

9/2/99

TEMA 1:

"ASPECTOS GENERALES DE LA FARMACOLOGÍA"

FARMACOLOGÍA:

Parte de la medicina que estudia los compuestos químicos y su relación o interacción con los organismos vivos.

Esta relación sirve para conocer las enfermedades y su diagnóstico, pronóstico y tratamiento.

Los Fármacos son estas sustancias químicas que interaccionan con los organismos vivos, y de esta interacción vienen los efectos farmacológicos, que son las acciones que producen los fármacos dentro del organismo. Esas acciones pueden ir dirigidas a variar una situación global del individuo o a un órgano o sistema del mismo.

Fármaco y Medicamento:

Medicamento es una sustancia química que introducida en el organismo tiene como única y exclusiva finalidad producir un efecto beneficioso en el organismo. Para que un fármaco se considere medicamento se necesita:

- Que esté bien indicado (una enfermedad concreta, un fármaco concreto).
- Que esté bien dosificado.
- Que no esté contraindicado.

Clasificación de los Fármacos:

Todo fármaco recibe un número de código que le identifica. Todo fármaco tiene:

- Un nombre Químico (4-acetilparacetamol).
- Un nombre Genérico (Paracetamol).
- Un nombre Comercial (Gelocatil).

Forma de los Fármacos:

Depende de la vía de administración: Grageas, Pastillas, Solución, Pomadas.....

Farmacocinética:

Parte de la farmacología que estudia las vías de absorción (oral, siempre que no tenga contraindicación), distribución (sangre), metabolismo (hígado) y vías de excreción (riñón) del fármaco en el organismo.

Farmacodinámica:

Comportamiento o movimiento del fármaco en el interior del organismo: ¿cómo entra? ¿cómo se distribuye? ¿cómo actúa al llegar al lugar de acción?

Terapéutica:

Es el Arte de curar las enfermedades.

– Farmacológica.

– Sustitutiva: cuando falla una función puntual en el organismo (insulina).

– Física: corregir parte del organismo que no sea un órgano (fisioterapia).

– Bromatológica: dietas para corregir carencias, dar reposo a múltiples estructuras, ayudar a otros tipos de terapéutica....

– Ejercicio Físico.

– Social: el apoyo a menudo es más efectivo que cualquier medicamento.

Toxicología:

Parte de la farmacología que estudia los tóxicos y venenos.

– Tóxico: Toda sustancia química que introducida en el organismo modifica el comportamiento global del mismo o bien de un órgano, de forma leve y fácilmente corregible (alcohol).

– Veneno: Toda sustancia que introducida en el organismo modifica el comportamiento de una forma severa conduciendo incluso a la muerte del individuo o una estructura del mismo (estricnina).

HISTORIA DE LA FARMACOLOGÍA:

– Farmacología Antigua (hasta Edad Media).

– Farmacología Moderna.

La antigua se basaba en la observación. En la moderna surgen 2 personajes: Paracelso y Maimonides.

CLASIFICACIÓN DE FÁRMACOS:

– Fármacos Naturales:

Sustancias químicas que se obtienen directamente de los productos de la naturaleza (opio, insulina).

– Fármacos Semisintéticos:

Sufren químicamente pequeñas variaciones en su estructura natural para conseguir buenos efectos terapéuticos y reducir los efectos no deseados.

– Fármacos Sintéticos:

Se obtienen íntegramente en laboratorio a partir de moléculas de origen natural, y conservan la acción

terapéutica, pero los efectos no deseados están disminuidos o desaparecidos.

– Fármacos por Ingeniería Química:

Son específicos. Van directamente a corregir un problema terapéuticos (antibióticos y antineoplásicos).

– Hemorragia Digestiva Alta: * Vómitos Sangre.

* Melenas.

– Hemorragia Digestiva Baja: * Heces Cardenalicias.

* Sangre Rutilante (roja).

* Melenas (Excepcionalmente).

EFFECTOS O ACCIONES FARMACOLÓGICAS:

Todas aquellas situaciones a que va encaminada la administración beneficiosa de un fármaco a un organismo vivo. Hay 2 grandes bloques de administración:

– Acciones Terapéuticas: buena administración de sustancias para obtener una buena respuesta del organismo o un órgano del mismo.

– Efectos No Deseados: todas aquellas situaciones que aparecen cuando se administra una sustancia química con finalidad terapéutica, estando el fármaco bien dosificado y no estando contraindicado. Debe excluirse de esta definición los no terapéuticos, administrados con fines lesivos o suicidas.

*** Patología Yatrógena:** 1 ó 2 efectos no deseados.

*** Enfermedad Yatrógena:** más efectos no deseados (intervención).

CRITERIOS PARA LA ADMINISTRACIÓN DE FÁRMACOS:

– Experimental: No puede salir al mercado si no se ha seguido un estudio meticuloso a través de experimental y otra clínica.

– Farmacológico: Se ha de conocer el paciente, que no tenga alergias al medicamento.

– Clínico: Si no se sabe qué tiene el enfermo, no se puede aplicar un tratamiento adecuado.

EVOLUCIÓN DE SUSTANCIA QUÍMICA A MEDICAMENTO:

Hay 2 bloques de estudio:

– Toxicidad Aguda.

1) Experimentación con Animales: – Toxicidad Subaguda.

- Toxicidad Crónica.
- Farmacocinética.
- Fase 1: Estudio Farmacológico Puro.

2) Estudios en Humanos: – Fase 2: Estudio Clínico Restringido.

- Fase 3: Estudio Clínico Amplio.

1) EXPERIMENTACIÓN CON ANIMALES:

– Toxicidad Aguda (intravenosa):

Se administra dosis y se determina cual es el bloque donde fallecen el 50% de los animales. A partir de esta dosis (parámetro = Dosis Letal 50%), siempre hacia abajo administraremos dosis progresivamente decrecientes .

– Toxicidad Subaguda (oral):

Se sacrifican animales. Al decrecer dosis, ya no mueren tantos. Se usa para ver qué lesiones se provocan en las estructuras farmacocinéticas (distribución, metabolismo y excreción = sangre, hígado, riñón).

– Toxicidad Crónica (múltiples vías):

Se sacrifica animal y se estudia de punta a punta. Se hacen gran cantidad de bloques de raza y animales. Se estudian por periodo de tiempo, para ver si hay afectación global del organismo. Una vez hecho esto se pasa al estudio en humanos, pero todavía queda el concepto de Farmacocinética.

16/2/99

2) ESTUDIOS EN SERES HUMANOS:

– Fase 1. Estudio Farmacológico Puro:

El fármaco se estudia:

- 1º) En centros restringidos y controlados.
 - 2º) Personal cualificado (farmacólogos).
 - 3º) Se emplea sobre personas sanas.
 - 4º) Los voluntarios que se someten a estos estudios no deben ser coaccionados (económica o socialmente).
- Se ha de hacer con dosis muy bajas al principio y progresivamente crecientes.
 - Interesa en esta fase ver los efectos no deseados (no el efecto terapéutico).

– Fase 2. Estudio Clínico Restringido:

- 1º) Estudio clínico en pacientes en muy pocos centros y en muy pocas manos.

2º) Se hace en centros hospitalarios con una enfermedad concreta.

3º) Los que realizan estos estudios son aplicadores de los conocimientos que se han adquirido de la anterior fase.

– Se busca el efecto terapéutico y los efectos no deseados.

– Fase 3. Estudio Clínico Amplio:

1º) El estudio se hace en varias zonas de un mismo país, en varios países de un mismo continente y en varios países de diferentes continentes, porque las diferentes etnias, alimentaciones, ritmo de vida....etc. varían la acción farmacológica de las sustancias químicas.

2º) Se estudia en enfermos.

– Se busca el efecto terapéutico. Los efectos no deseados los detectamos por el paso del tiempo.

Características que han de tener los Estudios:

– Objetivo Claro.

– Materiales y Metodología Correctos.

– Los Estudios en Humanos han de ser Sistemáticamente Reproducibles.

ACCIÓN FARMACOLÓGICA:

1– Efectos Terapéuticos.

2– Efectos No Deseados.

2– EFECTOS NO DESEADOS:

En farmacología es más importante que un fármaco no haga daño que que haga bien.

1– Efectos producidos por el propio Fármaco:

– Efectos Colaterales:

Son los que se derivan de la propia acción farmacológica (y dentro de la farmacológica, la terapéutica) del fármaco. Son fácilmente previsibles, solucionables y con crean nunca enfermedades graves al individuo.

– Efectos Secundarios:

Son los producidos por la acción del propio fármaco por hiperacción del mismo. Aquí nos encontramos con la Enfermedad Yatrógena. Efectos severos. No aparecen con frecuencia.

*** Nota:** Hiperacción de un antibiótico sobre una bacteria (Herx Heiner).

– Efectos por Sobredosis:

*** Con Dosis Correcta:** Se produce porque los mecanismos de metabolismo o eliminación del fármaco están

alterados.

* **Con Dosis Incorrecta:** Dependencia Física ("tomo el fármaco para no encontrarme mal" y Psíquica ("tomo el fármaco para encontrarme bien")

2- Efectos producidos por el propio Organismo.

- Síndrome de Hipersensibilidad:

Reacción Cuantitativamente diferente a la que se esperaba cuando se administra un determinado fármaco.

- Idiosincrasia:

Reacción Cualitativamente diferente a la que se esperaba cuando se administra un determinado fármaco.

- Alergia:

Reacción Cuantitativa y Cualitativa diferente a la que se esperaba. No confundir con Toxicidad. Se diferencian en que :

1º) La Alergia afecta a un núcleo de población muy restringido y la Toxicidad a uno muy amplio.

2º) Para que haya una Reacción Alérgica se puede precisar una dosificación muy pequeña (desconocida) y en la Toxicidad esta dosificación se conoce.

3º) Cuando una sustancia productora de Alergia es una Proteína siempre aparecen Anticuerpos Circulantes. En la Toxicidad no aparecen.

Tipos de Alergia:

* **Inmediata:** Se produce inmediatamente después al contacto del Antígeno con el Anticuerpo. La Anafilaxia es la Alergia en grado superlativo.

* **Tardía:** Se produce después de un Contacto Persistente de la sustancia que produce la alergia con el organismo.

* **Cruzada:** Por ser alérgico a una sustancia se puede ser alérgico también a otras sustancias de la misma familia.

FACTORES QUE INFLUYEN EN LA EFECTIVIDAD Y SEGURIDAD DE ADMINISTRACIÓN DE LOS FÁRMACOS:

Estas acciones van encaminadas a:

– Mejorar la Acción Terapéutica.

– Reducir los Efectos No Deseados.

- SINERGISMO:

Busca juntar 2 o más fármacos para que tengan la misma acción terapéutica y un mínimo de efectos no deseados, con la particularidad de que estos fármacos que se administran conjuntamente han de tener juntos la

misma acción terapéutica que uno de ellos administrados de forma aislada.

– **Sumación:**

Se coge 1/2 dosis de cada uno y tiene el efecto terapéutico, pero no tiene efectos no deseados. Tenemos entonces los efectos terapéuticos que hubiera producido uno, pero sin los efectos no deseados. (dibujo 1)

– **Potenciación:**

En la potenciación buscamos aumentar los efectos terapéuticos dejando de lado los efectos no deseados. Esto se consigue:

- Aumentando Velocidad de Absorción.
- Cuando los fármacos llegan a la sangre se unen a las proteínas plasmáticas. El fármaco potenciador libera el fármaco potencial, aumentando la parte libre y por tanto, la acción terapéutica.
- Si se produce bloqueo de la eliminación de sustancias químicas a nivel renal (siempre que ésta sea una sustancia química que no se metabolice), al no eliminarse, aumenta el tiempo de permanencia de fracción libre y por tanto aumenta su acción farmacológica. (dibujo 2)

23/2/99

– **Acumulación:** Se da cuando se administra el fármaco repetidamente por encima de la vida media del fármaco, o bien aparece acumulación cuando están alterados los mecanismos de metabolismo y/o excreción farmacológica. La Intoxicación del individuo es la consecuencia de la Acumulación.

– **Tolerancia Farmacológica:** Circunstancias en que deba aumentar progresivamente la dosis de un fármaco para obtener el mismo efecto terapéutico.

– **Taquifilaxis:** Tolerancia aparecida rápidamente.

REGLAS DE ADMINISTRACIÓN DE LOS FÁRMACOS:

- 1º) Identificar al Individuo al que vamos a administrar el fármaco.
- 2º) Identificar el Fármaco que se administra. Conocer sus características, vía de administración....
- 3º) Dar Pauta correcta de Dosis y Horario.
- 4º) Preguntar por Alergias antes de administrar el fármaco.

TEMA 2

"FARMACODINAMICA"

Cuando se administra un fármaco, para que pueda ejercer su acción farmacológica y convertirse en medicamento, hemos de conocer:

- El Fármaco en sí.
- El Organismo al que se administra.

La sustancia penetra en el organismo, se distribuye por el mismo y llega al lugar donde ejercerá su acción. Para ejercer la acción terapéutica debe unirse a la célula. En ella hay unos Componentes a nivel de Membrana (superficiales), Protoplasma (intermedios) y Núcleo (de profundidad) que se llaman Receptores. Los Receptores son aquellas estructuras macromoleculares – celulares, que al unirse con una sustancia química forman el Complejo Fármaco – Receptor.

