AGONISTAS DE LOS RECEPTORES DE SEROTONINA 5HT-3

Tienen potentes propiedades antieméticas, mediadas en parte por el bloqueo central del receptor 5-HT3 en el centro del vómito y la zona emetógena de quimiorreceptores, pero principalmente a través del bloqueo de los receptores 5-HT5 periféricos o los nervios vagales intestinales extrínsecos y los aferentes medulares.

Alosetrón

Antagonista del receptor 5-HT3, aprobado para el tratamiento de los pacientes con síndrome del intestino irritable (IBS) grave con diarrea.

Se absorbe con rapidez en el tubo digestivo, tiene una biodisponibilidad de 50 a 60% y una semivida plasmática de 1.5 horas pero su efecto tiene una duración mucho más prolongada. Se metaboliza en el hígado y se excreta a través del riñón.

Efectos adversos: se asocia a efectos secundarios infrecuentes pero importantes en el tubo digestivo. Se presenta estreñimiento hasta en 30% de los pacientes con IBS con predominio de la diarrea.

Tratamiento en mujeres con IBS grave en quienes la diarrea es el síntoma predominante. Dosis 1 mg cada 12 o 24 horas, disminuye el dolor hipogástrico relacionado con IBS.

Ondansetrón, Granisetrón y Dolasetrón

Tienen una semivida sérica de cuatro a nueve horas y pueden administrarse una vez al día por vía oral o intravenosa.

Los tres fármacos tienen una eficacia y tolerabilidad equiparables cuando se administran en dosis equipotentes. •

Fármaco intravenoso más nuevo que tiene más afinidad por el receptor de 5-HT3 y una semivida sérica prolongada de 40 horas.

Palonosetrón

Se metabolizan en el hígado y se excreta a través del riñón y del hígado.

Efectos adversos: fármacos bien tolerados, tienen características de seguridad excelentes. Los efectos adversos más a menudo incluyen cefalea, mareos y estreñimiento. Los cuatro compuestos producen prolongación leve pero estadísticamente significativa del intervalo QT, pero ésta es más acentuada con el dolasetrón.