces al día durante 2-3 días, aunque en algunos pacientes pueden ser necesarias dosis de hasta 8 g/día. Para una terapia de mantenimiento se recomiendan unas dosis de 4 a 4.5 g/día distribuidas en 3 a 6 dosis divididas

Administración parenteral

Adultos y niños > años: 1–3 g intravenosos o intramusculares administrados una vez al día durante 3 días. Repetir la administración si fuese necesario a las 48 horas. No inyectar a una velocidad superior a los 3 ml/min.

Niños de < 12 años: no se han establecido la eficacia y la seguridad del metocarbamol en esta población

Tratamiento del tétanos

Administración oral y parenteral:

Adultos: la dosis usual en adultos es de 1 a 2 g por vía intravenosa administrados a razón de 300 mg/minuto. Si fuese necesaria, se puede administrar una dosis adicional de 1 a 2 g hasta un máximo de 3 g. Las dosis de mantenimiento de 1 a 2 g se deben repetir cada 6 horas hasta que sea posible la colocación de una sonda nasogástrica. Los comprimidos de metocarbamol pueden ser entonces triturados y suspendidos en agua o salino para su administración a través de la sonda. Pueden ser necesarias dosis de hasta 24 g/día

Niños de > 12 años: la dosis inicial recomendada es de 15 mg/kg (equivalente a 500 mg/m²) por vía intravenosa cada 6 horas. La velocidad de la infusión no debe ser superior a los 300 ml/min. Las dosis de mantenimiento se pueden administrar por inyección i.v. directa o por infusión. Las dosis máximas no deben exceder 1.8 g/m²/día durante tres días consecutivos

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

No se recomienda la administración intravenosa o intramuscular a pacientes con insuficiencia renal debido a que la solución inyectable contiene propilenglicol, una sustancia irritante para los riñones. En el supuesto que dichas inyecciones fuesen imprescindibles durante más de 3 días, se

recomienda la realización de pruebas de la función renal, retirando inmediatamente el fármaco si se observase un empeoramiento de la misma.

El metocarbamol se debe administrar con suma precaución o, mejor aún, no administrar a pacientes epilépticos o con historia de convulsiones: el metocarbamol puede rebajar el umbral convulsivo.

El metocarbamol puede producir somnolencia y sedación, disminuyendo la capacidad del paciente para llevar a cabo tareas que requieren una plena atención, como el conducir vehículos o manejar maquinaria. Los pacientes tratados con metocarbamol debe ser advertidos de que el fármaco pueden reducir su nivel de alerta.

La administración de metocarbamol no es recomendable en pacientes muy ancianos debido a sus efectos anticolinérgicos y a la sedación y debilidad muscular que puede producir.

La extravasación de la solución intravenosa puede originar tromboflebitis, hematomas y dolor en el lugar de la inyección

El metocarbamol se clasifica dentro de la categoría C de riesgo en el embarazo. Aunque no se han registrado efectos adversos sobre la reproducción en el ser humano, no se han llevado a cabo estudios clínicos adecuados en mujeres embarazadas. Por lo tanto, no se recomienda el uso del metocarbamol en el embarazo a menos que fuese claramente indispensable.

Se desconoce si el metocarbamol se excreta en la leche humana por lo que no se recomienda su uso durante la lactancia

INTERACCIONES

El metocarbamol puede producir una sedación del sistema nervioso central que **puede resultar aditiva** cuando se administra con otros fármacos que son igualmente depresores del sistema nervioso central. Entre estos se incluyen los sedantes e hipnóticos, las benzodiazepinas, los barbitúricos, los agonistas opiáceos, el tramadol, los antidrepresivos tricíclicos, las fenotiazinas, el alcohol y los antihistaminicos de primera generación (p.ej. clorfeniramina, bromfeniramina, ciproheptadina, etc)

El metocarbamol puede interferir los efectos de la piridostigmina y de otros agentes inhibidores de la colinesterasa. Se recomienda precaución si de administra el metocarbamol a pacientes con miastenia grave que se encuentran bajo tratamiento con anticolinesterásicos

Igualmente, pueden producirse efectos sedantes aditivos si se combina el metocarbamol con plantas medicinales que tienen, a su vez, un efecto depresor sobre el sistema nervioso central, como por ejemplo la valeriana o el kava-kava. La suma de estos efectos puede afectar el estado de alerta de los pacientes.

El metocarbamol interfiere con las pruebas colorimétricas para la detección del ácido 5-hidroxiindolacético que utilizan como reactivo el nitrosonaftol. También interfiere en la detección del ácido vainillilmandélico en la orina por el método de Gitlow

REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas más frecuentes reportadas están relacionadas con los efectos farmacológicos del metocarbamol: somnolencia, mareos e incoordinación. También son relativamente frecuentes la visión borrosa, fiebre, cefaleas, náuseas y vómitos, tanto después de la administración oral como o parenteral. Después de la administración del metocarbamol por vía oral puede manifestarse anorexia.

Otros efectos adversos son diplopía, dispepsia, sofocos, hipotensión, sabor metálico, nistagmo, bradicardia sinusal, vértigo y síncope, reacciones adversas que pueden tener lugar tanto después de la administración intravenosa como de la oral. La mayoría de los pacientes con síncope inducido por el metocarbamol se recuperan con un tratamiento de soporte, pero ocasionalmente son necesarios la administración de epinefrina, corticoides o antihistamínicos.

Se han comunicado casos de íleon adinámicos en pacientes tratados con dosis de 10 g de metocarbamol por vía oral. También se han desarrollado alergias representadas por conjuntivitis, congestión nasal, rash, prurito y urticaria en algunos pacientes tratados con metocarbamol y, en algunos casos se han desarrollado reacciones anafilácticas después de inyecciones intramusculares o intravenosas.

La inyección intramuscular de metocarbamol puede causar molestias en el lugar de la inyección (irritación local, dolor), mientras que la inyección intravenosa puede resultar en flebitis, moraduras o dolor en el punto de la inyección. La inyección intravenosa puede ocasionar una cierta hemólisis, con aumento de la hemoglobina y de los eritrocitos en la orina. Raras veces se han descrito leucopenia.

Aunque no se ha establecido con toda certeza una relación causa-efecto, se han descrito ocasionalmente convulsiones después de la administración de metocarbamol

PRESENTACIONES

Robaxin comp. 500 mg. IPSEN

REFERENCIAS

1. Chou R, Peterson K, Helfand M. **Comparative efficacy and safety of skeletal muscle relaxants for spasticity and musculoskeletal conditions: a systematic review.** J Pain Symptom Manage. 2004 Aug;28(2):140-75
2. Sica DA, Comstock TJ, Davis J, Manning L, Powell R, Melikian A, Wright G. Pharmacokinetics and protein binding of methocarbamol in renal insufficiency and normals. Eur J Clin Pharmacol. 1990;39(2):193-4

Monografía revisada el 14 de enero de 2011. Equipo de Redacción de IQB