Este Complejo Fármaco– Receptor es el que tendrá la capacidad de Acción Farmacológica. Si no se forma este complejo no hay capacidad terapéutica (si la hay de intoxicación o envenenamiento). La unión receptor–fármaco puede ser una unión reversible o irreversible. Generalmente esta unión es reversible. Lo habitual es que para cada fármaco específico, haya receptores específicos.

Los Aceptores o Receptores Silenciosos son complejos fármacos–receptores sin capacidad de acción farmacológica. Estos Aceptores se encuentran a nivel de las Proteínas Plasmáticas y de la Grasa Corporal.

AFINIDAD – EFICACIA:

Afinidad:

Es la capacidad de una sustancia química de unirse a un Receptor y formar el Complejo Fármaco – Receptor. Si no hay Afinidad no hay Acción Farmacológica.

Eficacia:

Capacidad del Complejo Fármaco–Receptor de producir la Acción Farmacológica.

POTENCIA FARMACOLÓGICA:

Es la Capacidad de Acción Farmacológica por Unidad de Peso. La potencia entre 2 o más fármacos viene condicionada (se compara) por las dosis que producen el mismo efecto y no por los efectos producidos por la misma dosis (dibujo 3).

FÁRMACOS AGONISTAS Y ANTAGONISTAS:

Agonistas:

Son aquellos que tienen idéntica capacidad de acción farmacológica. Todos los analgésicos son agonistas, los hipnóticos también....etc.

Antagonistas:

Son los que tienen afinidad pero no tienen eficacia. Sus objetivos son contrapuestos.

1) Antagonismo Farmacológico:

Dos sustancias químicas compiten por el mismo receptor. Por esto se llama antagonismo competitivo. Una de las sustancias químicas bloquea la otra. (dibujo 4)

2) Antagonismo Fisiológico:

Dos sustancias químicas ocupan sus respectivos receptores, pero sus acciones terapéuticas son contrapuestas. (dibujo 5)

La sustancia B, por tener acción contraria a la A, anula la acción terapéutica (aunque sí que puede haber efectos no deseados).

3) Antagonismo Químico:

Es aquel caso excepcional en que no hay afinidad ni eficacia. En estos casos el antagonismo sucede en el torrente circulatorio y es específico de las Intoxicaciones.

TEMA 3

"FARMACOCINÉTICA"

1– Absorción.

2– Distribución.

3– Metabolismo.

4– Excreción.

Para que una sustancia química penetre en el organismo, depende de:

1– El Fármaco en sí.

2– Barreras de entrada al Organismo:

*** Barreras Externas:** – Parenterales

– No Parenterales (piel y mucosas).

*** Barreras Internas:** Intravascular, Intersticial, Intracelular.

Todas las paredes celulares son de estructura lipóidea. Las sustancias químicas, cuanto más liposolubles, más fácil es de atravesar la barrera.

Difusión: Paso de sustancias de mayor a menor concentración. Esto depende del Movimiento Browniano (movimiento de las moléculas) y de la Concentración. Liposolubles.

Filtración: El paso se produce por Porosidad. Las sustancias Hidrosolubles pasan a través de los poros. El paso depende del tamaño de las sustancias (que no sea superior al de los poros).

Pinocitosis: Fagocitosis de sustancias pequeñas.

1– ABSORCIÓN DE FÁRMACOS:

A) Oral.

B) Gastrointestinal.

C) Rectal.

A) ORAL:

– Via Sublingual:

Importante por la gran vascularización sublingual y por su la gran humedad de la región. Vía rápida de absorción farmacológica, con prácticamente nulos efectos locales, y puede ser una vía de auténtica urgencia o de urgencia diferida.

B) GASTROINTESTINAL:

Ventajas:

- Automedicación.
- Si nos pasamos de dosis, se puede extraer con Lavado Gástrico.
- Cómoda Administración.

Inconvenientes:

- Presencia de Ácido Clorhídrico.
- Presencia de alimentos retrasa el paso al intestino, y por tanto, la absorción.
- Si hay un retraso de vaciado gástrico el fármaco puede quedar inactivado.

Cuando un fármaco pasa a intestino, toda enfermedad inflamatoria intestinal y/o toda disfunción biliar o pancreática puede alterar seriamente la absorción del fármaco.

C) RECTAL:

Vía antinatural. Es frecuente la Proctitis (inflamación del recto) por supositorios o enemas. Produce síntoma muy incómodo llamado Tenesmo (después de defecar se tiene la sensación de vaciado incompleto). Es Yatrógena.

La Ampolla Rectal tiene 3 zonas:(dibujo 6)

Los fármacos que van a Vena Cava Inferior, van luego a Vena Cava Superior y no sufren Efecto Primer Paso.

2/3/99

ABSORCIÓN DE FÁRMACOS:

- Via Parenteral.
- Via No Parenteral.

VIA PARENTERAL:

Medida imprescindible en esta vía es la Asepsia. Hay múltiples vías:

Subcutánea:

Hay 2 características que condicionan la correcta absorción:

1- Vascularización de donde se administra.

2- Solubilidad del preparado.

Cuanto más vascularizada sea la zona más rápida será la absorción. Los fármacos hidrosolubles pasan más fácilmente que los liposolubles. Los fármacos liposolubles se han de administrar muy lentamente para no formar quistes asépticos.

Es bueno cambiar la zona de administración para no formar lipólisis local (insulina). Para favorecer la rapidez, la fricción local o calor local creará vasodilatación y la absorción será más rápida.

Si administramos una sobredosis el frío enlentece la absorción. No administraremos nunca fármacos sobre lesiones cutáneas (psoriasis).

Intramuscular:

Todos los músculos son susceptibles de recibir fármacos. La zona más habitual es el glúteo, muslo y deltoides. La gran vascularización permite la gran rapidez de absorción. Evitar inyección directa. Es una vía dolorosa, se junta con anestésico. Cuando se administra muy rápido puede causar desgarro.

Intraperitoneal:

Se utiliza poco. Es casi tan rápida como la Intravenosa por el contacto directo de la sustancia con los vasos y muy vascularizada. Se emplea en experimentación animal. Su ventaja es la rapidez de absorción y la desventaja es peritonitis y perforación de asas. Es una vía incómoda pero no dolorosa.

Intrapleural:

Es una cavidad virtual. Sólo se emplea en fases infecciosas intrapleurales con gérmenes rebeldes al tratamiento pleural debido a la dificultad del paso de las sustancias por paquipleuritis o pneumotórax. Se emplea para producir adherencia entre las dos pleuras debido a un pneumotórax. Las adherencias se llaman Sinequias. La segunda sustancia que lo produce son las Tetraciclinas y los Polvos Talco.

Intravascular:

Hay varias:

- Intravenosa:

Vía de urgencia. Administrar gran cantidad de fármacos. No deben ser irritantes para la vena (flebitis). Si tiene malas venas se buscan 2 vías. Si nos pasamos de dosis no podemos hacer nada. Podemos crear un shock por velocidad (Marx Hermer: Intoxicación aguda por administración rápida. Es por esto que se deben administrar con lentitud. Cualquier vena es buena, pero el catéter ha de ser el adecuado según el calibre de la vena.

- Intraarterial:

Se utiliza tanto con fines terapéuticos como diagnósticos. Con fines terapéuticos para lesión localizada que

queremos destruir (tumores en hígado). Con fines diagnósticos las arteriografías (sustancia de contraste). Es imprescindible que el contraste no produzca alergia al paciente. Siempre es bueno tener una embolada de Cortisona.

– Intracardiaca:

Vía de urgencia para reanimar.

– Intralinfática:

Parecida a la Intraarterial. Se emplea rara vez para terapéutica y sí que se emplea para radiodiagnóstico (linfografía).

Intraósea:

Se realiza en el Esternón. Sólo se emplea en procesos locales muy definidos. Se realiza en procesos contadísimos. Se puede administrar un volumen masivo de líquido y salva muchas vías.

Intraarticular:

Se usa en reumatología y traumatología como vía terapéutica y diagnóstica. La asepsia debe ser como en quirófano, porque es una cavidad cerrada. Se administra sustancias generalmente como corticoides, antibióticos, analgésicos... y para extraer líquidos intraarticulares para fines diagnósticos y/o eliminar la presión (hídrartrosis, hemartrosis).

Intrarraquídea:

Usada a diario para producir raquianestesia en pacientes aprensivos a la anestesia general y por cardiovascularización?? . El inconveniente es que en grandes cirugías no puede ser administrada por el tiempo.

Administración de Fármacos por Volumen Controlado:

- Pacientes con válvulas subcutáneas que van liberando insulina.
- Catéter que introduce analgésicos para neoplasias.
- Palillos subcutáneos como anovulatorios.

VÍA NO PARENTERAL:

Vía Digestiva (Sublingual y Rectal):

El inconveniente es que la ampolla rectal tenga heces. Por lo tanto, el fármaco quede incrustado sin hacer la acción farmacológica. Cuando hay trombosis hemorroidal, fisura anal, debe evitarse la administración. Mirar libro.

Conjuntiva:

Igual a la vía sublingual. Han de ser fármacos no irritantes con Ph neutro, para evitar conjuntivitis secundarias. Exclusiva para tratamiento oftalmológico.

Respiratoria:

Extraordinaria por la gran velocidad de absorción y eliminación farmacológica. Por el gran volumen de fármacos que se pueden administrar (02 por ejemplo). Han de ser no irritantes, a temperatura adecuada para evitar bronquitis. Fármacos de acción local (aerosoles y nebulizadores). Favorecen la aparición de mucosas.

Urinaria:

La uretra se comporta como cualquier tipo de mucosa. Sólo se emplea para tratamientos locales. Es antinatural. La vejiga urinaria se comporta como la piel: difusión de sustancias liposolubles e impermeables a hidrosolubles. Las sustancias liposolubles deben ser administradas para neoplasias con profundidad.

Vaginal:

Mucosa húmeda. Vía excelente para absorción de sustancias liposolubles (atacar lesiones perivaginales). Vía no habitual. Locales.

Cutánea:

No permite la salida ni entrada de líquidos. Un quiste sebáceo se produce por taponamiento de glándulas sebáceas. Se administran sustancias liposolubles. Cuanto más superficial es la lesión cutánea, más hidrosoluble ha de ser el fármaco, y al revés. Para que la absorción sea más rápida debemos friccionar. Poner capa fina. Calor local para reacción rápida.

9/3/99

2- DISTRIBUCIÓN DE FÁRMACOS

Pasan del Espacio Extracelular (Intravascular e Intersticial) al Intracelular.

1- En el espacio Intravascular se encuentran las Proteínas. Para que el Fármaco tenga una buena distribución han de coger las Proteínas Plasmáticas a través de unos Receptores.

Toda circunstancia que altere el contenido proteico altera la vehiculización de los fármacos. En caso de Hiperproteinemia (Albumina) se han de aumentar las dosis para producir el mismo efecto farmacológico. En los casos de Hipoproteinemia se deben disminuir las dosis para evitar efectos no deseados. Si mantenemos una dosificación estándar en un caso de Hipoproteinemia tendremos efectos secundarios a la 2ª, 3ª dosis (enfermedades hepáticas crónicas).

2- Si los receptores están bloqueados por la sustancia química tendremos efectos no deseados.

3- En Intracelular (Grasa Corporal) las sustancias quedan bloqueadas. Queda en forma de depósito a nivel graso y no llega a nivel celular. Hay que dar una dosis adecuada para cuando se liberen las sustancias de las grasas no produzca efectos no deseados. En personas muy obesas aumentar la dosis, en delgadas disminuir.

4- Barreras Naturales. Hay 2:

– Placenta: No permite el paso de sustancias tóxicas, pero algunas pasan y producen malformaciones en la descendencia (Teratogenia).

– Hematoencefálica: El cerebro es una sustancia lipoidea protegida por una barrera natural: la Barrera Hematoencefálica. Se compone de los capilares y la glía (células gliales). Es muy resistente al paso de las

sustancias (hidrosolubles y liposolubles) desde la sangre al SNC para que no se afecte la estructura general. El mecanismo por el que pasan los fármacos es por Difusión Simple y Transporte Activo.

Tanto en un caso como en otro, la fracción de medicamento en sangre que atraviesa tanto la BHE como la Placentaria es única y exclusivamente la fracción libre de éste.

3- METABOLISMO:

Capacidad del organismo de transformar los fármacos mediante:

- Alterar o transformar capacidad de acción farmacológica.
- Permitir la eliminación de los fármacos.

La alteración está determinada por:

- Bioinactivación: transformar un fármaco activado en metabolitos inactivos, los cuales se transforman de liposolubles a hidrosolubles (en hígado) para poder ser eliminados por el riñón.

- Bioactivación: hay fármacos que no tienen capacidad de acción farmacológica (si químicamente los activados no tendrían vías de absorción ya que producirían lesiones severas locales). Se llaman pro-fármacos, no tienen capacidad de acción farmacológica, sólo la tendrán cuando en el interior del órgano sufran una transformación. El hígado es el responsable de transformar esta sustancia en metabolito o fármaco activo.

Fármaco Activo: hace su acción y vamos a la bioactivación.

Metabolito Activo: El hígado lo transforma en metabolito inactivo.

Todos los tejidos de nuestro cuerpo tienen capacidad metabólica, pero los de mayor importancia son el Hígado, Sangre y Mucosa Intestinal.

- Metabolismo Presistémico o Portal: Exclusivo de Vía Oral. También influye el Tercio Superior de la Ampolla.

