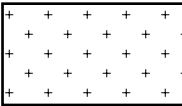


NUEVAS DROGAS: ERENUMAB



CLASE FARMACOLÓGICA

N02CX07: Sistema Nervioso. Analgésicos. Preparaciones contra la migraña.

Otras preparaciones contra la migraña. Erenumab.

CARACTERÍSTICAS ORGANOLÉPTICAS Y CONSERVACIÓN

CONSERVACIÓN: de 2 a 8° C. Proteger de la luz hasta el momento de usarlo.

Si se retira de la heladera debe mantenerse a temperatura ambiente controlada (inferior a 25°C) en su envase original y debe usarse en un plazo de 14 días. Si ha estado más de 14 días a temperatura ambiente hay que desecharlo. No congelar. No agitar.

ACCIÓN FARMACOLÓGICA

Antimigrañoso

MECANISMO DE ACCIÓN

Erenumab es un anticuerpo monoclonal humano que se une al receptor del péptido relacionado con el gen de la calcitonina (CGRP) impidiendo la unión del ligando interno.

EL CGRP es un péptido de 37 aminoácidos que se expresa tanto en el sistema nervioso central como periférico. Es uno de los más potentes vasodilatadores conocidos y parece representar un papel en la modulación de la nocicepción y en la patogénesis de la migraña, localizándose en lugares que son relevantes en la fisiopatología de ésta, como el ganglio trigeminal. A diferencia de otros neuropéptidos, se ha observado que los niveles de CGRP aumentan considerablemente durante la migraña y se normalizan con el alivio de la cefalea. Además, la infusión intravenosa de CGRP induce en los pacientes una cefalea de tipo migrañoso.

Erenumab compite de forma potente y específica por la unión del CGRP, inhibe su función intravenosa de CGRP y no tiene una actividad significativa sobre otros receptores de la familia de las calcitoninas.

INDICACIÓN

Profilaxis de la migraña en adultos con al menos cuatro días de migraña al mes.

DOSIS

La dosis recomendada es de 70 mg de erenumab cada 4 semanas, aunque algunos pacientes pueden beneficiarse de una dosis de 140 mg cada 4 semanas.

VÍAS DE ADMINISTRACIÓN

Erenumab se administra por vía subcutánea, y está pensado para ser autoadministrado por el paciente tras recibir la formación adecuada. Las inyecciones también las puede

administrar otra persona, que haya sido formada adecuadamente. La inyección se puede administrar en el abdomen, muslos o en la zona externa de la parte superior de los brazos.

Se deben alternar los lugares de inyección y las inyecciones no se deben administrar en zonas donde la piel sea sensible, está dañada, enrojecida o endurecida.

La eliminación del medicamento no utilizado y de todos los materiales que hayan estado en contacto con él se realizará de acuerdo con la normativa local.

FARMACOCINÉTICA

Erenumab presenta una cinética no lineal como resultado de su unión al receptor CGRP. Sin embargo, a las dosis habituales la farmacocinética tras su administración SC cada 4 semanas es predominantemente lineal debido a la saturación de la unión al receptor.

ABSORCIÓN

Tras la administración SC de una dosis única de 140 mg de erenumab a individuos sanos se alcanzan concentraciones máximas a los 4-6 días, con una biodisponibilidad del 82% y un tiempo para alcanzar el estado estacionario de 12 semanas. Las concentraciones máximas alcanzadas tras dosis de 70 mg o 140 mg una vez al mes se sitúan en 6,1 y 15,8 mcg/ml.

DISTRIBUCIÓN

Tras la administración de una dosis de 140 mg por vía intravenosa, la media del volumen de distribución durante la fase terminal fue de 3,86 L (DE 0,77 L).

BIOTRANSFORMACIÓN

Se observaron dos fases de eliminación para erenumab.

A concentraciones bajas, la eliminación se lleva a cabo principalmente por unión saturable a la diana (CGRP-R), mientras que a concentraciones más elevadas la eliminación de erenumab se produce principalmente a través de una vía proteolítica no específica. Durante el período de administración erenumab se elimina principalmente a través de una vía proteolítica no específica con una semivida de eliminación efectiva de 21-28 días.

Ya que erenumab es una inmunoglobulina IgG2 de gran tamaño (aprox. 150 kdalton) es previsible que su eliminación inalterada por la orina sea mínima.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

Sobre la base de las vías metabólicas de los anticuerpos monoclonales, no se espera que la administración concomitante de otros medicamentos tenga ningún efecto sobre la exposición.

En voluntarios sanos no se observó interacción con sumatriptán ni con anticonceptivos orales.

ADVERTENCIAS

- **EMBARAZO:** En embarazo, los datos son limitados. Los estudios en animales no sugieren efectos perjudiciales directos en términos de toxicidad para la reproducción pero se desconoce su efecto en humanos. Como medida de precaución es preferible evitar su uso durante el embarazo.
- **LACTANCIA:** Se desconoce si se excreta a la leche materna. Se sabe que las IgG humanas se excretan a la leche materna durante los primeros días después del parto, y disminuyen rápidamente a concentraciones bajas, por ello, no se puede excluir el riesgo para el lactante durante este período de tiempo corto. Posteriormente, durante la lactancia podría considerarse su uso sólo si fuera clínicamente necesario.
- **PEDIATRÍA:** En pediatría, no se ha establecido el perfil de seguridad y eficacia de erenumab en niños menores de 18 años.
- **ANCIANOS:** en mayores de 65 años, erenumab no ha sido ensayado. Sin embargo, se considera que no es necesario ningún ajuste de la dosis ya que la edad no afecta a la farmacocinética de erenumab.
- **OTROS:** no es necesario ajuste de dosis en insuficiencia hepática ni renal.

EFFECTOS COLATERALES O ADVERSOS

Las reacciones adversas observadas con mayor frecuencia durante el desarrollo clínico fueron reacciones en el lugar de inyección, estreñimiento, espasmos musculares y prurito.

CONTRAINDICACIONES

Erenumab está contraindicado en hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes. Debe extremarse la precaución en pacientes con enfermedades cardiovasculares graves, ya que estos pacientes se excluyeron de los ensayos clínicos.

SÍNTOMAS DE SOBREDOSIS

No se han registrado casos de sobredosis en los ensayos clínicos. En dichos ensayos se administraron dosis de hasta 280 mg por vía subcutánea sin que hubiera indicios de toxicidad limitante de la dosis.

En caso de sobredosis, el paciente debe recibir un tratamiento sintomático y deben instaurarse las medidas de apoyo que sean necesarias.

PRESENTACIÓN

Cada envase contiene 1 Lapicera precargada (autoinyector) de 70 mg/ml.

CONDICIONES DE EXPENDIO

Venta bajo receta

BIBLIOGRAFIA

Tratamiento de la migraña. INFAC. Vol. 26 (9) 2018

Disposición 43/2019

Erenumab: First Global Approval. Drugs 78 (11): 1157-1161 (2018).

Jain, Sameer, *et al.* Erenumab in the treatment of migraine. Pain management. 8 (6): 415-426 (2018).

ÚLTIMA REVISIÓN: JUNIO DE 2019