- Metabolismo Sistémico o Arterial: 2/3 inferiores de la ampolla.

Reacciones que permiten el Metabolismo o Biotransformación de los Fármacos:

- Oxidación (O₂): Consiste en que una molécula gana Oxígeno a través de distintas formas. Esto tiene lugar en el Hepatocito. Fundamental. La Oxidación puede ser Cromosómica o Extracromosómica. Cualquier situación que deprime la llegada de O₂ al Hígado puede ocasionar la muerte por sobredosis, aún cuando la dosis está a nivel terapéutico.
- Reducción (H): La molécula Oxígeno por parte de una molécula.
- Hidrólisis (H₂O): Rotura de una molécula.
- Conjugación: Hígado. Se sintetiza un nuevo producto soluble en agua, con lo que el fármaco puede ser expulsado del organismo.

REACCIONES QUE MODIFICAN EL METABOLISMO:

– **Químicas:** Pequeñas variaciones en la molécula pueden alterar el metabolismo de un fármaco produciendo una sustancia química inactiva en activa con sus consecuencias.

– **Genéticas:** Las diferentes razas, especies no reaccionan igual.

– **Fisiológicas:** La edad no toleran igual los niños y ancianos en relación con adultos. Los hombres con las mujeres. Las mujeres lo toleran peor. También embarazadas.

FACTORES FARMACOLÓGICOS:

1– Inhibición Enzimática.

2– Inducción Enzimática.

1– Inhibición Enzimática: El hígado es responsable del metabolismo. Entran 2 fármacos en el hígado. Uno de ellos inhibe el metabolismo del otro. Se administran conjuntamente. Si se inhibe una sustancia queda más fracción libre de aquella sustancia, por lo que hay más capacidad farmacológica. Puede producir efectos secundarios (por ejemplo, los Antidepresivos (IMAOs), tienen una sustancia química, la Tiramina que es Vasoactiva (contractura de arteriolas). No debe tomar quesos fermentados porque posee tiramina que es vasodilatador).

2– Inducción Enzimática: Cuando se administran diferentes sustancias químicas conjuntamente, algunas de ellas estimulan el metabolismo de otras a nivel hepático, haciendo prácticamente inactivas la otra sustancia desde el punto de vista terapéutico. Sus metabolitos pueden realizar efectos no deseados.

4– EXCRECIÓN:

1– Visual (conjuntiva).

2– Bucal: muy frecuente. Se elimina por la saliva especialmente los hipnóticos. Sabor y olor malo

3– Pulmonar: O₂, CO₂. Excelente.

4– Estómago: elimina la morfina y derivados. Es habitual la gastritis morfina y se manifiesta por vómitos matutinos. Con sobredosis se hace lavados continuamente. Gastritis alcohólicas, pituitas matutinas.

16/3/99

EXCRECIÓN DE FÁRMACOS:

– VÍAS BILIARES:

Excelente vía de excreción. Cualquier infección de vías (colecistitis, colangitis...) eliminan gran cantidad de fármacos.

Ventajas: Cualquier infección queda corregida.

Inconvenientes: Si se eliminan por vía biliar y no se metabolizan por hígado y se absorbe por intestino, muy bien (circuito enterohepático). Hay que adecuar la dosis para evitar exceso.

* **Ciclo Enterohepático:** Es cuando la presencia de fármacos en el intestino induce a su reabsorción tras actuar las bacterias intestinales. Gracias a este ciclo un fármaco perpetua su presencia por mas tiempo en el

organismo.

– INTESTINO:

Gran fuente de eliminación farmacológica. Los fármacos activos que no se han transformado en inactivos, que se eliminan por intestino, actúan sobre bacterias produciendo desequilibrio a nivel intestinal (diarreas....).

– RIÑÓN:

Vía de eliminación por excelencia. Puede eliminar fármacos activos y metabolitos inactivos. Infecciones urinarias si no pudiera el riñón eliminar los fármacos activos, no podría tratarse infecciones urinarias. El problema que tiene, es que a veces se produce reabsorción tubular de metabolitos y se produce intoxicación farmacológica.

– CUTÁNEA:

Buena vía de eliminación de fármacos No deja salir a las sustancias liposolubles y poco las hidrosolubles. Es característica la olor de enfermos crónicos alcohólicos.

– EN LACTANCIA:

Es importante que se fume lo menos posible. La nicotina, drogas y muchas sustancias como antibióticos se eliminan por esta vía.

RELACIÓN DE LA FARMACOCINÉTICA EN LA APLICACIÓN CLÍNICA DIARIA:

– ABSORCIÓN:

- 1– Fármacos totalmente absorbidos.
- 2– Fármacos parcialmente absorbidos.
- 3– Fármacos no absorbidos.

No Parenteral:

1– Fármacos Totalmente Absorvidos:

A– Digestiva: Los que tienen 100% de absorción no tienen problema.

B– Intravenosa: Es la vía por excelencia del total absorbido. Formación quistes.

2– Fármacos Parcialmente Absorvidos:

A– Cuando interesa que se absorba parcialmente. Hay dos vertientes de tratamiento:

- Sistémico.
- Local.

B– Cuando no interesa que se absorba (hierro).

Sabiendo los niveles plasmáticos en sangre, podemos saber si hemos de aumentar la dosis.

3- Fármacos No Absorvidos:

A- Laxantes: efecto local a nivel intestinal.

B- Antiácidos: esperar 2 h. entre tónico cardiaco y Almax.

BIODISPONIBILIDAD (Distribución):

Cantidad de fármaco que tiene capacidad de acción farmacológica una vez se ha pasado las primeras barreras que tiene cualquier fármaco para entrar en el organismo.

- Parenteral:

No problema. Vía por excelencia para el 100% de la disponibilidad es la vía intravenosa. Es la única en que el fármaco tiene el 100% de biodisponibilidad (acción farmacológica)

- Digestiva:

Antes de llegar el fármaco a circulación general, para hacer su efecto tiene que pasar por la Pared del Intestino y el Hígado. (dibujo 7)

PAUTAS DE DOSIFICACIÓN DE FÁRMACOS:

Existen 3 maneras fundamentales.

1- Monodosis.

2- Dosis de Mantenimiento.

3- Dosis Única Seguida de Dosis de Mantenimiento.

1) Monodosis:

Administración de un fármaco de forma puntual. Puede ser única o una dosis única repetitiva. (dibujo 8)

2) Dosis de Mantenimiento:

Depende de la vida media del fármaco (tiempo en que tarda una cantidad de fármaco en plasma a reducirse a la mitad por acción del metabolismo sistémico). (dibujo 9)

Se trata de dar múltiples monodosis en un espacio de tiempo que permite que los niveles plasmáticos sean siempre efectivos (dosis de mantenimiento). Esto sucede cuando está dentro del intervalo terapéutico (espacio virtual comprendido entre la concentración mínima eficaz y la mínima tóxica).

Del intervalo terapéutico depende la eficacia farmacológica y la aparición de efectos no deseados. Cuanto más amplio sea el intervalo terapéutico más tranquilidad en dosificación, más acción terapéutica y menos riesgo de aparición de efectos no deseados.

Cuando el intervalo terapéutico es pequeño (tónico cardiaco) lo que guía el tratamiento es la determinación de concentración plasmática del fármaco.

Cuando colocamos dosis de mantenimiento dentro del intervalo terapéutico de forma correcta, es el estado estable de dosificación (concentración plasmática eficaz por unidad de tiempo).

3) Dosis Unica más Dosis de Mantenimiento:

La dosis única es muchas veces superior a la terapéutica, superando el límite de concentración mínima tóxica (aumento del riesgo de efectos no deseados). (dibujo 10)

Es una forma de riesgo de administrar fármacos. Cuando se administran fármacos por vía intravenosa puede aparecer shock por velocidad.

METABOLISMO:

Se ha de ser muy cauto en la administración de según qué fármacos por vía oral en enfermedades hepáticas, porque se fuerza el hígado y puede desencadenar un coma hepático

ELIMINACIÓN:

Cualquier insuficiencia renal obliga a una revisión de la dosificación farmacológica. Por 2 motivos:

1- La no eliminación del fármaco por vía renal, siempre que sea fármaco activo, puede producir sobredosis con dosis terapéuticas.

2- Si no hay lesión renal ciertos fármacos nefrotóxicos pueden conducir a lesión renal.

TEMA 4

"INTRODUCCIÓN A LA QUIMIOTERAPIA"

LOS ANTIBIÓTICOS:

Sustancia química segregada por una bacteria que inhibe el crecimiento o la mata (mata) a otras bacterias.

Cuando esta sustancia hace el mismo efecto, pero es de síntesis se llama Quimioterapia.

ESPECTRO BACTERIANO:

Cantidad de gérmenes que pueden ser destruidos o inhibidos en su crecimiento por un agente antibacteriano. Nunca debería administrarse un antibiótico sin saber el agente causal de la infección. Ante cualquier infección se debería hacer los correspondientes cultivos (hemocultivo y urocultivo) siempre, y los cultivos puntuales de la zona afectada en determinadas ocasiones. Una vez indentificado el germen se ha de hacer el antibiograma (nos dice si el germen es sensible o resistente a determinadas sustancias antibacterianas).

POTENCIA ANTIBIÓTICA:

Capacidad de acción antibacteriana por unidad de peso.

CAPACIDAD BACTERIOSTÁTICA:

Capacidad de una sustancia antibacteriana para evitar la multiplicación de los gérmenes nocivos.

ACCIÓN BACTERICIDA:

Capacidad de una sustancia antibacteriana para lisar los gérmenes patógenos.

NIVELES PLASMÁTICOS DE ANTIBIÓTICOS:

Concentración en plasma por unidad de volumen plasmático (mg/cc).

AGONISMO Y ANTAGONISMO ANTIBIÓTICO:

Agonismo: Aquella capacidad de 2 sustancias antibacterianas que tienen el mismo fin en lisar o evitar crecimiento bacteriano. Prácticamente siempre pertenecen a la misma familia de agentes bacterianos.

Antagonismo: Sustancias que antes de ejercer su acción antibacteriana anulan sus efectos, generalmente por condicionantes químicos de su estructura.

¿CÓMO ACTÚAN LOS ANTIBIÓTICOS PARA EJERCER SU ACCIÓN ANTIBACTERIANA?:

1º) Por Antagonismo Competitivo:

La sustancia antibiotica que administramos actúa por antagonismo farmacológico sobre la sustancia fundamental (nutriente) para el crecimiento y multiplicación de la bacteria.

2º) Por Acción Directa Sobre la Membrana Bacteriana:

La debilita y produce la destrucción de la bacteria (efecto detergente).

13/4/99

3º) Inhibición de la Síntesis de la Pared Bacteriana:

El Antibiótico penetra en la bacteria y realiza la acción en el interior de ésta. El problema es que el antibiótico actúa sobre las células del organismo y puede destruirlas.

- El efecto máximo de activación se produce en el momento de la multiplicación bacteriana.
- Esta es la forma más específica de actuación de la Penicilina.

4º) Inhibición de la Síntesis Proteica:

Inhibición de Proteínas que son imprescindibles para la Multiplicación bacteriana. Puede producir Citólisis (muerte de las células) y Anemia por Antibiótico.

5º) Inhibición de la Síntesis de Ácido Nucleico:

Se hace con antibióticos sumamente agresivos.

RESISTENCIAS BACTERIANAS:

Definición: Lucha o defensa de las bacterias contra los antibióticos.

Tipos:

a) Cromosómicas.

1– Genéticas.

b) Extracromosómicas.

2– No Genéticas o Adquiridas.

1– Genéticas:

a) Cromosómicas:

Aparecen en las bacterias por transmisión directa de bacterias "padres" a bacterias "hijas" (se dan después de la multiplicación bacteriana).

b) Extracromosómicas:

Resistencias transmitidas de bacteria a bacteria mediante el contacto de 2 ó + bacterias (contacto entre ellas a través de corpúsculos protoplasmáticos denominados Plásmicos (que están dentro del cuerpo de la bacteria) que transmiten la información genética).

2– No Genéticas o Adquiridas:

Son aquellas que aparecen en el transcurso de la vida bacteriana. Los pasos son:

1– Síntesis de una enzima que destruye el antibiótico.

2– Modificación de la pared bacteriana para impedir la penetración del antibiótico en su interior.

3– Alterar los receptores bacterianos para el antibiótico.

EFFECTOS TÓXICOS Y SECUNDARIOS DEL ANTIBIÓTICO:

1) Alergia:

Puede ser:

- Inmediata y traumática con anafilaxia.
- Solapada.

2) Efectos Locales:

- Formación de abscesos.
- Formación de flebitis con o sin periflebitis.
- Formación de quistes asépticos.

3) Depresión de las defensas inmunitarias del individuo con aparición de sobreinfección con gérmenes oportunistas.

- 4) Trastornos tóxicos por disminución del metabolismo del antibiótico.
- 5) Trastornos de sobreinfección.
- 6) Trastornos neurológicos (convulsiones de penicilina a grandes dosis).
- 7) Trastornos psíquicos (psicosis tóxica con gran excitación psíquica).
- 8) Trastornos cardiovasculares (hipotensión y aparición de trastornos del ritmo cardiaco).
- 9) Trastornos digestivos (gastritis aguda, diarrea por enteritis, diarrea por disbacteriosis (alteración de la flora intestinal), proctitis por vía rectal, en la boca ningún efecto negativo (llevan protección)).
- 10) Trastornos Hepáticos (hepatitis tóxica, especialmente la colostásica (mucha bilirrubina y poca transaminasa)).
- 11) Trastornos renales (provoca insuficiencia renal en un riñón normal o agrava una insuficiencia renal preexistente a la administración (reversible)).
- 12) Trastornos hematológicos:
 - Depresión de la Médula Ósea:
 - * *Global (Panmieloptis):* Alteración de Hematíes, Leucocitos y Plaquetas.
 - * *Selectiva:* Sólo se alteran alguna de las 3 (Anemia, Leucopenia, Plaquetopenia).
- 13) Trastornos Cutáneos (eritemas, exantemas, pruritos generalizados o localizados (prurito bucal en alergia a penicilina)).

TEMA 5

"LAS PENICILINAS"

PENICILINAS NATURALES:

Extraordinario antibiótico por su acción antibiótica y su precio: 1 mg. de Penicilina en 20 l. de Caldo de Cultivo tiene el mismo efecto que 20 g. de Sulfamida en 20l. de Caldo.

Química de la Penicilina:

Forma parte de la familia de los B – Lactantes.

Modo de Acción:

- Lisis de las bacterias.
- Inhibición de la Síntesis de la Pared Bacteriana.

Farmacocinética (de penicilinas naturales):

1) Absorción:

- Pésima absorción por Vía Oral (los alimentos la fijan. Si no hay alimentos el ácido la destruye).
- Por Inyección Intramuscular se debe Asociar con Anestésico Local, porque es muy Dolorosa. Por Intravenosa no hay problema.

2) Distribución:

- Se distribuye perfectamente por todo el organismo.
- Atraviesa Barrera Hematoencefálica.
- Tiene una Vida Media Muy Corta (se deben hacer variaciones para alargar su vida media).

3) Metabolismo:

- No se metaboliza.

4- Excreción:

- Se elimina de Forma Activa por el Riñón, tanto por Filtración Glomerular como por Excreción Tubular.

Resistencias (naturales):

Muy importantes debido a su mal uso. Suelen ser de tipo genético, pero las bacterias también crean un enzima contra ella (Penicilinasa).

Espectro Bacteriano (naturales):

- Muy Sensibles a los Gram +.
- Prácticamente Insensibles a Gram - .

Efectos Tóxicos y de Hipersensibilidad:

- Las Penicilinas Naturales no tienen prácticamente efectos tóxicos pero efectos de hipersensibilidad hay múltiples, principalmente la Alergia (concretamente Anafilaxia).
- Dar la inyección con el paciente tumbado (decúbito prono).
- Convulsiones a dosis altas.
- Reacción de Herx – Harmer por lisis brutal bacteriana y liberación de toxina.
- Anemias, Leucopenias y Trombopenias (no habitual).
- Prácticamente nunca hay Insuficiencia Renal.

Indicaciones Terapéuticas:

- **Gérmenes:** * Estafilococo.

* Estreptococo.

* Meningococo.

* Neumococo.

* Gonococo.

– *Treponema Sifilítico.*

– *Infección de Piel y Tejidos Blandos por Gérmenes Gram – .*

PENICILINAS SINTÉTICAS Y SEMISINTÉTICAS:

1) AMPICILINA:

Excelente, sobretodo por su espectro bacteriano, ya que amplían el campo de las penicilinas naturales.

– Absorción:

Via de elección e la Oral. Administrarlas con el estomago libre de alimentos porque se destruyen (produce frecuentemente diarreas por Antibiótico.).

– Metabolismo:

Igual que las naturales.

– No administrar a pacientes con Mononucleosis Infecciosa (afección hepática, ganglios cervicales y axilares, exantema cutáneo).

2) AMOXICILINA:

Absorción:

– Por Vía Oral: Profármaco (en la Pared Intestinal se transforma en Anticilina).

– Por Vía Parenteral: Fármaco.

– Prácticamente no produce diarrea por su rápida absorción.

– A diferencia de la Ampicilina, se puede administrar con el estómago lleno.

Efectividad:

– Gran efecto sobre gérmenes Gram + y – .

– Muy efectiva en Infecciones Alimentarias por Salmonela.

– Fármaco de elección en Infecciones Bronquiales con Gran Mucopurulencia.

– Asociación con Ácido Lavulónico es una forma de potenciación.

Eliminación:

- Se elimina Inmodificada por Vía Renal.

Resistentes a la Penicililasa:

Cloracilina:

- Sumamente efectiva contra los Estafilococos y Estreptococos.
- Fármaco de elección en Infecciones Cutáneas y Pequeños Abcesos Cutáneos.
- Se ha de administrar con estomago vacío.

3) CEFALOSPORINAS:

- Forman parte de los A – Lactantes.
- Son bactericidas. Inhiben la Síntesis de la Pared Bacteriana.
- Son muy poco tóxicas para las células del organismo.
- Resistencias muy frecuentes por su mal uso.
- Espectro bacteriano:
 - * Muy efectivos contra Gram + y las nuevas generaciones contra Gram – .
 - * Las de 4º generación sumamente efectivas contra infecciones por pseudomona (en centros hospitalarios).

Efectos No Deseados:

- Hepatotoxicidad No Infrecuente.
- Efecto Disulfiram: El Disulfiram es utilizado en la deshabituación alcohólica. Los pacientes que toman alcohol y cefaloparinas, tienen el mismo efecto clinico que si tomaran disulfiram.
- Diarreas por disbacteriosis intestinal (poco frecuente).
- Eliminación por leche materna.

Farmacocinética:

- La Vía Oral no es excesivamente buena porque se destruye.
- Se distribuye bien por todo el organismo.
- Metabolismo Hepático Parcial.
 - * Metabolito Inactivo.
 - * Fármaco Activo.
- Eliminación Renal.

Indicaciones:

- Aseptizar el organismo, cuando se administra previamente a cirugía.
- Infección hospitalaria por Pseudomona.
- Infecciones por Gram – .
- Síndromes Febriles de origen desconocido.

Hacer Cultivos Previos a la Adminsitación:

- Hemocultivos (1).
- Urocultivos (2).
- Cultivos de posibles zonas infectadas.

4) TETRACICLINAS Y CLORANFENICOL:

Cloranfenicol: No se utiliza casi porque produce depresión medular global con Panmielocitosis o pesar de ser extraordinario contra el Tifus.

Tetraciclinas: Fármaco extraordinario que inhibe la síntesis de la pared bacteriana.

Farmacocinética:

- Excelente absorción Vía Oral.
- No se deben administrar con leche porque la fija y favorece su eliminación por heces.

Distribución:

- Excelente por todo el organismo.
- Atraviesa Barrera Hematoencefálica y se fija de forma selectiva en los Tejidos Neoplásicos.

Metabolismo:

- Parcial Hepático.

Eliminación:

- Vías Biliares y Riñón en forma de Fármaco Activo y Metabolito Inactivo.
- Por Bilis (Fármaco Activo) favorece la aparición del Ciclo Enterohepático.

Espectro Bacteriano:

- Importante con gérmenes Gram + y Gram – .

Precauciones:

- No administrar a mujeres embarazadas. Puede producir Teratopenia.
- No administrar con antiácidos porque los bloquea.

Efectos no deseados:

- Frecuentes Fenómenos Alergicos..
- Aparición de dentadura marrón por acumulación.
- Aparición de Candidiasis Bucal.
- Se acumula a nivel óseo de forma temporal (no administrar entre 12–22 años, pues puede retrasar el crecimiento).
- No administrar con anticonceptivos orales (provocan alteración en la absorción de los anticonceptivos).
- Producen Fotosensibilización (no tomar el sol).

5) AMINOGLICÓSIDOS:

- Actúan inhibiendo la síntesis bacteriana.
- Tienen importantes efectos tóxicos por sí mismos.

Farmacocinética:

Absorción:

- Pésima absorción oral. Francamente efectivos para infecciones intestinales.
- Excelente absorción parenteral.

Distribución:

- Distribuyen bien por todo el organismo.
- Dificultades para atravesar Barrera Hematoencefálica.
- Muy buena penetración en Cavidad Peritoneal y Articulares (utilizar en procesos peritónicos y artríticos).

Metabolismo:

- No sufren metabolismo hepático.

Espectro Bacteriano:

- Muy Amplio.
- Gérmenes Gram + y Gram – .

Efectos No Deseados:

- Ototoxicidad (especialmente Estreptomicina, que produce atrofia del nervio auditivo con sordera irreversible).
- Nefrotoxicidad (especialmente Gentamicina. La nefrotoxicidad aparece en pacientes sin lesión renal previa y agrava las infecciones renales preexistentes... Son reversibles. Debe adecuarse la dosis al grado de insuficiencia renal).
- Bloqueo Neuromuscular (relajación muscular y parada respiratoria) o Efecto Curare. Se utilizan anestésicos con efecto curare para producir relajación muscular y para que el anestesista pueda controlar la respiración del paciente.
- Hay que ser muy prudente en pacientes con insuficiencia respiratoria, pues se puede agravar (EPOC).
- Tienen Sinergismo con los B – Lactámicos cuando se administran por separado.
- Tienen Antagonismo con B – Lactámicos cuando se administran conjuntamente (no administrar ni en el mismo suero ni en la misma vía).

6) SULFAMIDAS:

- Magnífico Anti B – Lactámico.
- Actúa por Antagonismo Competitivo por el Ácido Fólico (imprescindible para el crecimiento bacteriano)

SULFAMIDAS DE ACCIÓN RÁPIDA:

Se hicieron servir mucho. Una sola pastilla hacía efecto para 8 días. Si no se toleraba no se podía eliminar del organismo. Se suprimieron del mercado.

SULFAMIDAS DE ACCIÓN CORTA:

Absorción: – Vía Oral excelente, con una particularidad: gran cantidad de agua porque cristalizan a nivel renal produciendo insuficiencia renal.

Distribución: – Difunden perfectamente por todo el organismo.

- Atraviesan Barrera Hematoencefálica.

Metabolismo: – Hepático Parcial. Muy lento.

Eliminación: – Renal.

- Evitar administrar en Lactancia, porque se eliminan por leche materna.

Espectro Bacteriano:

- Gram + y Gram – .
- Gran eficacia contra las Clamidias.
- De elección en Infecciones Otorrinolaringológicas, Respiratorias y Urinarias.

Efectos No Deseados:

- Hepatotoxicidad.
- Nefrotoxicidad.
- Diarrea por antibióticos.
- Intensa Fotosensibilización.
- Anemia Macroscítica por ser Antifólico (hematíes grandes, hematocrito normal).
- Dermatitis Exfoliativa (cae la piel a tiras de las manos) o Síndrome de Stevers – Johnson.
- Interacciones Farmacológicas: esto es debido a que producen el desplazamiento de múltiples fármacos del aceptor proteínico aumentando la fracción libre y acción farmacológica (Acido Acetil Salicilico, Antidiabéticos Orales, Anticoagulantes Orales, Antiinflamatorios (produciendo aumento de la gastroagresividad)).
- Los No Absorbibles se emplean como antisépticos intestinales (al no absorberse actúan localmente en el tracto intestinal).

20/04/99

ERITROMICINA:

Excelente sustituto de la Penicilina. De elección en pacientes alérgicos a la misma.

Actuación: – Inhibición de la síntesis proteica.

Absorción: – Vía Oral e Intravenosa.

Distribución:

- Global.
- No atraviesa barrera hematoencefálica.

Metabolismo: – Hepático Parcial.

Eliminación:

- Por Vías Biliares.

Efectividad: – Muy efectiva frente a Gram +

Indicaciones: – Enfermedad del Legionario (Neumonía por Legionela).

- Procesos Oítricos.
- Procesos Respiratorios.

CLINDAMICINA:

Es la Lincomicina con una variación en su molécula (esta variación se salta un efecto importante de la Lincomicina que es la alergia cruzada con Penicilina).

Absorción: – Vía Oral, Parenteral y Tópica.

Distribución:

- Buena distribución.
- No atraviesa Barrera Hematoencefálica.
- Mucha Capacidad de Penetración en Abscesos y Tejido Oseo Infectado.

Metabolismo:

- Hepático Parcial.

Eliminación:

- Vías Biliares, Renal.

Efectividad: – Gérmenes Gram + .

- Infecciones por Clamidas.
- Toxoplasmosis.
- Enfermedades por Anaerobios.

Indicaciones: – Osteomielitis.

- Abscesos Intraabdominales, Pulmonares y Dentales.
- Infecciones Cutáneas.

QUINOLONAS:

Actuación: – Inhibición de la Síntesis Proteica Bacteriana.

- Fármacos Bactericidas de Muy Potente Acción.
- Hay Resistencias Frecuentes por su uso indiscriminado.

Absorción: – Vía Oral (no todos) e Intravenosa.

- Importante que por Vía Oral se tomen con el Estomago Vacío (los alimentos alteran la absorción).
- Importante Biodisponibilidad Vía Oral (70%).

Distribución:

- Todo el Organismo (Excelente).
- Atraviesa Barrera Hematoencefálica.

Eliminación:

- Vía Renal.
- Leche Materna.

Efectividad:

- Gram + y Gram – .
- Infecciones O.R.L. (otitis, sinusitis, amigdalitis purulentas....).
- Infecciones Respiratorias (bronquitis aguda, neumonías...).
- Infecciones del Tracto Gastro–Intestinal.

Indicaciones:

- Gastritis Flemonosas.
- Diarrea por Infección Bacteriana.
- Infecciones de Vías Biliares (colecistitis).
- Infecciones de Trasnmisión Sexual (gonorrea).
- Infecciones Pelvicas (abcesos pélvicos).
- Infecciones Ginecológicas (salpingitis).
- Infecciones Urológicas (cistitis, orquitis en varones).
- Infecciones de Piel y Tejidos Blandos.

Efectos No Deseados:

Aunque son fármacos de amplio espectro, no deben administrarse en las siguientes situaciones:

- Antecedentes de Convulsiones ni de A.V.C.
- Durante la Lactancia.
- Antecedentes de Reacciones Cutáneas.
- Producen Intensa Fotosensibilización.
- Actúan por Inhibición Enzimática sobre la Cafeína, Teofilinas y Ciclosporina.

- Por Vía Oral puede producir Alteración de su Absorción la Administración Conjunta de Alcalinos (bloquean su absorción).
- Producen Mínimos Efectos Secundarios (vómitos y diarrea, cefaleas brutales (sobre todo en personas migrañosas)-----Ciprofloxacina (Baycip).

FÁRMACOS ANTIMICÓTICOS:

Las enfermedades por hongos se clasifican en:

- Micosis Superficiales (piel).
- Micosis Profundas (órganos internos).
- Micosis Mixtas.

El tratamiento por Micosis es complejo y difícil, pues los hongos son muy rebeldes al tratamiento debido a:

- 1) Los hongos por sí mismos tienen una Membrana Coriácea y es difícil que los medicamentos penetren en su interior.
- 2) Las Micosis Superficiales forman una estructura entre el Foco de Emisión y el Tejido Subyacente y ésta está poco vascularizada, y por tanto, el fármaco llega con dificultad.
- 3) Las Micosis Profundas forman aglomeraciones de hongos con una estructura fibrosa que rodea el Foco Micótico (las estructura fibrosas y el foco micótico forman un Granuloma).

Clasificación de los Fármacos Micóticos:

1) Antifúngicos de Acción Superficial:

Son los que se aplican sobre la superficie cutánea afectada. La aplicación tópica del fármaco antimicótico es poco efectiva. Por tanto, las micosis superficiales tienen como tratamiento una doble vertiente:

- 1– Tratamiento Tópico Local (no lo tocaremos en el tema).
- 2– Tratamiento Sistémico.

TRATAMIENTO SISTÉMICO:

Griseofulvina:

Sirve para Superficiales y Profundas.

Actuación: – Inhibición de la Mitosis de los hongos.

Efectividad: – Son fármacos muy efectivos, pero tienen que tomarse largo tiempo.

Absorción: – Oral (muy buena).

- Se acumulan en piel, pelo y uñas.

Distribución:

- Sistémica.

Metabolismo:

- Hepático (intenso).
- Sobrecarga el Hígado. Vigilar en Hepatopatías.

Eliminación:

- Descamación Cutánea, Heces y Riñón.

Efectos Secundarios:

- Hepatitis Transitoria (por fármaco o agravación de hepatopatía preexistente).
- El tiempo de administración puede durar meses (sobre todo para una micosis de Tipo Mixto como el Pie de Atleta).

– Nistalina (Micostatin):

Absorción: – Vía Oral (muy buena).

- Tabletas u Óvulos Vaginales (micosis vaginales).
- Mínima Absorción Intestinal.

Indicaciones:

- Candidiasis del Tracto Gastro-Intestinal.
- Micosis Digestivas (no es efectiva en Micosis Sistémicas).
- Infecciones Micóticas Vaginales (se puede administrar por tanto en Tabletas u Ovulos Vaginales).

– Ketoconazol:

Absorción: – Vía Oral (micosis vaginales).

- Óvulos (micosis vaginales).
- Vía Tópica (micosis cutáneas).

Distribución:

- Muy buena distribución orgánica.

Metabolismo:

- Hepático.

Eliminación:

- Renal.

Efectividad: – Micosis Sistémicas y Superficiales.

Efectos Secundarios:

- Administrado largo tiempo en Varones, aparición de Ginecomastia (hiperplasia de mama).
- Hepatotoxicidad (por metabolismo hepático importante).
- En pacientes con Hepatotoxicidad con Micosis Cutánea se administra fármacos por Vía Tópica.
- No debe asociarse con fármacos Antiácidos (bloquean su absorción).

– Metronidazol:

Efectividad: Es un todoterreno. Es de elección en:

- Amebas.
- Trichomonas Vaginalis (E.T.S.).
- Infestación Intestinal por Giardia Lamblia (muy problemática porque puede aparecer o no en heces. Penetra en la mucosa intestinal provocando diarreas que pueden comprometer la salud del paciente-----pozos).
- Anaerobios.

Absorción: – Todas las Vías.

Distribución: – Excelente.

- Gran capacidad de penetración en Abscesos Hepáticos y Amebas.

Efectos Secundarios: – Intenso Efecto Disulfiram.

- No tomar Embarazadas (efectos teratogénicos).

FÁRMACOS ANTIVÍRICOS:

Problemas de las infecciones víricas:

- 1) Los virus sufren rápidas mutaciones en su estructura.
- 2) El tratamiento efectivo ha de hacerse en la fase de multiplicación del virus.
- 3) No automedicarse en cuadro gripal (se crean resistencias a bacterias).

Hay muchos fármacos y muy poco efectivos.

– IDOXURIDINA:

Absorción: – Vía Tópica.

– Vía Sistémica Ineficaz.

Indicaciones:

– Herpes Simple y Oftálmico.

Efectos Secundarios:

– Ocasionalmente Eritema en zona que se administra.

– ACICLOVIR:

Absorción: – Vía Oral, Tópica, Intravenosa.

Indicaciones: – Infecciones por Herpesvirus.

– Encefalitis Herpética (extraordinario).

– Herpes Simple, Oftálmico, Zoster y Genital (extraordinario).

– Varicela Zóster.

27/4/99

– INDUCTORES DE LOS INTERFERONES:

Los Interferones son Proteínas Antivíricas producidas por las Células Infectadas por Virus. Esta capacidad celular ha hecho que los Interferones se empleen de forma algo Inespecífica contra Infecciones Víricas y en ocasiones en Epidemias Víricas. A veces pueden ser sintetizadas por bacterias (no son exclusivas de virus).

Actuación:

Inhiben selectivamente la Síntesis Proteica de los virus, impidiendo así su Mutación y Multiplicación.

Indicaciones: – Queratitis Herpética (herpes oftálmico).

– Profilaxis de las Epidemias Graves.

– Hepatitis B y C.

Efectos Secundarios:

– Trombopenia (disminución de plaquetas): por tanto, está contraindicado en pacientes con Plaquetopenia o Trombopenia (con trombopenia se pueden producir hemorragias).

– Leucopenia: la leucopenia puede producir a su vez, infecciones oportunistas. La leucopenia no impide el tratamiento con Interferones.

– Fiebre acompañada de Intensas Cefaleas: lo que a veces obliga a interrumpir el tratamiento.

– FÁRMACOS ANTIVÍRICOS PARA TRATAR EL SIDA:

*** AZT (Zidovudina):**

Primer fármaco empleado contra el VIH. Se usaba en los años 60, pero se desechó por sus Efectos Secundarios.

El problema de los fármacos anti VIH son los Efectos Secundarios:

– Actúan contra las Células Formes Sanguíneas: produciendo Anemia, Leucopenia, Trombopenia.....

– Crisis de Hiperpirexia: puede agravar el estado general del paciente o producir lesiones neurológicas irreversibles.

FÁRMACOS ANTIAMEBIANOS:

La Amebiasis es una infección que puede afectar al Tracto Digestivo o que puede pasar dentro del organismo y formar Abscesos Amebianos. La Transmisión es Oral – Fecal.

Puede producirse en:

- Zonas Circunscritas en forma de Infección Esporádica.
- Forma Epidémica.
- Forma Endémica.

Manifestaciones Clínicas:

1– Patrón Local:

Diarrreas Profusas Sanguinolentas, con importantes Dolores Cólicos Intestinales.

2– Patrón Sistémico.

La propia de los Abscesos de Amebas allá donde estén. Los más frecuentes (por orden) son:

- 1º– Hígado.
- 2º– Cerebro.
- 3º– Pulmón.

Clasificación de los Fármacos:

Antes se dividían según el tipo de Infección Amebiana en Intestinal, Sistémica y Mixta, y había fármacos para cada una. Ahora con el Metranidazol (Flagyl) se trata a todas. Elimina las Amebas, pero puede dejar Abscesos Asépticos (abscesos que contienen leucocitos, restos de tejido....., pero sin bacterias).

FÁRMACOS ANTIHELMÍNTICOS:

1/4 parte de la población mundial está infestada por Helminotos. Hay zonas endémicas, epidémicas y de brote

agudo. Hay muchos portadores. El Helminto más corriente es el Oxiuro.

Manifestaciones:

Irritabilidad, dolores abdominales de tipo cólico, rechinar de dientes y prurito anal interno, especialmente nocturno, que impide el sueño.

Aunque haya un sólo infectado en la familia, todos tienen que hacer el tratamiento.

Las lombrices suelen salir a los márgenes del ano por la noche para poner sus huevos.

– MEBENDAZOL:

Fármaco de elección contra Oxiuros. No administrar a Embarazadas (tiene efecto Teratogénico).

– TYABENDAZOL:

De elección en infestaciones como es la Triquinosis. Uno de los modos de transmisión son los Jamones Mal Curados (se transmite por carne de cerdo). El problema del Tyabendazol es que tiene Severa Toxicidad Hepática y puede producir por tanto, Hepatitis Transitorias por sí mismo.

– Triquinosis:

Acantonamiento en masas musculares en forma de quistes de Triquina con formación de Microquistes Cálculos que provocan dolores musculares, los cuales inmovilizan al individuo. Esta afección puede afectar a toda la musculatura, pero principalmente al Deltoides.

FARMACOLOGÍA DEL SISTEMA NERVIOSO:

El descubrimiento de los Neurotransmisores fué motivo de Premio Nobel. Los neurotransmisores son sustancias químicas que transmiten el impulso nervioso. Dentro de los múltiples neurotransmisores que hay destacamos:

- Acetilcolina.
- Adrenalina.
- Noradrenalina.
- Histamina.
- Dopamina.
- Serotonina.

Receptores Específicos de los Neurotransmisores:

- Acetilcolina: Colinérgicos (Muscarínicos y Nicotínicos).
- Adrenalina y Noradrenalina: Alinérgicos Alfa y Beta.
- Histamina: Histaminérgicos (H1 y H2).

- Dopamina: Dopaminérgicos.
- Serotonina: Serotoninérgicos.

Lugares de Acción de los Neurotransmisores:

Acetilcolina: – Terminaciones Parasimpáticas del Músculo Liso y Cardíaco.

- Sinapsis Musculares Periféricas.
- Sinapsis Internas del SNC.

Adrenalina y Noradrenalina:

- Sinapsis Simpáticas del Músculo Liso y Cardíaco.

Histamina, Dopamina, Serotonina:

- Sinapsis del SNC.

Secuencia del Transmisión Sináptica del Impulso Nervioso:

- 1) Síntesis del Neurotransmisor.
- 2) Acúmulo del Neurotransmisor en Vesículas a nivel de la Sinapsis.
- 3) Despolarización de la Membrana Postsináptica.
- 4) Liberación del Neurotransmisor.
- 5) Acción Farmacológica al unirse el Neurotransmisor con Receptores Específicos Postsinápticos.
- 6) Metabolización del Neurotransmisor.
- 7) Repolarización de la Membrana Postsináptica.

FÁRMACOS COLINÉRGICOS, ANTICOLINÉRGICOS, ADRENÉRGICOS Y ANTIADRENÉRGICOS:

1- FÁRMACOS COLINÉRGICOS

Son los que actúan específicamente sobre Receptores Colinérgicos y tienen Igual Capacidad de Acción que la Acetilcolina. La Acetilcolina es una sustancia que se metaboliza muy rápido por una Enzima: la Colinesterasa. Como terapéutica interesa que la Acetilcolina tenga acción prolongada.

Hay 2 Tipos de Colinérgicos:

– De Acción Directa:

Tienen la misma acción por actuar sobre los mismos receptores de la Acetilcolina.

.

- **Carbacol:** Tratamiento del Glaucoma (hipertensión ocular).
- **Pilocarpina:** Se usa en Oftalmología como fármaco Miótico.
- **Betanecol:** Es emplea en Distensiones Abdominales Postquirúrgicas.

– **De Acción Indirecta:**

Permiten la acción duradera de la propia Acetilcolina porque Inhiben al Inhibidor (la Colinesterasa). Se les llama Anticolinesterasas. Fundamentalmente se emplean como Antídotos del Curare y en la Miastenia Gravis:

- **Fisostignina:** Recuperación de la Anestesia.
- **Neostignina:** Miastenia Gravis.

Acciones Farmacológicas de los Colinérgicos a Diferentes Niveles:

Oftalmológico: – Miosis.

Cardiovascular: – Bradicardia.

- Hipotensión.
- Sudoración Profusa.

Respiratorio: – Broncoespasmo + Aumento de las Secreciones Bronquiales.

Digestivo:

- Hipertonía Generalizada del Tracto Digestivo (lo cual puede traducirse en diarreas profusas).
- Aumento Secreciones Salival y Pancreática.
- Vómitos por Antiperistaltismo (si hay dificultades de evacuación gástrica).

Urinario:

- Hipertonía de la Vejiga Urinaria (con Micciones Espontáneas si hay Incontinencia Urinaria).

Musculoesquelético:

- Temblores.
- Mioclonia.
- Espasticidades Musculares.

2- FÁRMACOS ANTICOLINÉRGICOS:

Son Antagonistas Competitivos de la Acetilcolina y otros fármacos de Acción Colinérgica. El fármaco Anticolinérgico por elección es la Atropina o Belladonna. La Atropina Inhibe el Reflejo de la Acomodación (por tanto, no se calculan bien las distancias). Este fármaco se utiliza para hacer Fondos de Ojo.

Acciones Farmacológicas de los Anticolinérgicos a Diferentes Niveles:

Sistema Nervioso Central: – Sedación.

- Somnolencia.
- En Sobredosis, Estados Depresivos (de horas o días).
- Fiebre.

Oftalmológico:

- Midriasis.
- Alteración Reflejo Acomodación y Fotomotor.
- Pueden Agravar un Glaucoma.

Cardiovascular:

- Taquicardia.
- Moderada Hipertensión o Estabilización de la misma: por tanto, son fármacos de elección en las Crisis Vagales, con una particularidad: que en personas que tengan predisposición a crisis vagales, pero no no esten en ese momento en una, difícilmente superará su Tensión Arterial Basal y su Pulso Basal.

Respiratorio: – Broncodilatación + Reducción Secreciones Bronquiales.

Digestivo: – Disminución Secreciones Salivales, Gástricas y Pancreáticas.

- Disminución Peristaltismo Gástrico e Intestinal.

Urológico: – Disminución del Tono Vesical.

Cutáneo: – Disminución de la Sudoración Cutánea (a veces, sequedad cutánea).

Indicaciones Terapéuticas a Diferentes Niveles:

Anestésico: – Disminución Ansiedad Prequirúrgica.

- Disminución Crisis Vagales en Anestasia Local.
- Disminución Secreciones Bronquiales.
- Evitan el Mareo (Escopolamina en Parches Retroauriculares).

Enfermedad de Parkinson: – Reduce Temblor (junto con resto tratamiento convencional).

Oftalmológico:

- Examen de Fondo de Ojo.

- Previenen Formación de Glaucoma tras una intervención de Cataratas.

Cardiológico: – Crisis Vagal.

Respiratorio: – Disminución Secreciones Bronquiales.

- Broncorrea.

Digestivo: – Depresión Funciones Digestivas.

- Diarreas Profusas.
- Vómitos Incoercibles.
- Hipersecreción de Saliva (Sialorrea).
- Hipersecreción Gástrica.
- Hipersecreción Pancreática en Pancreatitis Agudas Edematosas.

4/5/99

Contraindicaciones de los Fármacos Anticolinérgicos:

- Glaucoma.
- Procesos con Disminución de la Secreción de Saliva.
- Dificultad de Evacuación Gástrica.
- Estados de Constipación Feroz.
- Ileo Paralítico.
- Síndrome Prostático.

Este tipo de contraindicaciones se engloban en muchos de los fármacos anticolinérgicos (efecto anticolinérgico o atropínico).

3- FÁRMACOS ADRENÉRGICOS:

Son los que actúan sobre los receptores adrenérgicos (los fundamentales son Alfa (1 Y 2) y Beta (1 y 2) adrenérgicos). Los Alfa se encuentran en los Vasos Sanguíneos y los Beta en Corazón y Bronquios.

Tipos de Fármacos Adrenérgicos:

- **De Acción Directa:** Actúan directamente sobre los receptores adrenérgicos.

*** Adrenalina:**

- Gran potencia sobre el Músculo Cardíaco (es un cardiotónico poderoso).

- Estimula la Energía de Contracción Cardíaca.
- Aumenta la Frecuencia Cardíaca.
- Produce Intensa Vasoconstricción Periférica.
- Potentísimo Broncodilatador (de elección en Crisis Asmáticas Agudas).

Es tan potente su acción vasculotónica que en casos de Esclerosis Vascular no puede administrarse de forma local porque puede provocar Necrosis Vascular en la zona de inyección.

*** *Noradrenalina:***

- Menor efecto cardiotónico.
- Aumenta Poco la Energía de Contracción.
- Aumenta Moderadamente la Frecuencia Cardíaca.
- Aumenta de Intensamente la Tensión Arterial por Contracción Arteriolar.
- Actúa sobre Resistencias Periféricas, por tanto es Hipertensor (Vasoconstrictor).

*** *Dopamina:***

- Neurotransmisor Central de Potente acción Periférica y Múltiple.
- Fármaco Adrenergico Excelente.
- A Dosis Bajas Aumenta el Flujo Renal (por tanto aumenta el filtrado glomerular, por lo que es un excelente diurético).
- A Dosis Medi-Altas excelente Tónico Cardíaco (aumenta la frecuencia y potencia de contracción).
- A Dosis Altas Poderoso Constrictor. (por tanto, de elección en casos de Shock).

No debe darse en casos de Insuficiencia Cardíaca Severa y en Hipertensión por Coronariopatía.

– De Acción Indirecta:

Son los que estimulan la secreción de adrenalina y noradrenalina (que son los neurotransmisores que actúan sobre los receptores adrenérgicos).

*** *Cocaína*** (no la comentaremos).

*** *Tiramina:*** Poderoso Hipertensor con acción muy breve. No se debe combinar con Antidepresivos y con Tiramina.

– De Acción Mixta:

Son los que actúan tanto sobre los receptores adrenérgicos, como liberando adrenalina y noradrenalina. Tienen gran importancia porque multitud de fármacos forman parte de esta familia. Entre ellos:

*** Anfetaminas.**

*** Efedrina.**

*** Isoproterenol** (potente broncodilatador).

Farmacocinética:

Absorción:

– Excelentes por Vía Oral, pero la Efedrina es Excelente por Vía Mucosa–Nasal (por tanto, se emplea como descongestivo nasal).

Distribución:

- Buena acción sobre Dinámica Cardíaca por que se absorben rápido por la Mucosa Nasal.
- Atraviesan Barrera Hematoencefálica.

Metabolismo:

- Hepático Parcial.

Eliminación:

- Renal.

Acciones Farmacológicas a Diferentes Niveles del Organismo:

Sistema Nervioso Central: – Fármacos Euforizantes. Producen Insomnio.

Cardíaco:

- Aumento de la Frecuencia y Energía Contracción Cardíaca (por tanto, son fármacos Hipertensores).
- La Efedrina en Personas Mayores puede provocar Insuficiencia Cardíaca.
- No deben administrarse en Gotas Nasales por Largo Periodo por su efecto Vasoconstrictor que puede producir Atrofia de la Mucosa Nasal con Anosmia.

Respiratorio: – Excelentes Broncodilatadores.

Efectos No Deseados:

- Inquietud Mental con Excitación Psíquica, Insomnio, y en personas predispuestas, desencadena Temblores.
- No administrar a personas con HTA (especialmente las que tienen elevada la Mínima, y nunca cuando la Mínima Supera los 100).

4- FÁRMACOS ANTIADRENÉRGICOS:

Son Antagonistas Competitivos de los Fármacos Adrenérgicos a nivel de los Receptores Alfa y Beta. Hay

muchos fármacos adrenérgicos, de entre ellos:

1) Alfa Bloqueantes (o Antiadrenérgicos de los Receptores Alfa):

– Alcaloides del Cornezuelo del Centeno:

* ***Idergina*** (Antimigrañoso, Aumenta el Riego Cerebral).

– ***Yohimbina***: Poderoso fármaco Vasodilatador. Se utilizaba y se utiliza como Afrodisiaco (produce Vasodilatación Pélvica en el sexo Femenino. Es Incoloro, Inodoro e Insípido, por lo que su presencia en bebida no se nota).

2) Beta Bloqueantes (o Antiadrenérgicos de los Receptores Beta):

Tienen más importancia que los Alfa Bloqueantes. Son Antagonistas Competitivos de los Receptores Beta, por tanto actúan más a Nivel Cardíaco y Bronquial.

Efectos Farmacológicos:

SNC:

- Depresión.
- Disminución de la Presión Intraocular cuando se aplica localmente en casos de Glaucoma.
- Poderoso efecto Broncoconstrictor (por tanto, no dar nunca a enfermos de Asma).
- Disminuye notablemente las Resistencias Periféricas Vasculares (por tanto, excelentes Hipotensores).

Uterino:

- Aumenta el Tono Muscular Uterino (por tanto, no administrar a Embarazadas).

Muscular Periférico:

- Disminución de los Temblores (especialmente los asociados a Hipertiroidismo).

Indicaciones:

- Arritmias Cardíacas.
- Hipertensión.
- Glaucoma en Tratamiento Combinado.
- Arritmias No Genuinas, secundarias a Estenosis Mitral.

FÁRMACOS ANTIPSICÓTICOS O ANTIESQUIZOFRÉNICOS:

1– FÁRMACOS ANTIESQUIZOFRÉNICOS:

La Esquizofrenia es una de las enfermedades más graves de tipo psíquico, y requiere ingreso. Si está en

tratamiento, el paciente puede ir de forma ambulatoria. Cuando está en crisis puede ser peligroso para el entorno, porque pueden mostrar mucha agresividad. Uno de los fármacos más efectivos es el AROPERIDOL.

Farmacocinética:

Absorción: – Todas las Vías.

Distribución:

. – Importante Efecto Primer Paso cuando se administra por Vía Oral.

Metabolismo:

– Potente Metabolismo Hepático (por tanto severa Hepatotoxicidad).

Eliminación:

– Vía Renal.

Efectos Farmacológicos:

– Fármacos Tranquilizantes. Efecto Amansador.

– Efecto Rebote (cuando el paciente se toma la dosis está tranquilo, pero cuando se baja la dosis puede sufrir una crisis).

– Puede producir Intensa Cefalea, Hipotensión y Orotostatismo.

– Ocasionalmente, Excitación Paradójica (cuando el paciente se toma el fármaco tendría que estar tranquilo, pero no es así: la clínica se dispara).

Efectos No Deseados:

– Parkinsonismo.

– Acatisia (nerviosismo con cambios constantes de postura y emplazamiento).

– Reacciones Distónicas Agudas (posturas fijas anormales).

– Poderoso Efecto Anticolinérgico (+++):

* Sequedad Ocular.

* Aumento Presión Intraocular.

* Severa Sequedad de Boca (sobre todo en Mujeres).

* Transtornos de Evacuación Gastro-Intestinal.

* En Varones, Oclusiones a Nivel Urinario obligando a Sondaje Vesical (por tanto, en Síndrome Prostático se sonda para evitar la formación de Globo Vesical).

2- FÁRMACOS ANSIOLÍTICOS:

La Ansiedad es una enfermedad psiquiátrica benigna, caracterizada por la Sensación de Miedo o Temor frente a un Peligro en Ausencia de Peligro. Teóricamente no tiene riesgo para el entorno, pero sí para quien la padece, por tener Tendencia al Suicidio.

Características de los Fármacos Ansiolíticos:

- Producen Moderada Dependencia y Moderada Adicción.
- No deben Combinarse con Alcohol (se potencian los efectos depresores del fármaco y del alcohol).
- Tienen una Muy Acusada Tolerancia.

Efectos No Deseados:

- Hipersomnia (a dosis Medio-Altas, nunca se debe conducir ni llevar maquinaria, pues disminuyen los reflejos).
- En Hepatopatías Severas, tomar con Gran Precaución.
- No tomar Nunca con Alcohol.
- No Asociar con otros Fármacos Depresores del SNC.

3- FÁRMACOS ANTIDEPRESIVOS:

La Depresión es una enfermedad psiquiátrica severa. Condiciona la vida del paciente, pero a diferencia de la esquizofrenia, prácticamente nunca requiere ingreso hospitalario, porque casi nunca el paciente es agresivo con el entorno, pero siempre es agresivo consigo mismo (el gran riesgo del depresivo es el Suicidio).

Tipos de Depresión:

1- Exógena: Estado depresivo después de una agresión externa al individuo. Es fácil de curar y tratar, sólo requiere voluntad del individuo.

2- Endógena: Es complicada. Requiere tratamiento profundo, tanto psíquico como farmacológico. No hay depresión endógena sin motivo, el problema es saber cuál es.

3- Psicosis Maníaco-Depresivas o Ciclotimia: Ondas de estado emocional de meses o años (por temporadas estas personas ven las cosas de color rosa y otras lo ven todo negro).

4- Depresión Psicótica: Se asocia a Esquizofrenia. En este caso sí que requiere ingreso hospitalario.

Fármacos Antidepresivos:

- Inhibidores de la IMAO:

Se emplean en depresiones severas. Son euforizantes. Aumentan el Tono Vital. Son Orexígenos (favorecen el apetito). Regulan el Tono Intestinal. Provocan Severo Ortostatismo (por ser hipotensores). No deben combinarse con Tiramina. Importante Efecto Anticolinérgico.

– Antidepresivos Tricíclicos:

Son los más usados para las depresiones leves–moderadas. Aumentan espectacularmente el Tono Vital. Reinsertan en el individuo el Buen Humor (si lo tenía antes, claro). Orexígenos. Eliminan rápidamente la Tristeza. Producen excelente Control de la Micción (especialmente en casos de Eneuresis Nocturna). El máximo inconveniente que producen es el Ortostatismo. Se han de administrar con prudencia en Hepatopatías Severas Producen severísima Sequedad Bucal. Están Contraindicados en pacientes con Infarto de Miocardio.

FÁRMACOS ANTICONVULSIVANTES:

Las Convulsiones son Contracciones Tónicas o Clónicas o Tónico–Clónicas de grupos musculares bien definidos o de toda la musculatura esquelética. La enfermedad convulsiva por excelencia es la Epiléptica (o Gran Mal). También las Crisis de Ausencia (o Petit Mal). Las crisis de epilepsia se caracterizan por contracciones tónico–clónicas de todo el organismo.

Fases de la Crisis de Epilepsia:

- 1) Aura Visual: Visión de Escotomas (manchas, estrellitas...).
- 2) Crisis Epiléptica: Caída al suelo brusca, con lesiones. Contractura brutal del organismo con flexión del brazo y antebrazo, rigidez del cuerpo (Opistotonos), desviación de la mirada (focalizada al lado de la lesión), trismo (cierre de boca), babeo espectacular con saliva espumosa, pérdida de esfínteres.
- 3) Recuperación de la Crisis: No se acuerda de nada.

Tratamiento Farmacológico en Crisis Agudas:

- Barbitúricos.
- Luminal I.V.
- Benzodiazepinas.

Tratamiento Farmacológico Ambulatorio:

- Barbitúricos (especialmente en el Gran Mal).

11/5/99

1) BARBITÚRICOS:

Excelentes fármacos antiepilépticos. Múltiples acciones farmacológicas menores y alguna otra mayor. La mayor es la Anestesia y muchas veces los pacientes con convulsiones se tienen que anestesiar. A pequeñas dosis son relajantes. Acción ansiolítica. Acción hipnótica. El Thiopental Sódico (Pentotal) es el fármaco que se usaba como suero de la verdad (inhibe las inhibiciones). En según que momentos psiquiátricos, el psiquiatra puede hacer que el enfermo se abra a él con este fármaco. Severa Hepatotoxicidad. Muy estrecho intervalo terapéutico (si se pasa de rosca puede conducir a depresiones difíciles de contrarrestar). Acción depresiva sistémica. Deriva la función respiratoria, Cardiovascular (induciendo a insuficiencia cardíaca e hipotensión), digestiva (con tres puntos principales: disminución de las secreciones digestivas gástricas, alteración de la evacuación gástrica y producción de una severa constipación). Depresión del Aparato Genito–Urinario con disminución de la diuresis por Hipersecreción de la Hormona Antidiurética (ADH). Impotencia en varones y Frigidez en Mujeres. Efecto Profiláctico importante.

2) HIDANTOINAS:

Se usan de forma efectiva en el Gran Mal. Severos Hepatotóxicos. Efecto Antifólico como las Sulfamidas (pacientes con defecto de Ácido Fólico). Muchas veces pueden crear convulsiones por sí mismos (efecto paradójico).

3) ÁCIDO VALPROICO:

Se usan en Crisis de Gran Mal porque tienen efectos Secundarios menores que los anteriores. Gran inconveniente son las intensas cefaleas y diarreas explosivas que puede producir.

FARMACOLOGÍA DEL DOLOR:

– AAS.

1) Analgésicos Menores

– Paracetamol.

2) Analgésicos Mayores.

1– ANALGÉSICOS MENORES (AAS y Paracetamol):

Se absorben muy bien por Vía Oral, principalmente en las Primeras Asas (Yeyuno). Distribución por todo el organismo muy bien, después de moderado efecto primer paso. Pasa BHE. Eliminación por Riñón, una parte en Metabolitos y otra en Fármaco Activo. La Hepatotoxicidad del Paracetamol es causada por sus Metabolitos (no por el Paracetamol en sí mismo).

Acciones Farmacológicas:

Analgésicos, Antiinflamatorio (sólo el AAS), Antitérmicos (el exceso de AAS puede producir paradójicamente Hiperpirexia), Antiagregante Plaquetario (sólo el AAS. Es lo que hace que sea excelente preventivo de las trombosis intravasculares).

Efectos No Deseados:

Acción Gastrotóxica (el Paracetamol es poco agresivo, el AAS por si mismo puede ser ulcerógeno). El AAS está contraindicado en pacientes con úlcera. Una sola aspirina puede producir una hemorragia gástrica fuerte. Los dos son severos Hepatotóxicos a dosis altas. Es más tóxico el Paracetamol que el AAS. 10 mg/día de paracetamol puede conducir a Hepatitis Tóxica Fulminante. El AAS (el paracetamol poco) puede producir Nefrotoxicidad. El AAS (poco el Paracetamol) puede producir Leucopenia. El AAS no debe administrarse conjuntamente con Anticoagulantes Orales porque el AAS potencia el Anticoagulante (el Paracetamol no). El AAS potencia la acción de los Antidiabéticos Orales (El Paracetamol no).

Contraindicaciones Específicas del AAS:

- Úlcera gástrica o duodenal.
- Hepatopatía Crónica Severa.
- Nefropatía Crónica Severa.

- Diabetes tratada con Antidiabéticos Orales.
- Problemas Hemato–Vasculares tratados con Anticoagulantes.

2– ANALGÉSICOS MAYORES:

Son aquellos que se administran por diferentes vías para conseguir el bienestar del paciente. Los primeros fueron los Mórfigos.

1) DERIVADOS NATURALES DEL OPIO:

– MORFINA:

Derivado natural (alcaloide) del Opio. Potentísimo Analgésico, pero crea adicción y tolerancia. Su poder analgésico se debe a que aumenta el umbral doloroso del individuo.

Absorción:

- Todas las Vías (por Vía Oral es incompleta).
- Normalmente se administra por inyección Subcutánea o Intramuscular.

Distribución:

- Perfecta por todo el organismo.
- Atraviesa Barrera Hematoencefálica.

Metabolismo:

- Intensamente por el Hígado (por tanto produce hepatotoxicidad severa).

Eliminación: – Riñón.

Efectos Farmacológicos:

- **SNC:** Euforia, Excitación, Delirio, Sedación e Hipnosis.

– **Ocular:** Miosis (los morfinómanos cuando estan en abstinencia, tienen las pupilas en Midriasis. Darles el bolso).

- **Cardiovascular:** Bradicardia, Hipotensión.

– **Respiratorio:** Severo Broncoespasmo (hasta tal punto que si se pasa de dosis el broncoespasmo es irreversible (a esto se debe muchas muertes por sobredosis).

– **Digestivo:** No administrar cuando hay un Cólico Hepático (produce contracción de Esfínter de Oddi y agrava el cuadro). Produce muy severa Constipación. Severos Vómitos.

- **Urinario:** Retención Urinaria.

– **Genital:** Disminución de la Líbido (mantiene la erección, pero inhibe la eyaculación en el hombre).

– **Sanguíneo:** Hipercoagulabilidad con Trombosis Cerebral.

– **CODEÍNA:**

Derivado natural del opio. Excelente analgésico y antitusígeno y también antidiarreico. En dolores de entidad moderada es fármaco de elección. Combinada con AAS, obtenemos excelente efecto de Sumación alagésica. En la Diarrea importante no febril la Codina es fármaco de elección (se soluciona diarrea y el dolor colico-intestinal). Produce somnolencia.

2) DERIVADOS SEMI-SINTÉTICOS DEL OPIO:

– **HEROINA:**

Se usaba como analgésico (tiene un mono más suave que la morfina). Produce mucho bienestar al paciente.

3) DERIVADOS SINTÉTICOS DEL OPIO:

– **MEPERIDINA:**

Excelente poder analgesico, incluso a veces superior al de la Morfina. Acciones parecidas a la Morfina, pero tiene más efecto antiespasmódico que la misma y no actúa sobre el Esfínter de Oddi.

– **METADONA:**

Analgesico muy potente. Se emplea en la deshabituación de la Morfina. Administración por Vía Oral y Parenteral. Inconvenientes es que se acumula en el Hígado (por tanto, severa Hepatotoxicidad). La ventaja es que el síndrome de deshabituación es muy inferior al de la morfina y heroína por tanto se usa en deshabituación de morfina y heroína. No actúa sobre el esfínter de Oddi.

– **PENTAZOCINA:**

Excelente poder analgesico. Administración Vía Oral y Parenteral. Es importante este fármaco por tener analgesia relativamente corta, por eso es de elección en dolores agudos intensos. Moderada Hepatotoxicidad. No actúa sobre Esfínter de Oddi. Su máximo inconveniente es que produce Somnolencia y Confusión con Arteriosclerosis Cerebral.

– **BUPRENORFINA:**

Excelente poder analgésico. Vía electiva la Sublingual con efecto analgésico casi inmediato. Escasa Hepatotoxicidad y escasa acción neurológica. Solo produce cierta somnolencia. Tiene una particularidad: el llamado Efecto de Límite Máximo (por más dosis que administremos no tenemos más efecto farmacológico)

TEMA 18

"ANTIINFLAMATORIOS ESTEROIDEOS (Corticoides)"

(En clase se dan A. Esteroideos, aunque en el temario se darían los A. No Esteroideos)

Los Corticoides se sintetizan en el organismo a demanda (el cuerpo no tiene depósitos), a nivel de la Corteza Suprarrenal, a partir del Colesterol.

Grupos de Corticoides:

1- Glucocorticoides.

2- Mineralocorticoides.

3- Esteroides Sexuales.

1- GLUCOCORTICOIDES:

Acción sobre el metabolismo de los Hidratos de Carbono, Grasas y Proteínas. En Hidratos de Carbono son Sustancias Diabetógenas. Pueden producir Hiperglicemia en personas no diabéticas, y agravan seriamente una diabetes de un individuo diabético y establecen una diabetes en un individuo con una diabetes latente.

Sobre las Grasa produce acúmulos de grasa en el organismo totalmente anormales, que producen una gordura ilustre anómala. Estos acumulos aparecen en cara (cara de luna llena), cuello (giba de toro o cebú), en tronco (lo que produce un aumento de grosor del cuerpo) y en brazos y piernas produce fusión (no tienen grasa).

Sobre las proteínas, aumentan el catabolismo proteico con fusión de las masas musculares

A nivel electrolítico, retienen sodio de forma notable. Esta retención de sodio produce edemas (especialmente maleolares) que dejan fovea y pueden desencadenar HTA por aumento del contenido intravascular. La retención de Sodio va acompañada de excreción de Potasio (que produce un decaimiento físico y un estreñimiento feroz).

Tiene una acción directa sobre el moco gástrico, alterando la barrera mucosa gástrica, favoreciendo al aparición de lesiones ulcerosas, aunque no se ha demostrado que sean ulcerógenos por acción directa, sino indirectas (la acción de fármaco viene por vía sistémica, o sea, que cuando se administra por vía cutánea pueden producir úlceras gástricas).

Estos fármacos alteran notablemente las fibras colágenas y reticulares (las que mantienen la elasticidad y tono de la piel), produciendo las estrías cutáneas de color rojo (a diferencia del color blanco que tienen las estrías de las embarazadas).

A nivel de musculatura esquelética, a dosis moderadas por corto tiempo, aumenta la energía de contracción (Dopping). En dosis altas por largo tiempo, producen Atrofia Muscular (generalmente incorregible).

Como efectos negativos más importantes están la Hipertensión, Edemas Maleolares, Hipertriosis. En los Varones hace desaparecer el vello (menos en brazos y piernas).

TEMA 19

"FÁRMACOS ANTIHISTAMÍNICOS"

- HISTAMINA:

Los receptores H1 de la Histamina están en todo el organismo, pero especialmente a nivel bronquial, vascular periférico y cutáneo. Los H2, están casi exclusivamente en estómago y muy pocos en la arteria temporal.

La Histamina se sintetiza en el organismo, pero también está extendida en la naturaleza (animales y plantas).

Las células que la sintetizan son los Mastocitos o Células Cebadas de Ehrlich.

Se almacena en vesículas y se libera a demanda. La acción más potente se realiza a nivel de los receptores H1

de la Histamina:

– **A Nivel Cutáneo:** La histamina es el responsable del enrojecimiento cutáneo y de las pápulas cuando nos pica un insecto o nos pinchamos con una planta.

– **A Nivel Vascular:** Produce intensa Vasodilatación. A nivel capilar, intensa vasodilatación con enrojecimiento.

– **Anivel de Bronquios:** Broncocostricción severa. Responsable de las crisis asmáticas de origen alérgico.

– **A Nivel SNC:** Responsable de la cefalea estamínica por su poder vasodilatador.

– **A Nivel de Estómago:** Los receptores H1 son muy pocos en este nivel, pero dan lugar a un aumento muy moderado de la secreción gástrica.

CLASIFICACIÓN DE LOS FÁRMACOS ANTIHISTAMÍNICOS:

1– FÁRMACOS DE LIBERACIÓN:

Son los que actúan directamente sobre las vesículas impidiendo la ruptura de las mismas (corticoides).

2– FÁRMACOS DE ACCIÓN:

Antagonistas competitivos de la Histamina. Actúan sobre los H1, ocupándolos e impidiendo la acción de la Histamina (Adrenalina).

3– FÁRMACOS ANTAGONISTAS DE DESTRUCCIÓN:

Son las enzimas (Histaminasas) que metabolizan (destruyen) la Histamina, por tanto, impiden que se forme el complejo fármaco–receptor

ACCIONES FARMACOLÓGICAS:

Todo lo contrario que la Histamina.

FÁRMACOS ANTAGONISTAS H2 DE LA HISTAMINA:

Actúan competitivamente a nivel de los H2. Son los responsables de la secreción gástrica. Al ser los responsables, todas las enfermedades que cursan con exceso de ácido son susceptibles de ser tratadas con antagonistas H2 de la Histamina. Toda persona con Úlcera duodenal tiene exceso de ácido. El exceso de ácido crea úlcera duodenal (por tanto es como la pescadilla que se muerde la cola).

*** Cimetidina.**

*** Ramitidina y Famotidina.**

18/5/99

FÁRMACOS ANTIANGINOSOS:

Angina de Pecho:

La Angina de pecho se provoca cuando hay una falta de relación entre las necesidades de Oxígeno del Miocardio y el aporte del mismo por la SSangre, sin que necesariamente haya lesión ni trombosis coronaria. Lo que provoca la angina es el espasmo coronario.

* El Tietze se confunde con el Dolor Anginoso. El Tietze es una Osteocondritis de la articulación esterno-costal y duele siempre en este punto articular.

Tipos de Angina de Pecho:

1- De Esfuerzo: Cuando se hace un esfuerzo el corazón requiere más Oxígeno y las coronarias no son capaces de aportarlo.

2- De Reposo: Peligrosísima. Sin haber sobreesfuerzo se provoca espasmo en la coronaria y por tanto una reducción de aporte de Oxígeno.

3- Mixta: No es muy habitual.

La opresión precordial puede irradiar a la zona del Maxilar Inferior, con dolor maxilar o de muelas. Puede ser un Dolor Transfixiante (va de tórax a espalda). El dolor más frecuente es el que afecta a Brazo y Antebrazo Izquierdos.

Fármacos Antianginosos:

*** Nitratos**

Cacinitrina

*** Nitritos.**

Excelente absorción Sublingual. Fármacos de Urgencia. En 4 ó 5 segundos se nota el alivio. Como son Vasodilatadores provocan Intensa Cefalea (es el efecto secundario más importante de estos fármacos).

Efectos Farmacológicos: Dilatación Coronaria con alivio rápido del dolor, Aumento del Flujo Sanguíneo al Miocardio (por tanto, aumento de Oxígeno), Dilatación Arterial Global de todas las Arteriolas del organismo, Dilatación Venosa Global (por tanto, Disminución del Flujo de Retorno Venoso, por tanto, al aporte sanguíneo al corazón, y por tanto el esfuerzo que ha de realizar el corazón), Relajación de toda la Fibra Lisa del organismo (especialmente el Tracto Bronquial y Tubo Digestivo). Por esto, estos fármacos, además de su acción coronaria tienen efecto espasmolítico y son fármacos de urgencia en Dolores Cólicos Intestinales, Biliares y Renales.

Provocan Enrojecimiento de la cara. Ocasionalmente Náuseas. Están indicados en Anginas de Esfuerzo.

Otros Fármacos Antianginosos:

*** Bloqueantes Beta – Adrenérgicos (Propanolol):**

Excelente fármaco antiarrítmico, hipotensor y dilatador coronario. La combinación de Propanolol con Nitroglicerina (Cacinitrina) es el tratamiento ideal para el Angor de Esfuerzo.

*** Antagonistas del Calcio:**

Acción muy moderada en Angor de Esfuerzo, pero son de elección en Angor de Reposo. Reducen la Tensión

Arterial y el Gasto Cardíaco, Aumentan el Aporte de O₂ Cardíaco y Disminuyen la Frecuencia Cardíaca.

FÁRMACOS CARDIOTÓNICOS:

El fármaco prototipo es la digital. Se ha empleado como Diurético durante muchos años erróneamente. La Digital se emplea en la Insuficiencia Cardíaca. En estos casos se usa como Cardiotónico, y los Diuréticos como reguladores de líquidos del organismo. También se usan Vasodilatadores para Disminuir las Resistencias Periféricas. Tiene la Digital un peligro y es que tiene un Estrecho Intervalo Terapéutico (por tanto, puede existir Intoxicación). Excelente por Vía Oral e Intravenosa. Poco eficaz por Vía Intramuscular. Es el fármaco por excelencia en que se emplea una Dosis Inicial de Ataque y luego Dosis de Mantenimiento. Se Acumula en Hígado, Riñón y Miocardio, por eso para evitar el exceso se administra uno día a la semana y otros no, así se favorece el Vacío de Depósitos.

Metabolismo Hepático Parcial y Eliminación Renal. Acciones Farmacológicas: Aumento de la Energía de Contracción Cardíaca, Disminución de la Frecuencia Cardíaca, Aumento moderado de la Tensión Arterial. Como consecuencia de todo esto, Aumento del Flujo Glomerular Renal, como mejora de la Diuresis.

La **Intoxicación por Digital** se caracteriza por unos Signos Cardíacos y Extracardíacos:

– **Cardíacos:** Bradicardia, Taquicardias Paroxísticas (ocasionalmente), y Alteraciones del E.C.G.

– **Síntomas Extracardíacos:**

* **Digestivos:** El primer dato que orienta acerca de una intoxicación por digital son las Náuseas, Vómitos y Pérdida de Apetito.

* **Neurológicos:** Intensa Cefalea, y en personas mayores, Inestabilidad.

* **En los Varones, Ginecomastia.**

Posología de Digitálicos:

A temporadas largas, obliga a la determinación de concentración de fármaco en plasma, para regular la dosis. La dosis de Digital debe ser individualizada.

FÁRMACOS ANTIHIPERTENSIVOS Y DIURÉTICOS:

1) FÁRMACOS ANTIHIPERTENSIVOS:

La HTA de Máxima, nunca debe empezar con fármacos, sino con medidas Higiénico–Dietéticas:

- Disminución de peso.
- Deporte moderado.
- Disminución de stress.
- Eliminación de factores que impiden dormir.

Cuando la HTA es de Mínima sí hay que dar fármacos, pero unidos a las medidas Higiénico–Dietéticas.

Fármacos Antihipertensivos:

– Vasodilatadores Directos:

Luchan contra la HTA Mínima. Tdos tienen efectos secundarios.

* **Minoxidil:** Retiene Agua y Sal. Siempre tiene que añadirse un fármaco diurético para contrarrestar estos efectos. Como pomada se ha hecho servir como Crepepelo.

– Inhibidores del Sistema Renina – Angiotensina:

* **Captopril.**

* **Enalapril.**

Excelentes Hipotensores. El Captopril tiene un Efecto Secundario: Provoca Tos de Origen Central (ésta no se cura con ningún tipo de fármaco, sólo se va suspendiendo el tratamiento). Se pueden combinar con diuréticos.

* **Propanolol:**

Excelente Hipotensor. Provoca Intenso Broncoespasmo (no debe darse a Asmáticos o con tendencia a Bronquitis Crónica).

2) FÁRMACOS DIURÉTICOS:

Sirven para eliminar líquidos sobrantes del organismo. Pueden producir deshidratación. Al eliminar agua pueden eliminar solutos (imprescindibles para el funcionamiento del organismo)

Indicaciones: Edemas Cerebrales, Cardiacos, Vasculares, Anasarca (edema generalizado), Ascitis, HTA (siempre junto a fármaco hipotensor), Edemas del Síndrome Nefrótico y, Excepcionalmente y Bajo Control Médico, en Obesidad.

Fármacos Diuréticos:

1) Diuréticos Osmóticos:

Para ser un diurético osmótico el fármaco ha de cumplir los siguientes requisitos:

– Que distribuya perfectamente por todo el organismo.

– Que se elimine por filtrado glomerular.

– Que no se reabsorba por el tubo renal.

* **Manitol:**

Puede administrarse por Vía Oral e Intravenosa:

– **A través de Intravenosa** tiene efecto Diurético, no se metaboliza, y cumple los requisitos antes descritos. Provoca excelente diuresis (hasta el punto de que cuando se administra a ancianos con próstata se deben sondar porque la diuresis es tan elevada que puede provocar estallido vesical si no se sondan). Es excelente Desintoxicante. Excelente fármaco para eliminar Bilirrubinas sobrantes en caso de Hiperbilirrubinemia Tóxica.

– **A través de Via Oral**, no tiene efecto diurético porque no se absorbe por el intestino, pero sí tiene poder Laxante por su capacidad de Osmosis. Produce tremendos gases por esta vía (hasta el punto de que se habían utilizado siempre como limpieza del tracto intestinal previa a intervención y cuando se empezaron a utilizar los bisturís eléctricos, como los gases son inflamables, hubieron estallidos de colon).

2) Diuréticos Saluréticos:

Eliminan Sal. prototipo es el Seguril.

*** Seguril:** Excelente por Vía Oral e Intravenosa. Distribuye por todo el organismo. Metabolismo Hepático Parcial. Eliminación Renal. Arrastra gran cantidad de Agua por 2 mecanismos:

- Aumento del Filtrado Glomerular.
- Disminución de la Reabsorción Tubular.

Aparte de Agua, arrastra Sodio y Potasio. Por tanto, es un Diurético Kaliurético. La Hipopotasemia por Seguril (Flurosemda) provoca Esterñimientos Cruels con Dilatación Colónica por la Hipopotasemia. Si se administra Seguril junto con Digital, la Hipopotasemia favorece la Intoxicación Digitalica, por tanto, en estos casos se deben tomar Complementos de Potasio (Boi – K).

También provoca Hipocalcemia (porque arrastra Calcio), hasta el punto que en aquellas enfermedades que cursan con Hipercalemia, se administra Seguril para que el Calcio baje a niveles normales. En una persona normal, el Seguril administrado por largo tiempo puede provocar Hipocalcemia.

Otro ión que arrastra es el Magnesio. Esto provoca decaimientos en personas mayores (adinamia).

Se administran Kaliuréticos (eliminadores de Potasio) con Antikaliuréticos (ahorradores de potasio).

– Ahorradores de Potasio (Antikaliuréticos):

*** Triamtereno:** A veces provoca déficits de Ácido Fólico (no dar en pacientes con tendencia a Anemia Macrofítica).

*** Espironolactona:** No tiene Efecto Antifólico. De elección para combinar con Seguril. Cuando se administra solo se ha de ser prudente con posibles Hiperpotasemias (las cuales pueden producir parada cardíaca). La acción farmacológica no empieza hasta al cabo de 48 h., por tanto, no es fármaco de urgencia, sino de mantenimiento. También tarda unos 48 h. en dejar de hacer acción farmacológica al suprimir el fármaco.

FÁRMACOS DEL APARATO RESPIRATORIO:

– FÁRMACOS ANTITUSÍGENOS:

Encaminados a 2 vertientes:

– Tos Central (de origen reflejo).

*** Codeína:**

– Tos Periférica (la más característica es la pleural).

Cuando es de origen periférico de vías altas (faringe, por ejemplo), los fármacos son:

* **Demulgentes** (forman una película protectora sobre la región inflamada).

* **Anestésicos Locales** (en spray o aerosol).

* **Mucolíticos** (fluidifican las secreciones bronquiales).

* **Expectorantes** (el mejor es el vapor de agua).

FÁRMACOS DEL APARATO DIGESTIVO:

– FÁRMACOS ANTIULCEROSOS:

Fármacos Antiácidos:

La terapéutica alticulcerosa se inició con fármacos antiácidos y dieta láctea. Hay 2 bloques de antiácidos:

– Absorbibles:

* **Bicarbonato:** La ventaja que tiene es su rapidez. El inconveniente es que produce eructos. Administrado por largo tiempo, como se absorbe, puede producir acúmulo en el organismo. Cuando se da con leche provoca acúmulo de Calcio en organismo (favoreciendo la litiasis renal). Debe tomarse puntualmente: 2 –3 tomas, 2– 3 veces al día.

* **Fármacos Procinéticos:** Favorecen el peristaltismo del estomago y hacen que vacie el contenido ácido rápidamente. Deben darse en combinación con otros antiácidos.

– No Absorbibles (sólo tienen efecto en tracto digestivo):

* **Gelodrox:** Tiene una combinación antiácida excelente (Trisilacato de Magnesio y Hidroxido de Aluminio). Como ventaja, diremos que tiene una Potente Acción Antiácida (aunque no tanto como el Bicarbonato). Como inconveniente tiene que bloquea la absorción de algunos fármacos, por lo que ha de administrarse siempre solo.

Antiácidos de Última Generación:

* **Almagate.**

* **M – Alfadrato.**

Tienen una acción antiácida duradera. Bloquean la absorción de otros fármacos (sobretudo la Digital). Tienen como ventaja que no provocan retención de Sodio en el organismo, por tanto, son de elección en Hipertensos con Edemas y Cirróticos.

Fármacos Específicamente Antiulcerosos:

Los H₂ son los responsables de la presencia de Ácido en el Estómago. La historia de la Úlcera cambia a partir de:

* **Cimetidina** (fué el primero).

* **Ramtidina y Famotidina** (son los que han resistido el paso del tiempo).

Los 3 tienen extraordinaria eficacia como Hiposecretores, tanto de Secreción Ácida como del Volumen Global de Secreción Gástrica. Como Efectos Secundarios tenemos: Ginecomastia (en varones), Erupciones Cutáneas, Cefalea, Hepatototoxicidad.